

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 631 986**

51 Int. Cl.:

C07D 213/74 (2006.01)

C07D 401/06 (2006.01)

C07D 405/06 (2006.01)

C07D 417/06 (2006.01)

A01N 43/40 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **28.02.2013** **E 13157132 (5)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **17.05.2017** **EP 2634174**

54 Título: **Derivado heterocíclico que contiene nitrógeno que tiene un grupo 2-imino y un agente de control de plagas que lo incluye**

30 Prioridad:

29.02.2012 JP 2012043743

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

07.09.2017

73 Titular/es:

**MEIJI SEIKA PHARMA CO., LTD. (100.0%)
4-16, Kyobashi 2-chome
Chuo-ku, Tokyo 104-8002, JP**

72 Inventor/es:

**KAGABU, SHINZO;
MITOMI, MASAOKI;
KITSUDA, SHIGEKI;
HORIKOSHI, RYO;
ONOZAKI, YASUMICHI y
NAKAMURA, SATOSHI**

74 Agente/Representante:

VALLEJO LÓPEZ, Juan Pedro

ES 2 631 986 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

Derivado heterocíclico que contiene nitrógeno que tiene un grupo 2-imino y un agente de control de plagas que lo incluye

5

Antecedentes de la invención**1. Campo de la invención**

La presente invención se refiere a un derivado heterocíclico que contiene nitrógeno que tiene un grupo 2-imino y un agente de control de plagas novedoso que usa el mismo.

2. Descripción de la técnica relacionada

Aunque se han descubierto hasta ahora numerosos agentes de control de plagas, todavía se requieren fármacos novedosos en vista del problema de la reducción en la sensibilidad de los fármacos, la eficiencia a largo plazo, la seguridad durante el uso de los mismos y similares.

En particular, para el cultivo de arroz en Asia Oriental y el Sudeste de Asia, el daño por las chicharritas que han desarrollado resistencia a fármacos contra los insecticidas principales incluyendo Neonicotinoides representados por imidacloprid se está materializando y se espera una medicina específica contra las chicharras que han desarrollado resistencia a fármacos.

La solicitud de patente europea abierta n.º 432600 desvela una pluralidad de compuestos que tienen la misma estructura de anillo que un compuesto representado por la Fórmula (I), pero los compuestos se usan como herbicidas y no hay descripción sobre el control de plagas.

La solicitud de patente europea abierta n.º 268915 desvela la fórmula estructural de N-[1-((6-cloropiridin-3-il)metil)piridin-2-(1H)-iliden]-2,2,2-trifluoroacetamida, pero no hay descripción sobre el control de plagas por compuestos que tienen otras estructuras.

La solicitud de patente japonesa abierta n.º 5-783263 desvela un compuesto similar al compuesto representado por la Fórmula (I), pero el compuesto tiene una estructura diferente del compuesto de la presente invención, en que R en la fórmula (I) es un grupo acilo que tiene un anillo benceno, un grupo acilo que tiene un anillo hetero, un grupo alquilsulfonilo, un grupo alquilaminocarbonilo y un grupo alquilaminotiocarbonilo. La actividad biológica del mismo es una actividad insecticida, pero el compuesto de la presente invención no sugiere significativamente alta actividad contra un amplio intervalo de especies de insectos.

La Publicación Internacional n.º 2006/051704 desvela un compuesto similar a la Fórmula (I) de la presente invención, pero falla en desvelar específicamente el compuesto representado por la Fórmula (I) y no sugiere el contenido de la presente invención acerca de la actividad de control de plagas.

La solicitud de patente europea abierta n.º 259738 desvela una pluralidad de compuestos que tienen una estructura de anillo similar a aquella de un compuesto representado por la Fórmula (I), pero falla desvelando o sugiriendo un compuesto que tiene una estructura imino de ácido trifluoroacético.

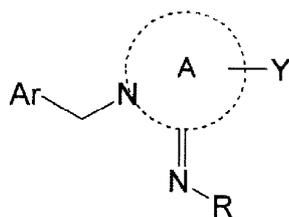
Sumario de la invención

La presente invención está diseñada para proporcionar un agente de control de plagas novedoso para solucionar problemas que tienen los químicos en la técnica relacionada, tales como reducción de la sensibilidad del fármaco, efectividad a largo plazo, seguridad durante el uso de los mismos y similares en el campo del control de plagas.

Uno de los problemas importantes en la presente invención es proporcionar un químico que tenga excelentes efectos de control de plagas contra *Nilaparvata lugens*, *Sogatella furcifera* y *Laodelphax striatella*, que se han vuelto recientemente plagas mayores en el campo de arroz, que exhiba alta actividad incluso contra chicharritas resistentes a fármacos, que reduzca la probabilidad de que los trabajadores se expongan al fármaco durante el uso del mismo tal como el tratamiento del suelo, tratamiento de semillas, tratamiento de la caja de invernadero y pueda usarse de forma segura.

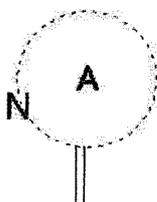
Para resolver los problemas, los presentes inventores han estudiado intensivamente, y como resultado, han descubierto que un derivado heterocíclico que contiene nitrógeno que tiene un grupo 2-imino, que está representado por la Fórmula Química (I), tiene excelente actividad como un agente de control de plagas.

Esto es, de acuerdo con la presente invención, se proporciona un agente de control de plagas que contiene un derivado heterocíclico que contiene nitrógeno que tiene un grupo 2-imino, que está representado por la siguiente Fórmula (I), o sales del mismo,

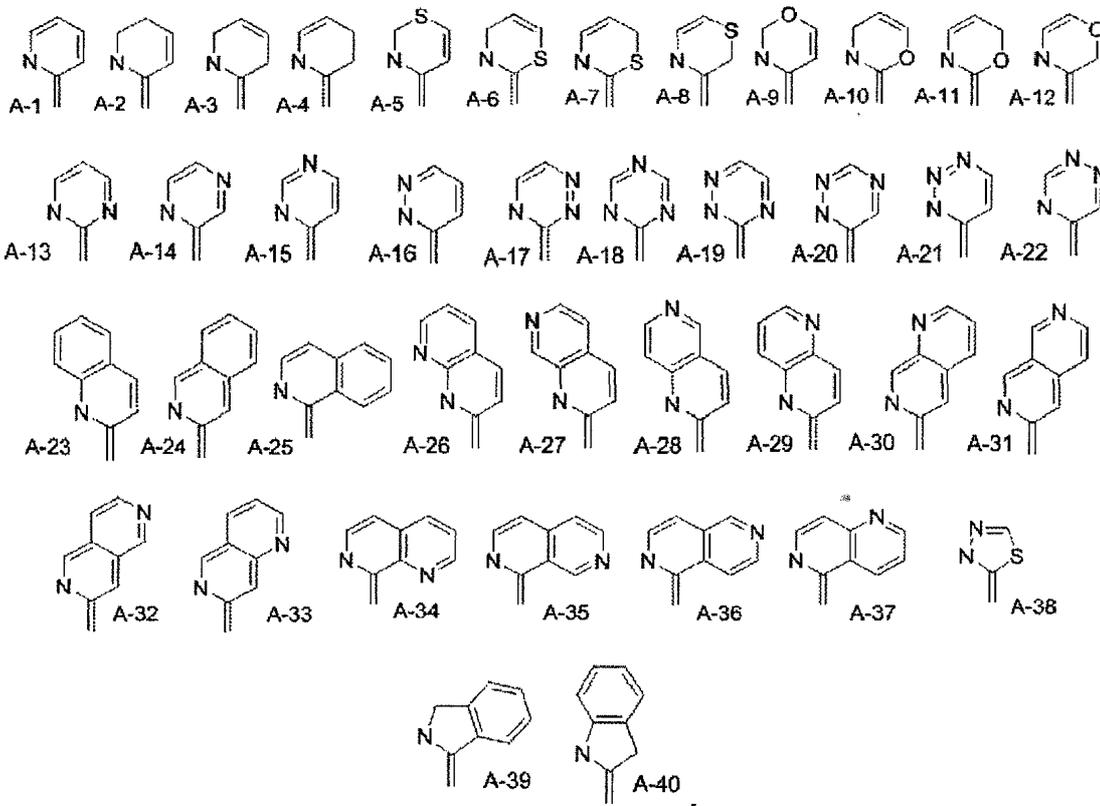


Fórmula (I) ,

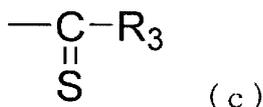
5 en la fórmula Ar representa un grupo fenilo que puede sustituirse con cualquiera de un átomo halógeno, un grupo alquilo C1 a C4 que puede estar sustituido con un átomo halógeno, un grupo alquilo C1 a C4 que puede estar sustituido con un átomo halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo ciano, un grupo nitro; un heterociclo de 5 a 6 miembros que puede sustituirse con cualquiera de un átomo halógeno, un grupo alquilo C1 a C4 que puede estar sustituido con un átomo halógeno, un grupo alquilo C1 a C4 que puede estar sustituido con un átomo halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo ciano y un grupo nitro; o un grupo heterocicloalquilo de 4 a 10 miembros, el anillo representado por la siguiente Fórmula:



representa uno cualquiera de los anillos representados por las siguientes Fórmulas (A-1) a (A-40):



25 Y representa un átomo de hidrógeno, un átomo halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo alquilo C1 a C6 que puede estar sustituido con un átomo halógeno, un grupo alquilo C1 a C6 que puede estar sustituido con un átomo halógeno, un grupo ciano o un grupo nitro, y R representa un grupo representado por la siguiente Fórmula (c)



R3 representa un grupo alquilo C1 a C6 que puede estar sustituido con un átomo halógeno.

5 Además, los compuestos indicados en las tablas 1 y 2 a continuación no se incluyen.

Tabla 1-1

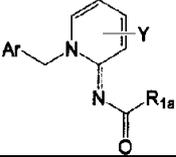
					
N.º de compuesto	Ar	R1a	Y	RMN-1H (CDCl3, δ, ppm)	IR (KBr, v, cm ⁻¹) o MS
P212	6-cloro-3-piridilo	CF3	H	5,57 (2H, s), 6,92 (1H, td), 7,31 (1H, d), 7,80 (1H, td), 7,87 (1H, dd), 7,99 (1H, dd), 8,48 (2H, m)	m/z = 316 (M+H)
P213	2-cloro-5-tiazolilo	CF3	H	5,61 (2H, s), 6,93 (1H, dd), 7,68(1H, s), 7,83 (1H, td), 7,97 (1H, d), 8,53 (1H, d)	m/z = 322 (M+H)
P214	6-cloro-3-piridilo	OCH ₃	H	3,74 (3H, s), 5,40 (2H, s), 6,45 (1H, td), 7,29 (1H, d), 7,46 (2H, m), 7,73 (1H, dd), 8,12 (1H, dd), 8,40 (1H, d)	m/z = 278 (M+H)
P215	6-cloro-3-piridilo	CF3	5-Cl	5,53 (2H, s), 7,34 (1H, d), 7,71 (1H, dd), 7,87 (1H, dd), 7,94 (1H, s), 8,49 (1H, d), 8,55 (1H, s)	m/z = 350 (M+H)
P216	6-cloro-3-piridilo	CF3	5-F	5,54 (2H,s), 7,34 (1H, d) , 7,70 (1H, m) , 7,80 (1H, m), 7,88 (1H, dd), 8,48 (1H, d), 8,64 (1H, m)	m/z = 334 (M+H)
P217	6-cloro-3-piridilo	CF3	4-Cl	5,49 (2H, s), 6,85 (1H, dd), 7,35 (1H, d), 7,76 (1H, dd), 7,85 (1H, dd), 8,44 (1H, d), 8,62 (1H, s)	m/z = 350 (M+H)
P218	2-cloro-5-tiazolilo	CF3	5-Cl	5,56 (2H, s), 7,68 (1H, s), 7,74 (1H, dd), 7,84 (1H, d), 8,58 (1H, d)	m/z = 356 (M+H)

Tabla 1-2

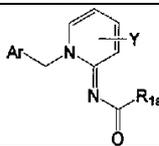
P219	2-cloro-5-tiazolilo	CF3	5-F	5,60 (2H, s), 7,69 (1H, s), 7,72 (1H, td), 7,86 (1H, m), 8,67 (1H, m)	m/z = 340 (M+H)
P220	2-cloro-5-tiazolilo	CF3	4-Cl	5,58 (2H, s), 6,90 (1H, d), 7,67 (1H, s), 7,90 (1H, d), 8,61 (1H, s)	m/z = 356 (M+H)
P221	6-cloro-3-piridilo	CF3	3-Me	2,31 (3H, s), 5,50 (2H, s), 6,98 (1H, m), 7,34 (1H, d), 7,73 (1H, dd), 7,77 (2H, m), 8,42 (1H, d)	m/z = 330 (M+H)
P222	6-cloro-3-piridilo	CF3	4-Me	2,40 (3H, S), 5,49 (2H, s), 6,70 (1H, dd), 7,32 (1H, d), 7,70 (1H, d), 7,86 (1H, dd), 8,37 (1H, s), 8,43 (1H, d)	m/z = 330 (M+H)
P223	6-cloro-3-piridilo	CF3	5-Me	2,29 (3H, s), 5,52 (2H, s), 7,32 (1H, d), 7,62 (1H, s), 7,65 (1H, dd), 7,88 (1H, dd), 8,46 (1H, d), 8,50 (1H, d)	m/z = 330 (M+H)
P224	fenilo	CF3	H	5,58 (2H, s), 6,81 (1H, m), 7,37 (4H, m), 7,77 (2H, m), 8,50 (1H, d)	m/z = 281 (M+H)
P225	4-clorofenilo	CF3	H	5,52 (2H, s), 6,85 (1H, m), 7,30 (2H, d), 7,36 (2H, d), 7,75 (1H, td), 7,84 (1H, d), 8,47 (1H, d)	m/z = 315 (M+H)

P226	3-piridilo	CF3	H	5,57 (2H, s), 6,86 (1H, m), 7,26-7,35 (2H, m), 7,78 (1H, td), 7,86 (1H, m), 8,63 (2H, m), 8,67 (1H, d)	m/z = 282 (M+H)
P227	6-cloro-5-fluoro-3-piridilo	CF3	H	5,54 (2H, s), 6,89 (1H, td), 7,76 (1H, dd), 7,80 (1H, td), 7,85 (1H, d), 8,29 (1H, d), 8,57 (1H, d)	m/z = 334 (M+H)

Tabla 1-3

P228	6-trifluorometil-3-piridilo	CF3	H	5,62 (2H, s), 6,90 (1H, t), 7,69 (1H, d), 7,81 (1H, t), 7,88 (1H, d), 8,06 (1H, d), 8,56 (1H, d), 8,78 (1H, s)	m/z = 350 (M+H)
P229	6-fluoro-3-piridilo	CF3	H	5,56 (2H, s), 6,89 (1H, td), 6,94 (1H, d), 7,79 (1H, td), 7,87 (1H, d), 8,03 (1H, m), 8,31 (1H, s), 8,54 (1H, d)	m/z = 300 (M+H)
P230	5,6-dicloro-3-piridilo	CF3	H	5,49 (2H, s), 6,89 (1H, t), 7,79-7,90 (2H, m), 8,04 (1H, d), 8,37 (1H, d), 8,56 (1H, m)	m/z = 350 (M+H)

Tabla 2-1

					
N.º de compuesto	Ar	R1a	Y	RMN-1H (CDCl3, δ, ppm)	IR (KBr, v, cm ⁻¹) o MS
P231	6-bromo-3-piridilo	CF3	H	5,52 (2H, s), 6,88 (1H, t), 7,48 (1H, 7,78 (2H, m), 7,84 (1H, d), 8,44 (1H, d), 8,53 (1H, d)	m/z = 360 (M+H)
P232	6-cloro-3-piridilo	CF3	4-F	5,52 (2H, s), 6,71 (1H, m), 7,35 (1H, d), 7,86 (1H, dd), 7,94 (1H, m), 8,33 (1H, dd), 8,44 (1H, d)	m/z = 334 (M+H)
P233	6-cloro-3-piridilo	CF3	3-F	5,53 (2H, s), 6,74 (1H, m), 7,33 (1H, d), 7,87 (1H, dd), 8,07 (1H, m), 8,29 (1H, dd), 8,45 (1H, d)	m/z = 334 (M+H)
P234	6-cloro-3-piridilo	CHCl2	H	5,54 (2H, s), 6,02 (1H, s), 6,77 (1H, t), 7,32 (1H, m), 7,69 (1H, m), 7,77 (1H, d), 7,89 (1H, m), 8,42 (1H, m), 8,49 (1H, s)	m/z = 330 (M+H)
P235	6-cloro-3-piridilo	CCl3	H	5,59 (2H, s), 6,86 (1H, t), 7,32 (1H, 7,78 (1H, td), 7,91 (2H, m), 8,43 (1H, d), 8,50 (1H, d)	m/z = 364 (M+H)
P236	6-cloro-3-piridilo	CH2Cl	H	4,17 (2H, s), 5,46 (2H, s), 6,64 (1H, td), 7,31 (1H, d), 7,60 (1H, td), 7,64 (1H, dd), 7,80 (1H, dd), 8,32 (1H, d), 8,45 (1H, d)	m/z = 296 (M+H)

5

[Tabla 2-2]

P238	6-cloro-3-piridilo	CHF2	H	5,52 (2H, s), 5,90 (1H, t), 6,79 (1H, td), 7,33 (1H, d), 7,71 (1H, m), 7,77 (1H, dd), 7,85 (1H, dd), 8,45 (1H, d), 8,50 (1H, d)	m/z = 298 (M+H)
P239	6-cloro-3-piridilo	CF2Cl	H	5,56 (2H, s), 6,92 (1H, t), 7,33 (1H, d), 7,82 (1H, m), 7,91 (1H, dd), 8,02 (1H, d), 8,45 (1H, d), 8,48 (1H, d)	m/z = 332 (M+H)
P240	6-cloro-3-piridilo	CHCl Br	H	5,53 (1H, d), 5,58 (1H, d), 6,06 (1H, s), 6,76 (1H, td), 7,32 (1H, d), 7,69 (1H, m), 7,70 (1H, m), 7,90 (1H, dd), 8,40 (1H, d), 8,50 (1H, d)	m/z = 374 (M+H)
P241	6-cloro-3-piridilo	CHBr 2	H	5,56 (2H, s), 5,99 (1H, s), 6,78 (1H, td), 7,33 (1H, d), 7,69 (1H, td), 7,76 (1H, dd), 7,93 (1H, dd), 8,39 (1H, d), 8,50 (1H, d)	m/z = 418 (M+H)

P242	6-cloro-3-piridilo	CF ₂ CF ₃	H	5,56 (2H, s), 6,90 (1H, td), 7,32 (1H, d), 7,79 (2H, m), 7,84 (1H, d), 8,43 (1H, d), 8,56 (1H, d)	m/z = 366 (M+H)
P243	2-cloro-5-pirimidinilo	CF ₃	H	5,54 (2H, s), 6,98 (1H, m), 7,87 (1H, m), 8,18 (1H, m), 8,48 (1H, m), 8,83 (2H, m)	m/z = 317 (M+H)
P244	6-cloro-3-piridilo	CH ₂ Br	H	4,17 (2H, s), 5,46 (2H, s), 6,63 (1H, td), 7,31 (1H, d), 7,60 (1H, td), 7,65 (1H, dd), 7,80 (1H, dd), 8,32 (1H, d), 8,47 (1H, d)	

Las realizaciones preferidas de la invención se listan a continuación: (2) un derivado heterocíclico que contiene nitrógeno o una sal del mismo que tiene un grupo 2-imino representado por la Fórmula (I) en (1), en la que Ar en la Fórmula (I) es un grupo 6-cloro-3-piridilo, un grupo 6-cloro-5-fluoro-3-piridilo, un grupo 6-fluoro-3-piridilo, un grupo 6-bromo-3-piridilo, un grupo 2-cloro-5-pirimidinilo, un grupo 2-cloro-5-tiazolilo o un grupo 5-cloro-2-piridinilo,

(3) un derivado heterocíclico que contiene nitrógeno o una sal del mismo que tiene un grupo 2-imino indicado bien en (1) o (2) anteriormente, en el que A en la fórmula (I) es equivalente a la fórmula (A-1) en (1), siendo Y un átomo de hidrógeno, un átomo de halógeno o un grupo ciano,

(4) un derivado heterocíclico que contiene nitrógeno o una sal del mismo que tiene un grupo 2-imino indicado en (1) anteriormente, siendo el grupo 2-imino N-[1-((6-cloropiridin-3-il)metil)piridin-2(1H)iliden]-2,2,2-trifluoroetantioamida,

(5) un agente de control de plagas que incluye un derivado heterocíclico que contiene nitrógeno que tiene un grupo 2-imino, que se describe en uno cualquiera de (1) a (4) o sales del mismo,

(6) un método no médico para controlar plagas, que usa un derivado heterocíclico que contiene nitrógeno que tiene un grupo 2-imino, que se describe en uno cualquiera de (1) a (4) o sales del mismo, o un agente de control de plagas descrito en (5),

(7) un método para controlar plagas, que incluye: tratar semillas, raíces, tubérculos, bulbos y rizomas de plantas, suelo, una solución nutriente en cultivo de solución nutriente, un medio sólido en cultivo de solución nutriente o un cuerpo sencillo que crece plantas con un derivado heterocíclico que contiene nitrógeno que tiene un grupo 2-imino, que se describe en uno cualquiera de (1) a (4) o sales del mismo, o un agente de control de plagas descrito en (5) para penetrar y migrar el compuesto hacia las plantas,

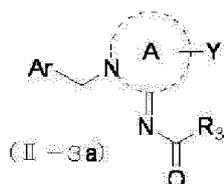
(8) un método descrito en (6) o (7), en el que la plaga es una plaga agrícola y hortícola,

(9) un método descrito en (6), en el que la plaga es una plaga parasítica animal,

(10) un método descrito en (6) a (9), en el que la plaga es una plaga resistente a fármacos,

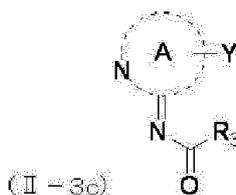
(11) un método para preparar un compuesto representado por la Fórmula (I-3) [en la fórmula, Ar, A, Y y R₃ tienen el mismo significado que aquellos definidos como Fórmula (I) en (1)],

[Fórmula Química 9]



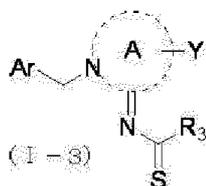
en la que se realiza una reacción de conversión de un átomo de oxígeno en el compuesto representado por la Fórmula (II-3a) [en la fórmula, Ar, A, Y y R₃ tienen el mismo significado que aquellos definidos como Fórmula (I) en (1)] o

[Fórmula Química 10]

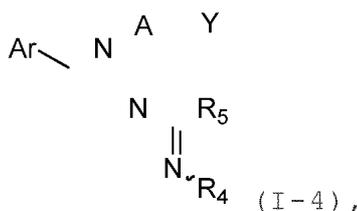


la Fórmula (II-3c) [en la fórmula, A, Y y R₃ tienen el mismo significado que aquellos definidos como Fórmula (I) en (1)]

[Fórmula Química 11]



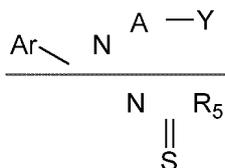
en un átomo de azufre y



5

en la que un compuesto representado por la Fórmula (II-4a):

[Fórmula Química 13]



10

Es posible realizar eficazmente un control de plagas contra polillas de la col, *Spodoptera litura*, áfidos, chicharritas, saltahojas, tisanópteros y otras plagas numerosas usando el derivado heterocíclico que contiene nitrógeno que tiene un grupo 2-imino de la presente invención.

15 **Descripción detallada de las realizaciones**

En un derivado heterocíclico que contiene nitrógeno que tiene un grupo 2-imino denotado en la fórmula (I) proporcionada en la presente invención, los ejemplos de un sustituyente que puede sustituirse con “un grupo fenilo que puede estar sustituido” y un “heterociclo de 5 a 6 miembros que puede estar sustituido”, que se representan por Ar, incluyen un átomo halógeno, un grupo alquilo C1 a C4 que puede estar sustituido con un átomo halógeno, un grupo alquilo C1 a C4 que puede estar sustituido con un átomo halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo ciano, un grupo nitro y similares, preferentemente un átomo de halógeno, un grupo trifluorometilo y un grupo ciano y en particular preferentemente un átomo halógeno.

25 Los ejemplos específicos de “un grupo fenilo que puede estar sustituido” representados por Ar de un derivado heterocíclico que contiene nitrógeno que tiene un grupo 2-imino representado por la Fórmula (I) incluyen un grupo fenilo y un grupo 3-ciano fenilo.

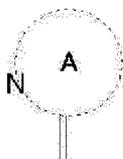
30 “Un heterociclo de 5 a 6 miembros que puede estar sustituido”, representado por Ar de un derivado heterocíclico que contiene nitrógeno que tiene un grupo 2-imino representado por la Fórmula (I) representa un heterociclo aromático de 5 a 6 miembros que incluye uno o dos de un heteroátomo tal como un átomo de oxígeno, un átomo de azufre o un átomo de nitrógeno, los ejemplos específicos de los mismos incluyen un anillo piridina, un anillo pirazina, un anillo pirimidina, un anillo piridazina, un anillo tiazol, un anillo oxazol y similares y los aspectos preferibles de los mismos incluyen un grupo 6-cloro-3-piridilo, un grupo 6-cloro-5-fluoro-3-piridilo, un grupo 6-bromo-3-piridilo, un grupo 6-fluoro-3-piridilo, un grupo 6-trifluorometil-3-piridilo, un grupo 6-cloro-3-piridazino, un grupo 5-cloro-2-pirazinilo, un grupo 2-cloro-5-pirimidinilo, un grupo 2-cloro-5-tiazolilo, un grupo 2-cloro-4-piridilo y más preferentemente un grupo 6-cloro-3-piridilo, un grupo 6-fluoro-3-piridilo, un grupo 6-cloro-5-fluoro-3-piridilo, un grupo 6-bromo-3-piridilo y un grupo 2-cloro-5-pirimidinilo.

40 Los ejemplos específicos de “un grupo heterocicloalquilo de 4 a 10 miembros” representado por Ar de un derivado hetero anillo que contiene nitrógeno que tiene un grupo 2-imino representado por la Fórmula (I) incluye un grupo 2-

tetrahidrofuranilo, un grupo 3-tetrahidrofuranilo y similares y preferentemente un grupo 3-tetrahidrofuranilo.

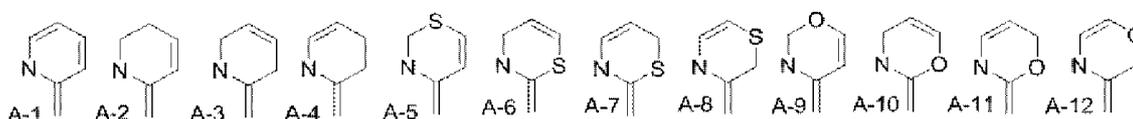
“Un heterociclo que tiene un enlace insaturado de 5 a 10 miembros que incluye uno o más átomos de nitrógeno”, cuyo A de un derivado heterocíclico que contiene nitrógeno que tiene un grupo 2-imino, que se representa por la Fórmula (I), representa, significa

[Fórmula Química 14]

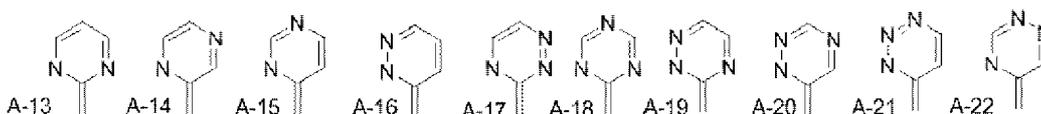


en la Fórmula (I), pero representa un anillo cualquiera representado por las siguientes Fórmulas A-1 a A-10. En cada fórmula, el final de un doble enlace es la posición de sustitución de un átomo de nitrógeno.

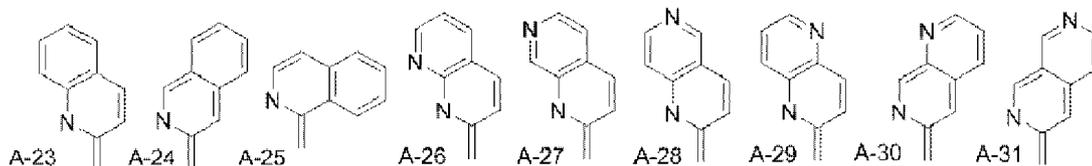
[Fórmula Química 15]



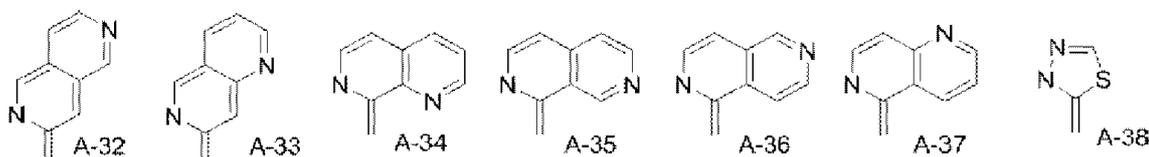
[Fórmula Química 16]



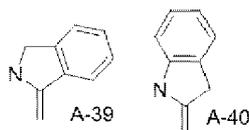
[Fórmula Química 17]



[Fórmula Química 18]



[Fórmula Química 19]



El anillo es preferentemente el anillo de Fórmulas A-1, A-13, A-14, A-15, A-16, A-23, A-25, A-38 y A-39 y más preferentemente el anillo de Fórmula A-1.

“Un grupo alquilo C1 o C6 que puede sustituirse con un átomo halógeno”, cuyo Y del derivado heterocíclico que contiene nitrógeno que tiene un grupo 2-imino, que se representa por la Fórmula (I), representa, es un grupo alquilo

C1 a C6, que está encadenado, ramificado, cíclico o combinaciones de los mismos y el límite superior del número de átomos halógenos que puede sustituirse es el número de átomos de hidrógeno que tiene el grupo alquilo. Cuando se incluye un grupo alquilo ramificado o cíclico, es obvio que el número de carbonos es 3 o más.

- 5 Los ejemplos específicos de “un grupo alquilo C1 o C6 que puede sustituirse con un átomo halógeno” que Y representa un grupo metoxi, un grupo etoxi, un grupo trifluorometiloxi y un grupo difluorometiloxi.

Un aspecto preferido de Y es preferentemente un átomo de hidrógeno o un átomo halógeno y más preferentemente un átomo de hidrógeno.

10 En la Fórmula (I), cuando R representa un grupo de Fórmula (a), “un grupo alquilo C1 a C6 sustituido” que representa R1 es un grupo alquilo que tiene 1 a 6 átomos de carbono, que está encadenado, ramificado, cíclico o combinación de los mismos, y el límite superior del número de sustituyentes sustituidos es el número de átomos de hidrógeno que tiene el grupo alquilo. Los ejemplos del sustituyente incluyen un átomo halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo ciano, un grupo nitro, un grupo fenilo (este grupo fenilo puede estar sustituido con un grupo alquilo C1 a C4 que puede estar sustituido con un halógeno, un grupo alquilo C1 a C4 que puede estar sustituido con un halógeno, un grupo hidroxilo o un átomo halógeno), un grupo fenoxi (este grupo fenoxi puede estar sustituido con un grupo alquilo C1 a C4 que puede estar sustituido con un halógeno, un grupo alquilo C1 a C4 que puede estar sustituido con un halógeno, un grupo hidroxilo o un átomo halógeno), un grupo benciloxi (el grupo fenilo en este grupo benciloxi puede estar sustituido con un grupo alquilo C1 a C4 que puede estar sustituido con un halógeno, un grupo alquilo C1 a C4 que puede estar sustituido con un halógeno, un grupo hidroxilo o un átomo halógeno) y similares. Los ejemplos específicos del sustituyente incluyen un grupo trifluorometilo, un grupo triclorometilo, un grupo difluoroclorometilo, un grupo difluorometilo, un grupo diclorometilo, un grupo dibromometilo, un grupo clorometilo, un grupo difluoroetilo, un grupo dicloroetilo, un grupo 2,2,2-trifluoroetilo, un grupo pentafluoroetilo, un grupo difluorociclopropilo, un grupo 2-cianoetilo y un grupo 2-nitroetilo y similares. Preferentemente, el grupo alquilo C1-C6 es un grupo 2,2,2-trifluoroetilo, un grupo trifluorometilo, un grupo difluoroclorometilo, un grupo difluorometilo y un grupo pentafluoroetilo y más preferentemente, el sustituyente es un grupo trifluorometilo, un grupo difluoroclorometilo, un grupo difluorometilo y un grupo pentafluoroetilo y particularmente, un grupo trifluorometilo.

30 En la Fórmula (I), “un grupo alquilo C1 a C6 que puede estar sustituido con un átomo halógeno”, cuyo R3 cuando R representa un grupo de Fórmula (c) es un grupo alquilo que tiene 1 a 6 átomos de carbono, que está encadenado, ramificado, cíclico o combinación de los mismos y el límite superior de átomos halógenos sustituidos es el número de átomos de hidrógeno que tiene el grupo alquilo. Cuando se incluye un grupo alquilo ramificado o cíclico, es obvio que el número de carbonos es 3 o más. Los ejemplos específicos del grupo alquilo C1-C6 incluyen un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo n-propilo, un grupo isopropilo, un grupo n-butilo, un grupo t-butilo, un grupo ciclopropilo, un grupo ciclohexilo, un grupo difluoroclorometilo, un grupo trifluoroclorometilo, un grupo triclorometilo, un grupo difluoroclorometilo, un grupo difluorometilo, un grupo diclorometilo, un grupo dibromometilo, un grupo clorometilo, un grupo difluoroetilo, un grupo dicloroetilo, un grupo 2,2,2-trifluoroetilo, un grupo pentafluoroetilo, un grupo difluorociclopropilo, un grupo trifluoroisopropilo y un grupo hexafluoroisopropilo y similares.

40 R3 es, preferentemente, un grupo etilo, un grupo isopropilo, un grupo ciclopropilo, un grupo trifluorometilo, un grupo difluoroclorometilo, un grupo difluorometilo, y un grupo pentafluoroetilo, más preferentemente, un grupo trifluoroclorometilo, un grupo difluoroclorometilo, un grupo difluorometilo, y un grupo pentafluoroetilo, y particularmente, un grupo trifluorometilo. R5 es, preferentemente, un grupo trifluorometilo, un grupo triclorometilo, un grupo diclorometilo, un grupo difluorometilo, un grupo difluoroclorometilo, un grupo clorometilo y un grupo pentafluoroetilo, más preferentemente, un grupo trifluorometilo, un grupo difluorometilo, un grupo difluoroclorometilo, un grupo pentafluoroetilo, y en particular preferentemente, un grupo trifluorometilo. R7 es, preferentemente, un grupo trifluorometilo, un grupo triclorometilo, un grupo diclorometilo, un grupo difluorometilo, un grupo difluoroclorometilo, un grupo clorometilo, y un grupo pentafluoroetilo, más preferentemente, un grupo trifluorometilo, un grupo difluoroclorometilo, un grupo difluorometilo, y un grupo pentafluoroetilo, y en particular preferentemente, un grupo trifluorometilo.

55 En la Fórmula (I), cuando R representa un grupo de Fórmula (b), “un grupo alquilo C1 a C6 que está sustituido con un átomo halógeno”, cuyo R2 representa un grupo alquilo que tiene 1 a 6 átomos de carbono, que está encadenado, ramificado, cíclico o combinación de los mismos y el límite superior de átomos halógenos sustituidos es el número de átomos de hidrógeno que tiene el grupo alquilo. Cuando se incluye un grupo alquilo ramificado o cíclico, es obvio que el número de carbonos es 3 o más. Los ejemplos específicos del grupo alquilo C1-C6 incluyen un grupo trifluorometilo, un grupo triclorometilo, un grupo difluoroclorometilo, un grupo difluorometilo, un grupo diclorometilo, un grupo dibromometilo, un grupo clorometilo, un grupo difluoroetilo, un grupo dicloroetilo, un grupo 2,2,2-trifluoroetilo, un grupo 1-(trifluorometil)etilo, un grupo 1-trifluorometil-2,2,2-trifluoroetilo, un grupo pentafluoroetil y un grupo difluorociclopropil y similarmente y preferentemente, el alquilo es un grupo 2,2,2-trifluoroetilo, un grupo 1-(trifluorometil)etilo, un grupo 1-trifluorometil-2,2,2-trifluoroetilo, un grupo pentafluoroetil y un grupo difluorociclopropil y similarmente y preferentemente, el alquilo es un grupo 2,2,2-trifluoroetilo, un grupo 1-(trifluorometil)etil y un grupo 1-trifluorometil-2,2,2-trifluoroetilo.

65

5 “Un grupo alqueno C2 a C6 que puede estar sustituido con un átomo halógeno”, que representa R1, R2, R3, es un grupo alqueno que tiene 2 a 6 átomos de carbono, que está encadenado, ramificado, cíclico o combinación de los mismos y el límite superior de átomos halógenos sustituidos es el número de átomos de hidrógeno que tiene el grupo alquilo. Cuando se incluye un grupo alquilo ramificado o cíclico, es obvio que el número de carbonos es 3 o más. Específicamente, el grupo alqueno C2-C6 es un grupo etenilo, un grupo 1-propenilo, un grupo 2-propenilo, un grupo 2-fluoro-1-propenilo, un grupo 2-metil-1-propenilo y similares. R6 es, preferentemente, un grupo 2-propenilo y R6a es, preferentemente, un grupo etenilo.

10 “Un grupo alquino C2 a C6 que puede estar sustituido con un átomo halógeno”, que representa R1, R2, R3, es un grupo alquino que tiene 2 a 6 átomos de carbono, que está encadenado, ramificado, cíclico o combinación de los mismos y el límite superior de átomos halógenos sustituidos es el número de átomos de hidrógeno que tiene el grupo alquilo. Cuando se incluye un grupo alquilo ramificado o cíclico, es obvio que el número de carbonos es 3 o más. Los ejemplos específicos del mismo incluyen un grupo 1-propinilo, un grupo 2-propinilo, un grupo 1-butinilo, un grupo 2-butinilo, un grupo 1-pentinilo, un grupo 2-pentinilo, un grupo 3-pentinilo y similares, y los ejemplos preferidos del mismo incluyen un grupo 1-propinilo, un grupo 2-propinilo y un grupo 2-butinilo.

20 El arilo (C6 a C10) de “un grupo arilo (C6 a C10) sustituido o no sustituido, un grupo aril (C6 a C10) alquilo (C1 a C6) sustituido o no sustituido, un grupo aril (C6 a C10) alqueno (C2 a C6) sustituido o no sustituido y un grupo aril (C6 a C10) alquino (C2 a C6) sustituido o no sustituido”, que representa R2, R3, específicamente representa un grupo fenilo y un grupo naftilo, y el grupo alquilo (C1 a C6), el grupo alqueno (C2 a C6) y el grupo alquino (C2 a C6) pueden tener una cadena recta, ramificada o de anillo. Los ejemplos del sustituyente que puede estar sustituido con un grupo arilo incluyen un átomo halógeno, un grupo alquilo C1 a C4 que puede estar sustituido con halógeno, un grupo alquilo cíclico C3 a C6, un grupo alquilo C1 a C4 que puede estar sustituido con halógeno, un grupo alquilo cíclico C3 a C6, un grupo metilsulfonilo, un grupo metoxi, un grupo nitro, un grupo ciano y similares. Los ejemplos específicos del grupo arilo (C6-C10) incluyen un grupo fenilo, un grupo bencilo, un grupo 2-feniletilo, un grupo 2-feniletlenilo, un grupo 2-feniletinilo, un grupo 4-metilfenilo, un grupo 2-cianofenilo, un grupo 3-clorofenilo, un grupo 4-metoxifenilo y un grupo 3.cianofenilo, un grupo 1,1-difenilmetilo, un grupo naftiletilo, un grupo naftilpropilo y similares y preferentemente, un grupo bencilo, un grupo 2-feniletilo, un grupo naftiletilo y un grupo naftilpropilo.

30 El grupo alquilo (C1 a C6), el grupo alqueno (C2 a C6) y el grupo alquino (C2 a C6) de “un grupo fenoxi alquilo (C1 a C6) sustituido o no sustituido, un grupo fenoxi alqueno (C2 a C6) sustituido o no sustituido y un grupo fenoxi alquino (C2 a C6) sustituido o no sustituido”, que representa R3, puede tener una cadena recta, ramificada o anillo. Los ejemplos del sustituyente que puede sustituirse con un grupo fenoxi incluyen un átomo halógeno, un grupo alquilo C1 a C4 que puede estar sustituido con halógeno, un grupo alquilo cíclico C3 a C6, un grupo metilsulfonilo, un grupo metoxi, un grupo nitro, un grupo ciano y similares. Los ejemplos específicos del grupo alquilo (C1 a C6), el grupo alqueno (C2 a C6) y el grupo alquino (C2 a C6) incluyen un grupo fenoxi, un grupo fenoximetilo, un grupo 2-feoxietilo, un grupo 2-fenoxietenilo, un grupo 2-fenoxietinilo, un grupo 4-clorofenoxi y un grupo 2-metilfenoxi y similares y preferentemente, un grupo 2-fenoxietilo.

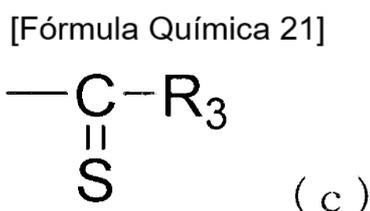
40 El heterociclo de 5 a 10 miembros de “un heterociclo de 5 a 10 miembros sustituido o no sustituido, un grupo heterociclo alquilo (C1 a C6) de 5 a 10 miembros sustituido o no sustituido, un grupo heterociclo alqueno (C2 a C6) de 5 a 10 miembros sustituido o no sustituido o un grupo heterociclo alquino (C2 a C6) de 5 a 10 miembros sustituido o no sustituido”, que representa R2, R3, representa un anillo que incluye uno a cuatro heteroátomos tales como un átomo de oxígeno, un átomo de azufre o un átomo de nitrógeno y similares como un átomo que constituye el anillo, y los ejemplos de los mismos incluyen un grupo furanilo, un grupo tienilo, un grupo piridilo, un grupo pirrolidinilo, un grupo piperidinilo, un grupo piperazinilo, un grupo pirimidinilo, un grupo morfolinilo, un grupo tiazolilo, un grupo imidazolilo, un grupo triazolilo, un grupo tetrahidrofuranilo, un grupo quinolinilo y similares. Los ejemplos del sustituyente que puede sustituirse con un heterociclo incluyen un átomo halógeno, un grupo alquilo C1 a C4 que puede estar sustituido con halógeno, un grupo alquilo cíclico C3 a C6, un grupo metilsulfonilo, un grupo metoxi, un grupo nitro, un grupo ciano y similares. El grupo alquilo (C1 a C6), el grupo alqueno (C2 a C6) y el grupo alquino (C2 a C6) pueden tener una cadena recta, ramificada o anillo. Específicamente, el heterociclo de 5 a 10 miembros es un grupo 2-piridilo, un grupo 3-piridilo, un grupo 4-piridilo, un grupo 2-piridilometilo, un grupo 3-piridilometilo, un grupo 4-piridilometilo, un grupo 2-(4-piridil)etenilo, un grupo 2-(4-piridil)etinilo, un grupo 2-furanilometilo, un grupo 2-tienilmetilo, un grupo 2-tetrahidrofuranilmetilo y similares y R4 es, preferentemente un grupo 2-piridilmetilo, un grupo 3-piridilmetilo, un grupo 4-piridilmetilo, un grupo 2-furanilmetilo, un grupo 2-tienilmetilo y un grupo 2-tetrahidrofuranilmetilo.

60 El alcoxi (C1 a C4) de “un grupo alcoxi (C1 a C4) alquilo (C1 a C5), un grupo alcoxi (C1 a C4) alqueno (C2 a C5) y un grupo alcoxi (C1 a C4) alquino (C2 a C5)”, que representa R3, representa un alquilo, alqueno y alquino (C1 a C4) que tiene una cadena recta, ramificada o anillo. Los ejemplos específicos del alcoxi (C1 a C4) incluyen un grupo metoximetilo, un grupo 2-metoxietilo, un grupo etoximetilo, un grupo 2-etoxietilo, un grupo 3-metoxi-2-propenilo y un grupo 3-metoxi-2-propinilo y similares y R4 es, preferentemente, un grupo 2-metoxietilo.

65 El alquiltio (C1 a C4) de “un grupo alquiltio (C1 a C4) alquilo (C1 a C5), un grupo alquiltio (C1 a C4) alqueno (C2 a C5) y un grupo alquiltio (C1 a C4) alquino (C2 a C5)”, que representa R3, representa un alquiltio, alqueno y alquino (C1 a C4) que tiene una cadena recta, ramificada o anillo. El alquiltio (C1 a C4) incluye un grupo

metiltiometilo, un grupo 2-metiltioetilo, un grupo etiltiometilo, un grupo 2-etiltioetilo, un grupo 3-metiltio-2-propenilo y un grupo 3-metiltio-2-propinilo y similares y R4 es, preferentemente, un grupo 2-metiltioetilo.

En un compuesto representado por la Fórmula (I),
R representa el siguiente grupo de Fórmula (c)



Ar representa un grupo 6-cloro-3-piridilo, un grupo 2-cloro-5-tiazolilo, un grupo 6-cloro-5-fluoro-3-piridilo, un grupo 6-fluoro-3-piridilo, un grupo 6-bromo-3-piridilo, un grupo 2-cloro-5-pirimidilo y un grupo 6-trifluorometil-3-piridilo,
A representa un anillo representado por A-1,

Y representa un átomo de hidrógeno y

R3 representa un grupo trifluorometilo, un grupo difluorometilo, un grupo clorodifluorometilo y un grupo pentafluoroetilo.

Los ejemplos específicos del compuesto representado por la Fórmula (I) incluyen compuestos mostrados en la siguiente Tabla A (Tablas 3 a 21) y Tabla B (Tablas 22 a 37). Los compuestos de la invención en la Tabla A son aquellos en los que R representa una combinación de sustituyentes que corresponden a las filas n.º 20 a 40, 648 y 649 a continuación de la Tabla B.

[Tabla 3-1]

Tabla A					
	N.º de compuesto	Ar	A	Y	R
Tabla 1	1-5~ 1-710	6-Cloro-3-piridilo	A-1	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de N.º (1 y 6) a continuación de la Tabla B
Tabla 2	2-1~ 2-710	2-Cloro-5-tiazolilo	A-1	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 3	3-2~ 3-710	6-Fluoro-3-piridilo	A-1	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de N.º(1 y 3) a continuación de la Tabla B
Tabla 4	4-2~ 4-710	6-Bromo-3-piridilo	A-1	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de N.º(1 y 3) a continuación de la Tabla B
Tabla 5	5-2~ 5-710	6-Cloro-5-fluoro-3-piridilo	A-1	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de N.º(1 y 3) a continuación de la Tabla B
Tabla 6	6-2~ 6-710	2-Cloro-5-pirimidinilo	A-1	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de N.º(1 y 3) a continuación de la Tabla B

[Tabla 3-2]

Tabla 7	7-1 ~7-7 10	5-Cloropirazin-2-ilo	A-1	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 8	8-1 ~8-7 10	6-Cloropiridazin-3-ilo	A-1	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 9	9-1 ~ 9-710	2-Cloro-5-oxazolilo	A-1	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

Tabla 10	10-1-10 - 710	6-trifluorometil-3-piridilo	A-1	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 11	11-1-11 - 710	3-tetrahidrofuranilo	A-1	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 12	12-1-12 - 710	2-Cloro-4-piridilo	A-1	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 13	13-1-13 - 710	3-Cianofenilo	A-1	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 14	14-1-14 - 710	6-Cloro-3-piridilo	A-1	3 F	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 15	15-1-15 - 710	2-Cloro-5-tiazolilo	A-1	3 F	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 3-3]

Tabla 16	16-1~16 - 710	6-Fluoro-3-piridilo	A-1	3 F	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 17	17-1~17 - 710	6-Bromo-3-piridilo	A-1	3 F	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 18	18-1~18 - 710	6-Cloro-5-fluoro-3-piridilo	A-1	3 F	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 19	19-1~19 - 710	2-Cloro-5-pirimidinilo	A-1	3 F	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 20	20-1~20 - 710	5-Cloropirazin-2-ilo	A-1	3 F	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 21	21-1~21 - 710	6-Cloropiridazin-3-ilo	A-1	3 F	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 22	22-1~22 - 710	2-Cloro-5-oxazolilo	A-1	3 F	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 23	23-1~23 - 710	6-trifluorometil-3-piridilo	A-1	3 F	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 24	24-1~24 - 710	3-tetrahidrofuranilo	A-1	3 F	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 3-4]

Tabla 25	25-1~25 -710	6-Cloro-3-piridilo	A-1	4 F	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 26	26-1~26 -710	2-Cloro-5-tiazolilo	A-1	4 F	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 27	27-1~27 -710	6-Fluoro-3-piridilo	A-1	4 F	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 28	28-1~28 -710	6-Bromo-3-piridilo	A-1	4 F	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 29	29-1~29 -710	6-Cloro-5-fluoro-3-piridilo	A-1	4 F	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 30	30-1~30 -710	2-Cloro-5-pirimidinilo	A-1	4 F	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 31	31-1~31 -710	5-Cloropirazin-2-ilo	A-1	4 F	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

ES 2 631 986 T3

Tabla 32	32-1~32-710	6-Cloropiridazin-3-ilo	A-1	4 F	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
----------	-------------	------------------------	-----	-----	---

[Tabla 4-1]

Tabla A					
	N.º de compuesto	Ar	A	Y	R
Tabla 33	33-1~33-710	2-Cloro-5-oxazolilo	A - 1	4-F	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 34	34-1~34-710	6-trifluorometilo-3-piridilo	A - 1	4-F	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 35	35-1~35-710	3-tetrahidrofurano	A - 1	4-F	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 36	36-1~36-710	6-Cloro-3-piridilo	A - 1	5-F	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 4-2]

Tabla 37	37-1~37-710	2-Cloro-5-tiazolilo	A 1	5-F	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 38	38-1~38-710	6-Fluoro-3-piridilo	A 1	5-F	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 39	39-1~39-710	6-Bromo-3-piridilo	A 1	5-F	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 40	40-1~40-710	6-Cloro-5-fluoro-3-piridilo	A 1	5-F	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 4-3]

Tabla 41	41-1~41-710	2-Cloro-5-pirimidinilo	A 1	5-F	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 42	42-1~42-710	5-Cloropirazin-2-ilo	A 1	5-F	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 43	43-1~43-710	6-Cloropiridazin-3-ilo	A 1	5-F	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 44	44-1~44-710	2-Cloro-5-oxazolilo	A 1	5-F	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 4-4]

Tabla 45	45-1~45-710	6-trifluorometil-3-piridilo	A 1	5-F	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 46	46-1~46-710	3-tetrahidrofurano	A 1	5-F	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

Tabla 47	47-1~4 7-710	6-Cloro-3-piridilo	A 1	6-F	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 48	48-1~4 8-710	2-Cloro-5-tiazolilo	A 1	6-F	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 4-5]

Tabla 49	49-1~4 9- 710	6-Fluoro-3-piridilo	A 1	6-F	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 50	50-1~5 0- 710	6-Bromo-3-piridilo	A 1	6-F	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 51	51-1~5 1- 710	6-Cloro-5-fluoro-3- piridilo	A 1	6-F	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 52	52-1~5 2- 710	2-Cloro-5-pirimidinilo	A 1	6-F	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 4-6]

Tabla 53	53-1~5 3- 710	5-Cloropirazin-2-ilo	A 1	6-F	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 54	54-1~5 4- 710	6-Cloropiridazin-3-ilo	A 1	6-F	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 55	55-1~5 5- 710	2-Cloro-5-oxazolilo	A 1	6-F	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 56	56-1~5 6- 710	6-trifluoromethyl-3-piridilo	A 1	6-F	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 4-7]

Tabla 57	57-1~5 7- 710	3-tetrahidrofuranoilo	A 1	6-F	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 58	58-1~5 8- 710	6-Cloro-3-piridilo	A 1	3-Cl	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 59	59-1~5 9- 710	2-Cloro-5-tiazolilo	A 1	3-Cl	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 60	60-1~6 0- 710	6-Fluoro-3-piridilo	A 1	3-Cl	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 4-8]

Tabla 61	61-1~6 1-710	6-Bromo-3-piridilo	A 1	3-Cl	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 62	62-1~6 2-710	6-Cloro-5-fluoro-3-piridilo	A 1	3-Cl	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 63	63-1~6 3- 642	2-Cloro-5-pirimidinilo	A 1	3-Cl	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 64	64-1~6 4- 710	5-Cloropirazin-2-ilo	A 1	3-Cl	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 5-1]

Tabla A					
	N.º de compuesto	Ar	A	Y	R
Tabla 65	65-1-65 -710	6-Cloropiridazin-3-ilo	A 1	3-Cl	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 66	66-1-66 -710	2-Cloro-5-oxazolilo	A 1	3-Cl	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 67	67-1-67 -710	6-trifluorometilo-3-piridilo	A 1	3-Cl	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 68	68-1-68 -710	3-tetrahidrofuranoilo	A 1	3-Cl	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 69	69-1-69 -710	6-Cloro-3-piridilo	A 1	4-Cl	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 70	70-1-70 -710	2-Cloro-5-tiazolilo	A 1	4-Cl	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 71	71-1~71 -710	6-Fluoro-3-piridilo	A 1	4-Cl	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 5-2]

Tabla 72	72-1~72 - 710	6-Bromo-3-piridilo	A 1	4-Cl	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 73	73-1~73 - 710	6-Cloro-5-fluoro-3-piridilo	A 1	4-Cl	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 74	74-1~ 74 - 710	2-Cloro-5-pirimidinilo	A 1	4-Cl	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 75	75-1~75 - 710	5-Cloropirazin-2-il	A 1	4-Cl	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 76	76-1~76 - 710	6-Cloropiridazin-3-il	A 1	4-Cl	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 77	77-1~77 - 710	2-Cloro-5-oxazolilo	A 1	4-Cl	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 78	78-1~78 - 710	6-trifluorometil-3-piridil	A 1	4-Cl	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

ES 2 631 986 T3

Tabla 79	79-1~79 - 710	3-tetrahidrofurano	A 1	4-Cl	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 80	80-1~80 - 710	6-Cloro-3-piridilo	A 1	5-Cl	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 5-3]

Tabla 81	81-1~81 - 710	2-Cloro-5-tiazolilo	A 1	5-Cl	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 82	82-1~82 - 710	6-Fluoro-3-piridilo	A 1	5-Cl	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 83	83-1~83 - 710	6-Bromo-3-piridilo	A 1	5-Cl	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 84	84-1~84 - 710	6-Cloro-5-fluoro-3-piridilo	A 1	5-Cl	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 85	85-1~85 - 710	2-Cloro-5-pirimidinilo	A 1	5-Cl	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 86	86-1~86 - 710	5-Cloropirazin-2-il	A 1	5-Cl	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 87	87-1~87 - 710	6-Cloropiridazin-3-il	A 1	5-Cl	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 88	88-1~88 - 710	2-Cloro-5-oxazolilo	A 1	5-Cl	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 89	89-1 - 89-710	6-trifluorometilo-3-piridilo	A 1	5-Cl	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 5-4]

Tabla 90	90-1~90 - 710	3-tetrahidrofurano	A 1	5-Cl	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 91	91~1~91 - 710	6-Cloro-3-piridilo	A 1	6-Cl	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 92	92-1~ 92 - 710	2-Cloro-5-tiazolilo	A 1	6-Cl	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 93	93-1~93 - 710	6-Fluoro-3-piridilo	A 1	6-Cl	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 94	94-1~ 94 - 710	6-Bromo-3-piridilo	A 1	6-Cl	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 95	95-1~95 - 710	6-Cloro-5-fluoro-3-piridilo	A 1	6-Cl	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 96	96-1~96 - 710	2-Cloro-5-pirimidinilo	A 1	6-Cl	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 6-1]

Tabla A					
	N.º de compuesto	Ar	A	Y	R
Tabla 97	97-1-97 - 710	5-Cloropirazin-2-ilo	A-1	6-Cl	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

Tabla 98	98-1-98 -710	6-Cloropiridazin-3-ilo	A-1	6-Cl	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 99	99-1~99 -710	2-Cloro-5-oxazolilo	A-1	6-Cl	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 100	100-1~1 00-710	6-trifluorometil-3-piridilo	A-1	6-Cl	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 101	101-1~1 01-710	3-tetrahidrofuranilo	A-1	6-Cl	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 102	102-1-1 02-710	6-Cloro-3-piridilo	A-1	3-CN	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 103	103-1-1 03-710	2-Cloro-5-tiazolilo	A-1	3-CN	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 104	104-1-1 04-710	6-Fluoro-3-piridilo	A-1	3-CN	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 6-2]

Tabla 105	105-1~1 05-710	6-Bromo-3-piridilo	A-1	3-CN	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 106	106-1~1 06-710	6-Cloro-5-fluoro-3-piridilo	A-1	3-CN	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 107	107-1~1 07-710	2-Cloro-5-pirimidinilo	A-1	3-CN	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 108	108-1~1 08-710	5-Cloropirazin-2-ilo	A-1	3-CN	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 109	109-1~1 09-710	6-Cloropiridazin-3-ilo	A-1	3-CN	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 110	110-1~1 10-710	2-Cloro-5-oxazolilo	A-1	3-CN	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 111	111-1~1 11~710	6-trifluorometil-3-piridilo	A-1	3-CN	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 112	112-1~1 12-710	3-tetrahidrofuranilo	A-1	3-CN	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 113	113-1~1 13-710	6-Cloro-3-piridilo	A-1	4-CN	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 6-3]

Tabla 114	114-1~1 14-710	2-Cloro-5-tiazolilo	A1	4-CN	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 115	115-1~1 15-710	6-Fluoro-3-piridilo	A-1	4-CN	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 116	116-1-1 16-710	6-Bromo-3-piridilo	A-1	4-CN	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

Tabla 117	117-1~1 17-710	6-Cloro-5-Fluoro-3-piridilo	A-1	4-CN	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 118	118-1~1 18-710	2-Cloro-5-pirimidinilo	A-1	4-CN	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 119	119-1-1 19-710	5-Cloropirazin-2-ilo	A-1	4-CN	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 120	120-1-1 20-710	6-Cloropiridazin-3-ilo	A-1	4-CN	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 121	121-1~1 21-710	2-Cloro-5-oxazolilo	A-1	4-CN	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 122	122-1~1 22-710	6-trifluorometil-3-piridilo	A-1	4-CN	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 6-4]

Tabla 123	123-1~1 23-710	3-tetrahidrofurano	A-1	4-CN	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 124	124-1~1 24-710	6-Cloro-3-piridilo	A-1	5-CN	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 125	125-1~1 55-710	2-Cloro-5-tiazolilo	A-1	5-CN	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 126	126-1~1 26-710	6-Fluoro-3-piridilo	A-1	5-CN	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 127	127-1~1 27-710	6-Bromo-3-piridilo	A-1	5-CN	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 128	128-1~1 28-710	6-Cloro-5-fluoro-3-piridilo	A-1	5-CN	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 7-1]

Tabla A					
	N.º de compuesto	Ar	A	Y	R
Tabla 129	129-1-1 29-710	2-Cloro-5-pirimidinilo	A-1	5-CN	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 130	130-1-1 30-710	5-Cloropirazin-2-ilo	A-1	5-CN	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 131	131-1~1 31-710	6-Cloropiridazin-3-ilo	A-1	5-CN	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 7-2]

Tabla 132	132-1~1 32-710	2-Cloro-5-oxazolilo	A-1	5-CN	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 133	133-1~1 33-710	6-trifluorometil-3-piridilo	A-1	5-CN	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 134	134-1~1 34-710	3-tetrahidrofurano	A-1	5-CN	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 135	135-1~1 35-710	6-Cloro-3-piridilo	A-1	6-CN	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 7-3]

Tabla 136	136-1~1 36-710	2-Cloro-5-thiazolilo	A-1	6-CN	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 137	111-1~1 37-710	6-Fluoro-3-piridilo	A-1	6-CN	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 138	138-1~1 38-710	6-Bromo-3-piridilo	A-1	6-CN	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 139	139-1~1 39-710	6-Cloro-5-fluoro-3-piridilo	A-1	6-CN	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 7-4]

Tabla 140	140-1~14071 0	2-Cloro-5-pirimidinilo	A-1	6-CN	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 141	141-1~1 41-710	5-Cloropirazin-2-ilo	A-1	6-CN	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 142	142-1~1 42-710	6-Cloropiridazin-3-ilo	A-1	6-CN	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 143	143-1~1 43-710	2-Cloro-5-oxazolilo	A-1	6-CN	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 7-5]

Tabla 144	144-1~1 44-710	6-trifluorometilo-3-piridilo	A-1	6-CN	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 145	145-1~1 45-710	3-tetrahidrofuranoilo	A-1	6-CN	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 146	146-1~1 46-710	6-Cloro-3-piridilo	A-1	3-OH	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 147	147-1~1 47-710	2-Cloro-5-tiazolilo	A-1	3-OH	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 7-6]

Tabla 148	148-1~1 48-710	6-Fluoro-3-piridilo	A-1	3-OH	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 149	149-1~1 49-710	6-Bromo-3-piridilo	A-1	3-OH	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 150	150-1~1 50-710	6-Cloro-5-Fluoro-3-piridilo	A-1	3-OH	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 151	151-1~1 51-710	2-Cloro-5-pirimidinilo	A-1	3-OH	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 7-7]

Tabla 152	152-1~1 52-710	5-Cloropirazin-2-ilo	A-1	3-OH	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 153	153-1~1 53-710	6-Cloropiridazin-3-ilo	A-1	3-OH	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 154	154-1~1 54-710	2-Cloro-5-oxazolilo	A-1	3-OH	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

Tabla 155	155-1~1 55-710	6-trifluorometil-3-piridilo	A-1	3-OH	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
-----------	-------------------	-----------------------------	-----	------	---

[Tabla 7-8]

Tabla 156	156-1~1 56-710	3-tetrahidrofuranilo	A-1	3-OH	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 157	157-1~1 57-710	6-Cloro-3-piridilo	A-1	4-OH	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 158	158-1~1 58-710	2-Cloro-5-tiazolilo	A-1	4-OH	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 159	159-1~1 59-710	6-Fluoro-3-piridilo	A-1	4-OH	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 7-9]

Tabla 160	111-1 1~ 60-710	6-Bromo-3-piridilo	A-1	4-OH	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
-----------	-----------------------	--------------------	-----	------	---

[Tabla 8-1]

Tabla A					
	N.º de compuesto	Ar	A	Y	R
Tabla 161	161-1~1 61-710	6-Cloro-5-fluoro-3-piridilo	A-1	4-OH	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 162	162-1~1 62-710	2-Cloro-5-pirimidinilo	A-1	4-OH	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 163	163-1~1 63-710	5-Cloropirazin-2-ilo	A-1	4-OH	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 164	164-1~1 64-710	6-Cloropiridazin-3-ilo	A-1	4-OH	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 165	165-1~1 65-710	2-Cloro-5-oxazolilo	A-1	4-OH	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 166	166-1~1 66-710	6-trifluorometil-3-piridilo	A-1	4-OH	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 8-2]

Tabla 167	167-1-1 67-710	3-tetrahidrofuranilo	A-1	4-OH	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 168	168-1-1 68-710	6-Cloro-3-piridilo	A-1	5-OH	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 169	169-1-1 69-710	2-Cloro-5-tiazolilo	A-1	5-OH	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 170	170-1-1 70-710	6-Fluoro-3-piridilo	A-1	5-OH	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

ES 2 631 986 T3

Tabla 171	171-1-1 71-710	6-Bromo-3-piridilo	A-1	5-OH	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 172	172-1-1 72-710	6-Cloro-5-fluoro-3-piridilo	A-1	5-OH	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 173	173-1-1 73-710	2-Cloro-5-pirimidinilo	A-1	5-OH	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 8-3]

Tabla 174	174-1-1 74-710	5-Cloropirazin-2-ilo	A-1	5-OH	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 175	175-1-1 75-710	6-Cloropiridazin-3-ilo	A-1	5-OH	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 176	176-1-1 76-710	2-Cloro-5-oxazolilo	A-1	5-OH	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 177	177-1-7 7-710	6-trifluorometil-3-piridilo	A-1	5-OH	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 178	178-1-1 78-710	3-tetrahidrofuranilo	A-1	5-OH	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 179	179-1-1 79-710	6-Cloro-3-piridilo	A-1	6-OH	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 180	180-1-1 80-710	2-Cloro-5-tiazolilo	A-1	6-OH	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 8-4]

Tabla 181	181-1-1 81-710	6-Fluoro-3-piridilo	A-1	6-OH	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 182	182-1-1 82-710	6-Bromo-3-piridilo	A-1	6-OH	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 183	183-1-1 83-710	6-Cloro-5-fluoro-3-piridilo	A-1	6-OH	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 184	184-1-1 84-710	2-Cloro-5-pirimidinilo	A-1	6-OH	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 185	185-1-1 85-710	5-Cloropirazin-2-ilo	A-1	6-OH	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 186	186-1-1 86-710	6-Cloropiridazin-3-ilo	A-1	6-OH	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 187	187-1-1 87-710	2-Cloro-5-oxazolilo	A-1	6-OH	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 8-5]

Tabla 188	188-1-1 88-710	6-trifluorometil-3-piridilo	A-1	6-OH	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 189	189-1-1 89-710	3-tetrahidrofuranilo	A-1	6-OH	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 190	190-1-1 90-710	6-Cloro-3-piridilo	A-1 3	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 191	191-1-1 91-710	2-Cloro-5-tiazolilo	A-1 3	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

ES 2 631 986 T3

Tabla 192	192-1- 92-710	6-Fluoro-3-piridilo	A-1 3	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
-----------	---------------	---------------------	----------	---	---

[Tabla 9-1]

Tabla A					
	N.º de compuesto	Ar	A	Y	R
Tabla 193	193-1-1 93-710	6-Bromo-3-piridilo	A-13	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 194	194-1-1 94-710	6-Cloro-5-fluoro-3-piridilo	A-13	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 195	195-1-1 95-710	2-Cloro-5-pirimidinilo	A-13	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 196	196-1-1 96-710	5-Cloropirazin-2-ilo	A-13	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 197	197-1-1 97-710	6-Cloropiridazin-3-ilo	A-13	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 198	198-1-1 98-710	2-Cloro-5-oxazolilo	A-13	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 9-2]

Tabla 199	199-1 1 99-710	6-trifluorometil-3-piridilo	A-13	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 200	200-1 - 2 00-710	3-tetrahidrofuranilo	A-13	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 201	201-1 - 2 01-710	6-Cloro-3-piridilo	A-14	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 202	202-1 - 2 02-710	2-Cloro-5-tiazolilo	A-14	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 203	203-1 - 2 03-710	6-Fluoro-3-piridilo	A-14	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 204	204-1 2 04-710	6-Bromo-3-piridilo	A-14	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 205	205-1 - 2 05-710	6-Cloro-5-fluoro-3-piridilo	A-14	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 9-3]

Tabla 206	206-1-2 06-710	2-Cloro-5-pirimidinilo	A-14	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 207	207-1-2 07-710	5-Cloropirazin-2-ilo	A-14	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 208	208-1-2 08-710	6-Cloropiridazin-3-ilo	A-14	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 209	209-1-2 09-710	2-Cloro-5-oxazolilo	A-14	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 210	210-1-2 10-710	6-trifluorometil-3-piridilo	A-14	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 211	211-1-2 11-710	3-tetrahidrofuranoilo	A-14	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 212	212-1-2 12-710	6-Cloro-3-piridilo	A-15	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 9-4]

Tabla 213	213-1-2 13-710	2-Cloro-5-tiazolilo	A-15	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 214	214-1-2 14-710	6-Fluoro-3-piridilo	A-15	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 215	215-1-2 15-710	6-Bromo-3-piridilo	A-15	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 216	216-1-2 16-710	6-Cloro-5-fluoro-3-piridilo	A-15	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 217	217-1-2 17-710	2-Cloro-5-pirimidinilo	A-15	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 218	218-1-2 18-710	5-Cloropirazin-2-ilo	A-15	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 219	219-1-2 19-710	6-Cloropiridazin-3-ilo	A-15	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 9-5]

Tabla 220	220-1 - 2 20-710	2-Cloro-5-oxazolilo	A-15	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 221	221-1 - 2 21-710	6-trifluorometil-3-piridilo	A-15	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 222	222-1 - 2 22-710	3-tetrahidrofuranoilo	A-15	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 223	223-1 - 2 23-710	6-Cloro-3-piridilo	A-16	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 224	224-1 - 2 24-710	2-Cloro-5-tiazolilo	A-16	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 10-1]

Tabla A					
	N.º de compuesto	Ar	A	Y	R
Tabla 225	225-1-22 5-710	6-Fluoro-3-piridilo	A-16	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 226	226-1-22 6-710	6-Bromo-3-piridilo	A-16	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 227	227-1-22 7-710	6-Cloro-5-fluoro-3-piridilo	A-16	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 228	228-1-22 8-710	2-Cloro-5-pirimidinilo	A-16	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 229	229-1-22 9-710	5-Cloropirazin-2-ilo	A-16	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 230	230-1-23 0-710	6-Cloropiridazin-3-ilo	A-16	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 10-2]

Tabla 231	231-1 - 23 1-710	2-Cloro-5-oxazolilo	A-16	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 232	232-1 - 23 2-710	6-trifluorometil-3-piridilo	A-16	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 233	233-1 - 23 3-710	3-tetrahidrofurano	A-16	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 234	234-1 23 4-710	6-Cloro-3-piridilo	A-2	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 235	235-1 - 23 5-710	6-Cloro-3-piridilo	A-3	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 236	236-1 - 23 6-710	6-Cloro-3-piridilo	A-4	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 237	237-1 - 23 7-710	6-Cloro-3-piridilo	A-5	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 10-3]

Tabla 238	238-1-23 8- 710	6-Cloro-3-piridilo	A-6	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 239	239-1-23 9- 710	6-Cloro-3-piridilo	A-7	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

Tabla 240	240-1-24 0-710	6-Cloro-3-piridilo	A-8	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 241	241-1-24 1-710	6-Cloro-3-piridilo	A-9	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 242	242-1-24 2-710	6-Cloro-3-piridilo	A-10	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 243	243-1-24 3-710	6-Cloro-3-piridilo	A-11	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 244	244-1-24 4-710	6-Cloro-3-piridilo	A-12	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 10-4]

Tabla 245	245-1-24 5-710	6-Cloro-3-piridilo	A-17	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 246	246-1-24 6-710	6-Cloro-3-piridilo	A-18	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 247	247-1-24 7-710	6-Cloro-3-piridilo	A-19	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 248	248-1-24 8-710	6-Cloro-3-piridilo	A-20	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 249	249-1-24 9-710	6-Cloro-3-piridilo	A-21	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 250	250-1 -25 0-710	6-Cloro-3-piridilo	A-22	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 251	251-1 -25 1-710	6-Cloro-3-piridilo	A-23	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 10-5]

Tabla 252	252-1 -25 2-710	6-Cloro-3-piridilo	A-24	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 253	253-1 -25 3-710	6-Cloro-3-piridilo	A-25	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 254	254-1-25 4-710	6-Cloro-3-piridilo	A-26	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 255	255-1 -25 5-710	6-Cloro-3-piridilo	A-27	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 256	256-1 -25 6-710	6-Cloro-3-piridilo	A-28	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 11-1]

Tabla A					
	N.º de compuesto	Ar	A	Y	R
Tabla 257	257-1-25 7-710	6-Cloro-3-piridilo	A-2 9	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 258	258-1-25 8-710	6-Cloro-3-piridilo	A-3 0	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 259	259-1-25 9-710	6-Cloro-3-piridilo	A-3 1	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

ES 2 631 986 T3

Tabla 260	260-1~26 0-710	6-Cloro-3-piridilo	A-3 2	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 261	261-1~26 1-710	6-Cloro-3-piridilo	A-3 3	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 262	262-1~26 2-710	6-Cloro-3-piridilo	A-3 4	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 11-2]

Tabla 263	263-1~26 3-710	6-Cloro-3-piridilo	A-3 5	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 264	264-1~26 4-710	6-Cloro-3-piridilo	A-3 6	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 265	265-1~26 5-710	6-Cloro-3-piridilo	A-3 7	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 266	266-1~26 6-710	6-Cloro-3-piridilo	A-3 8	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 267	267-1~26 7-710	6-Cloro-3-piridilo	A-3 9	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 268	268-1~26 8-710	6-Cloro-3-piridilo	A-4 0	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 269	269-1~26 9-710	6-Cloro-3-piridilo	A-2	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 11-3]

Tabla 270	270-1 -27 0-710	6-Cloro-3-piridilo	A-3	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 271	271-1 -27 1-710	6-Cloro-3-piridilo	A-4	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 272	272-1 -27 2-710	6-Cloro-3-piridilo	A-5	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 273	273-1-27 3-710	6-Cloro-3-piridilo	A-6	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 274	274-1 -27 4-710	6-Cloro-3-piridilo	A-7	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 275	275-1 -27 5-710	6-Cloro-3-piridilo	A-8	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 276	276-1-27 6-710	6-Cloro-3-piridilo	A-9	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 11-4]

Tabla 277	277-1-27 7-710	6-Cloro-3-piridilo	A-1 0	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 278	278-1 -27 8-710	6-Cloro-3-piridilo	A-1 1	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 279	279-1 -27 9-710	6-Cloro-3-piridilo	A-1 2	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 280	280-1-28 0-710	6-Cloro-3-piridilo	A-1 7	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

ES 2 631 986 T3

Tabla 281	281-1 -28 1-710	6-Cloro-3-piridilo	A-1 8	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 282	282-1 -28 2-710	6-Cloro-3-piridilo	A-1 9	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 283	283-1 -28 3-710	6-Cloro-3-piridilo	A-2 0	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 11-5]

Tabla 284	284-1 -28 4-710	6-Cloro-3-piridilo	A-2 1	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 285	285-1 -28 5-710	6-Cloro-3-piridilo	A-2 2	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 286	286-1-28 6-710	6-Cloro-3-piridilo	A-2 3	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 287	287-1 -28 7-710	6-Cloro-3-piridilo	A-2 4	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 288	288-1 -28 8-710	6-Cloro-3-piridilo	A-2 5	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 12-1]

Tabla A					
	N.º de compuesto	Ar	A	Y	R
Tabla 289	289-1-28 9-710	6-Cloro-3-piridilo	A-2 6	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 290	290-1-29 0-710	6-Cloro-3-piridilo	A-2 7	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 291	291-1-29 1-710	6-Cloro-3-piridilo	A-2 8	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 292	292-1-29 2-710	6-Cloro-3-piridilo	A-2 9	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 293	293-1-29 3-710	6-Cloro-3-piridilo	A-3 0	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 294	294-1-29 4-710	6-Cloro-3-piridilo	A-3 1	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 12-2]

Tabla 295	295-1 -29 5-710	6-Cloro-3-piridilo	A-3 2	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 296	296-1 -29 6-710	6-Cloro-3-piridilo	A-3 3	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 297	297-1 -29 7-710	6-Cloro-3-piridilo	A-3 4	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 298	298-1-29 8-710	6-Cloro-3-piridilo	A-3 5	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 299	299-1 -29 9-710	6-Cloro-3-piridilo	A-3 6	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 300	300-1-30 0-710	6-Cloro-3-piridilo	A-3 7	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

ES 2 631 986 T3

Tabla 301	301-1-30 1-710	6-Cloro-3-piridilo	A-3 8	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
-----------	----------------	--------------------	-------	---	---

[Tabla 12-3]

Tabla 302	302-1-30 2-710	6-Cloro-3-piridilo	A-3 9	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 303	303-1-30 3-710	6-Cloro-3-piridilo	A-4 0	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 304	304-1-30 4-710	6-Cloro-3-piridilo	A-2	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 305	305-1-30 5-710	6-Cloro-3-piridilo	A-3	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 306	306-1-30 6-710	6-Cloro-3-piridilo	A-4	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 307	307-1-30 7-710	6-Cloro-3-piridilo	A-5	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 308	308-1-30 8-710	6-Cloro-3-piridilo	A-6	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 12-4]

Tabla 309	309-1-30 9-710	6-Cloro-3-piridilo	A-7	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 310	310-1-31 0-710	6-Cloro-3-piridilo	A-8	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 311	311-1-31 1-710	6-Cloro-3-piridilo	A-9	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 312	312-1-31 2-710	6-Cloro-3-piridilo	A-1 0	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 313	313-1-31 3-710	6-Cloro-3-piridilo	A-1 1	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 314	314-1-31 4-710	6-Cloro-3-piridilo	A-1 2	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 315	315-1-31 5-710	6-Cloro-3-piridilo	A-1 7	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 12-5]

Tabla 316	316-1-31 6-710	6-Cloro-3-piridilo	A-1 8	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 317	317-1-31 7-710	6-Cloro-3-piridilo	A-1 9	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 318	318-1-31 8-710	6-Cloro-3-piridilo	A-2 0	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 319	319-1-31 9-710	6-Cloro-3-piridilo	A-2 1	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 320	320-1-32 0-710	6-Cloro-3-piridilo	A-2 2	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 13-1]

Tabla A					
	N.º de compuesto	Ar	A	Y	R
Tabla 321	321-1-3 21-710	6-Cloro-3-piridilo	A-2 3	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 322	322-1-3 22-710	6-Cloro-3-piridilo	A-2 4	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 323	323-1-3 23-710	6-Cloro-3-piridilo	A-2 5	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 324	324-1-3 24-710	6-Cloro-3-piridilo	A-2 6	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 13-2]

Tabla 325	325-1 -3 25-710	6-Cloro-3-piridilo	A-2 7	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 326	326-1-3 26-710	6-Cloro-3-piridilo	A-2 8	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 327	327-1-3 27-710	6-Cloro-3-piridilo	A-2 9	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 328	328-1-3 28-710	6-Cloro-3-piridilo	A-3 0	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 13-3]

Tabla 329	329-1 -3 29-710	6-Cloro-3-piridilo	A-3 1	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 330	330-1-3 30-710	6-Cloro-3-piridilo	A-3 2	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 331	331-1-3 31-710	6-Cloro-3-piridilo	A-3 3	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 332	332-1-3 32-710	6-Cloro-3-piridilo	A-3 4	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 13-4]

Tabla 333	333-1-3 33-710	6-Cloro-3-piridilo	A-3 5	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 334	334-1- 3 34-710	6-Cloro-3-piridilo	A-3 6	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 335	335-1-3 35-710	6-Cloro-3-piridilo	A-3 7	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 336	336-1-3 36-710	6-Cloro-3-piridilo	A-3 8	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 13-5]

Tabla 337	337-1-3 37-710	6-Cloro-3-piridilo	A-3 9	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 338	338-1-3 38-710	6-Cloro-3-piridilo	A-4 0	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 339	339-1-3 39-710	2-Cloro-5-tiazolilo	A-2	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

ES 2 631 986 T3

Tabla 340	340-1-3 40-710	3-Trifluorometilfenilo	A-3	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
-----------	----------------	------------------------	-----	---	---

[Tabla 13-6]

Tabla 341	341-1 3 41-710	2-Metilfenilo	A-4	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 342	342-1 3 42-710	3-Metilfenilo	A-5	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 343	343-1 3 43-710	4-Metilfenilo	A-6	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 344	344-1 3 44-710	4-Trifluorometilfenilo	A-7	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 13-7]

Tabla 345	345-1 - 3 45-710	2-Trifluorometilfenilo	A-8	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 346	346-1 - 3 46-710	2-Metoxifenilo	A-9	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 347	347-1 3 47-710	3-Metoxifenilo	A-10	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 348	348-1 - 3 48-710	4-Metoxifenilo	A-11	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 13-8]

Tabla 349	349-1-3 49-710	2-Cianofenilo	A-12	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 350	350-1-3 50-710	3-Cianofenilo	A-17	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 351	351-1-3 51-710	4-Cianofenilo	A-18	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 352	352-1-3 52-710	2-Nitrofenilo	A-19	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 14-1]

Tabla A					
	N.º de compuesto	Ar	A	Y	R
Tabla 353	353-1-3 53-710	3-Nitrofenilo	A-20	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 354	354-1-3 54-710	4-Nitrofenilo	A-21	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 355	355-1-3 55-710	3-Hidroxi-2-piridilo	A-22	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

Tabla A					
	N.º de compuesto	Ar	A	Y	R
Tabla 356	356-1-3 56-710	4-hidroxi-2-piridilo	A-2 3	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 14-2]

Tabla 357	357-1-3 57-710	5-hidroxi-2-piridilo	A-2 4	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 358	358-1-3 58-710	6-hidroxi-2-piridilo	A-2 5	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 359	359-1-3 59-710	Hidroxi-2-piridilo	A-2 6	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 360	360-1-3 60-710	5-Hidroxi-3-piridilo	A-2 7	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 14-3]

Tabla 361	361-1-3 61-710	6-Hidroxi-3-piridilo	A-2 8	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 362	362-1-3 62-710	4-Hidroxi-3-piridilo	A-2 9	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 363	363-1-3 63-710	2-Hidroxi-4-piridilo	A-3 0	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 364	363-1-3 64-710	3-Hidroxi-3-piridilo	A-3 1	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 14-4]

Tabla 365	365-1-3 65-710	3-Cloro-2-piridilo	A-3 2	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 366	366-1-3 66-710	4-Cloro-2-piridilo	A-3 3	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 367	367-1-3 67-710	5-Cloro-2-piridilo	A-3 4	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 368	368-1-3 68-710	6-Cloro-2-piridilo	A-3 5	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 14-5]

Tabla 369	369-1-3 69-710	2-Cloro-3-piridilo	A-3 6	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 370	370-1-3 70-710	5-Cloro-3-piridilo	A-3 7	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 371	371-1-3 71-710	6-Cloro-3-piridilo	A-3 8	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 372	372-1-3 72-710	4-Cloro-3-piridilo	A-3 9	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 14-6]

Tabla 373	373-1-3 73-710	2-Cloro-4-piridilo	A-4 0	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 374	374-1-3 74-710	3-Cloro-4-piridilo	A-2	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 375	375-1-3 75-710	3-bromo-2-piridilo	A-3	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 376	376-1-3 76-710	4-bromo-2-piridilo	A-4	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 14-7]

Tabla 377	377-1-3 77-710	5-bromo-2-piridilo	A-5	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 378	378-1-3 78-710	6-bromo-2-piridilo	A-6	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 379	379-1-3 79-710	2-bromo-3-piridilo	A-7	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 380	380-1-3 80-710	5-bromo-3-piridilo	A-8	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 14-8]

Tabla 381	381-1 - 3 81-710	6-bromo-3-piridilo	A-9	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 382	382-1 - 3 82-710	4-bromo-3-piridilo	A-1 0	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 383	383-1 3 83-710	2-bromo-4-piridilo	A-1 1	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 384	384-1 - 3 84-710	3-bromo-4-piridilo	A-1 2	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 15-1]

Tabla A					
	N.º de compuesto	Ar	A	Y	R
Tabla 385	385-1-3 85-710	3-Fluoro-2-piridilo	A-1 7	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 386	386-1-3 86-710	4-Fluoro-2-piridilo	A-1 8	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 387	387-1-3 87-710	5-Fluoro-2-piridilo	A-1 9	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 15-2]

Tabla 388	388-1-3 88-710	6-Fluoro-2-piridilo	A-2 0	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 389	389-1-3 89-710	2-Fluoro-3-piridilo	A-2 1	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

ES 2 631 986 T3

Tabla 390	390-1-3 90-710	5-Fluoro-3-piridilo	A-2 2	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 391	391-1-3 91-710	6-Fluoro-3-piridilo	A-2 3	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 15-3]

Tabla 392	392-1-3 92-710	4-Fluoro-3-piridilo	A-2 4	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 393	393-1-3 93-710	2-Fluoro-4-piridilo	A-2 5	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 394	394-1-3 94-710	3-Fluoro-4-piridilo	A-2 6	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 395	395-1-3 95-710	6-Fluoro-3-piridilo	A-2 7	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 15-4]

Tabla 396	396-1-3 96-710	3-yodo-2-piridilo	A-2 8	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 397	397-1-3 97-710	4-yodo-2-piridilo	A-2 9	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 398	398-1-3 98-710	5-yodo-2-piridilo	A-3 0	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 399	399-1-3 99-710	6-yodo-2-piridilo	A-3 1	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 15-5]

Tabla 400	400-1-4 00-710	2-yodo-3-piridilo	A-3 2	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 401	401-1-4 01-710	5-yodo-3-piridilo	A-3 3	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 402	402-1-4 02-710	6-yodo-3-piridilo	A-3 4	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 403	403-1-4 03-710	4-yodo-3-piridilo	A-3 5	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 15-6]

Tabla 404	404-1-4 04-710	2-yodo-4-piridilo	A-3 6	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 405	405-1-4 05-710	3-yodo-4-piridilo	A-3 7	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 406	406-1-4 06-710	6-yodo-3-piridilo	A-3 8	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 407	407-1-4 07-710	6-yodo-3-piridilo	A-3 9	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 15-7]

Tabla 408	408-1-4 08-710	2-tetrahidrofurano	A-4 0	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 409	409-1-4 09-710	3-tetrahidrofurano	A-2	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

ES 2 631 986 T3

Tabla 410	410-1-4 10-710	5-Cloro-2-tiazolilo	A-3	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 411	411-1-4 11-710	6-Fluoro-3-piridilo	A-4	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 15-8]

Tabla 412	412-1-4 12-710	6-Bromo-3-piridilo	A-5	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 413	413-1-4 13-710	6-Cloro-5-Fluoro-3-piridilo	A-6	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 414	414-1-4 14-710	3,5-Dimetilfenilo	A-7	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 415	415-1-4 15-710	2,3-Dimetilfenilo	A-8	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 15-9]

Tabla 416	416-1-4 16-710	2,4-Dimetilfenilo	A-9	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
-----------	----------------	-------------------	-----	---	---

[Tabla 16-1]

Tabla A					
	N.º de compuesto	Ar	A	Y	R
Tabla 417	417-1-41 7-710	Fenilo	A-1 0	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 418	418-1-41 8-710	ciclopentilo	A-1 1	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 419	419-1-41 9-710	ciclohexilo	A-1 2	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 420	420-1-42 0-710	3-metilciclohexilo	A-1 7	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 16-2]

Tabla 421	421-1-42 1-710	ciclobutilo	A-1 8	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 422	422-1 -422-710	2-oxetanilo	A-1 9	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 423	423-1-42 3-710	3-oxetanilo	A-2 0	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 424	424-1- 42 4-710	2-tietanilo	A-2 1	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 16-3]

Tabla 425	425-1-42 5-710	3-tietanilo	A-2 2	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 426	426-1-42 6-710	2-azetidínilo	A-2 3	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 427	427-1-42 7-710	3-azetidínilo	A-2 4	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

ES 2 631 986 T3

Tabla 428	428-1-42 8-710	6-yodo-3-piridilo	A-2 5	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
-----------	----------------	-------------------	-------	---	---

[Tabla 16-4]

Tabla 429	429-1-42 9-710	6-yodo-3-piridilo	A-2 6	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 430	430-1-43 0-710	2-tetrahidrofuranilo	A-2 7	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 431	431-1-43 1-710	2-Cloro-3-piridilo	A-2 8	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 432	432-1-43 2-710	5-Cloro-3-piridilo	A-2 9	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 16-5]

Tabla 433	433-1-43 3-710	6-Cloro-3-piridilo	A-3 0	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 434	434-1-43 4-710	4-Cloro-3-piridilo	A-3 1	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 435	435-1-43 5-710	2-Cloro-4-piridilo	A-3 2	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 436	436-1-43 6-710	3-Cloro-4-piridilo	A-3 3	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 16-6]

Tabla 437	437-1-43 7-710	3-bromo-2-piridilo	A-3 4	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 438	438-1-43 8-710	4-bromo-2-piridilo	A-3 5	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 439	439-1-43 9-710	2-Fluoro-4-piridilo	A-3 6	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 440	440-1-44 0-710	3-Fluoro-4-piridilo	A-3 7	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 16-7]

Tabla 441	441-1-44 1-710	6-Fluoro-3-piridilo	A-3 8	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 442	442-1-44 2-710	3-yodo-2-piridilo	A-3 9	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 443	443-1-44 3-710	6-Fluoro-3-piridilo	A-4 0	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 444	444-1- 44 4-710	2-Cloro-5-tiazolilo	A-3 8	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 17-1]

Tabla A					
	N.º de compuesto	Ar	A	Y	R
Tabla 445	445-1-44 5-710	6-Cloro-3-piridilo	A-1	3-CH 3	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

ES 2 631 986 T3

Tabla 446	446-1-44 6-710	2-Cloro-5-tiazolilo	A-1	3-CH 3	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 447	447-1-44 7-710	6-Fluoro-3-piridilo	A-1	3-CH 3	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 17-2]

Tabla 448	448-1- 44 8-710	6-Bromo-3-piridilo	A-1	3-CH 3	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 449	449-1- 44 9-710	6-Cloro-5-fluoro-3-piridilo	A-1	3-CH 3	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 450	450-1-45 0-710	2-Cloro-5-pirimidinilo	A-1	3-CH 3	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 451	451-1-45 1-710	5-Cloropirazin-2-ilo	A-1	3-CH 3	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 17-3]

Tabla 452	452-1-45 2-710	6-Cloropiridazin-3-ilo	A-1	3-CH 3	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 453	453-1-45 3-710	2-Cloro-5-oxazolilo	A-1	3-CH 3	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 454	454-1-45 4-710	6-trifluorometil-3-piridilo	A-1	3-CH 3	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 455	455-1-45 5-710	3-tetrahidrofuranilo	A-1	3-CH 3	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 17-4]

Tabla 456	456-1 - 45 6-710	6-Cloro-3-piridilo	A-1	4-CH 3	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 457	457-1 - 45 7-710	2-Cloro-5-tiazolilo	A-1	4-CH 3	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 458	458-1 45 8-710	6-Fluoro-3-piridilo	A-1	4-CH 3	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 459	459-1 - 45 9-710	6-Bromo-3-piridilo	A-1	4-CH 3	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 17-5]

Tabla 460	460-1-46 0-710	6-Cloro-5-Fluoro-3-piridilo	A-1	4-CH 3	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 461	461-1-46 1-710	2-Cloro-5-pirimidinilo	A-1	4-CH 3	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 462	462-1-46 2-710	5-Cloropirazin-2-ilo	A-1	4-CH 3	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 463	463-1-46 3-710	6-Cloropiridazin-3-ilo	A-1	4-CH 3	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 17-6]

Tabla 464	464-1-46 4-710	2-Cloro-5-oxazolilo	A-1	4-CH 3	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 465	465-1-46 5-710	6-trifluorometil-3-piridilo	A-1	4-CH 3	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 466	466-1-46 6-710	3-tetrahidrofuranilo	A-1	4-CH 3	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 467	467-1-46 7-710	6-Cloro-3-piridilo	A-1	5-CH 3	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 17-7]

Tabla 468	468-1-46 8-710	2-Cloro-5-tiazolilo	A-1	5-CH 3	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 469	469-1-46 9-710	6-Fluoro-3-piridilo	A-1	5-CH 3	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 470	470-1-47 0-710	6-Bromo-3-piridilo	A-1	5-CH 3	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 471	471-1-47 1-710	6-Cloro-5-fluoro-3-piridilo	A-1	5-CH 3	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 17-8]

Tabla 472	472-1-47 2-710	2-Cloro-5-pirimidinilo	A-1	5-CH 3	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 473	473-1-47 3-710	5-Cloropirazin-2-ilo	A-1	5-CH 3	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 474	474-1-47 4-710	6-Cloropiridazin-3-ilo	A-1	5-CH 3	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 475	475-1-47 5-710	2-Cloro-5-oxazolilo	A-1	5-CH 3	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 17-9]

Tabla 476	476-1 - 47 6-710	6-trifluorometil-3-piridilo	A-1	5-CH 3	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
-----------	------------------	-----------------------------	-----	--------	---

[Tabla 18-1]

Tabla A					
	N.º de compuesto	Ar	A	Y	R
Tabla 477	477-1-47 7-710	3-tetrahidrofuranilo	A-1	5-CH 3	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 478	478-1-47 8-710	6-Cloro-3-piridilo	A-1	6-CH 3	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 479	479-1-47 9-710	2-Cloro-5-tiazolilo	A-1	6-CH 3	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 18-2]

Tabla 480	480-1-48 0-710	6-Fluoro-3-piridilo	A-1	6-CH 3	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 481	481-1-48 1-710	6-Bromo-3-piridilo	A-1	6-CH 3	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 482	482-1-48 2- 710	6-Cloro-5-fluoro-3- piridilo	A-1	6-CH 3	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 483	483-1-48 3-710	2-Cloro-5- pirimidinilo	A-1	6-CH 3	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 18-3]

Tabla 484	484-1-48 4-710	5-Cloropirazin-2-ilo	A-1	6-CH 3	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 485	485-1-48 5-710	6-Cloropiridazin-3-ilo	A-1	6-CH 3	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 486	486-1-48 6-710	2-Cloro-5-oxazolilo	A-1	6-CH 3	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 487	487-1-48 7-710	6-trifluorometil-3-piridilo	A-1	6-CH 3	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 18-4]

Tabla 488	488-1 - 48 8-710	3-tetrahidrofurano	A-1	6-CH 3	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 489	489-1 - 48 9-710	6-Cloro-3-piridilo	A-1	3-NO 2	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 490	490-1 49 0-710	2-Cloro-5-tiazolilo	A-1	3-NO 2	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 491	491-1 - 49 1-710	6-Fluoro-3-piridilo	A-1	3-NO 2	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 18-5]

Tabla 492	492-1-49 2-710	6-Bromo-3-piridilo	A-1	3-NO 2	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 493	493-1-49 3-710	6-Cloro-5-Fluoro-3- piridilo	A-1	3-NO 2	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 494	494-1-49 4-710	2-Cloro-5-pirimidinilo	A-1	3-NO 2	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 495	495-1-49 5-710	5-Cloropirazin-2-ilo	A-1	3-NO 2	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 18-6]

Tabla 496	496-1-49 6-710	6-Cloropiridazin-3-ilo	A-1	3-NO 2	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 497	497-1-49 7-710	2-Cloro-5-oxazolilo	A-1	3-NO 2	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

ES 2 631 986 T3

Tabla 498	498-1-49 8-710	6-trifluorometil-3-piridilo	A-1	3-NO 2	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 499	499-1-49 9-710	3-tetrahidrofuranilo	A-1	3-NO 2	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 18-7]

Tabla 500	500-1 50 0-710	6-Cloro-3-piridilo	A-1	4-NO 2	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 501	501-1 50 1-710	2-Cloro-5-tiazolilo	A-1	4-NO 2	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 502	502-1 50 2-710	6-Fluoro-3-piridilo	A-1	4-NO 2	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 503	503-1 50 3-710	6-Bromo-3-piridilo	A-1	4-NO 2	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 18-8]

Tabla 504	504-1-50 4-710	6-Cloro-5-fluoro-3-piridilo	A-1	4-NO 2	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 505	505-1-50 5-710	2-Cloro-5-pirimidinilo	A-1	4-NO 2	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 506	506-1-50 6-710	5-cloropirazin-2-ilo	A-1	4-NO 2	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 507	507-1-50 7-710	6-cloropiridazin-3-ilo	A-1	4-NO 2	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 18-9]

Tabla 508	508-1 50 8-710	2-Cloro-5-oxazolilo	A-1	4-NO 2	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
-----------	----------------------	---------------------	-----	--------	---

[Tabla 19-1]

Tabla A					
	N.º de compuesto	Ar	A	Y	R
Tabla 509	509-1-50 9-710	6-trifluorometil-3-piridilo	A-1	4-NO 2	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 510	510-1-51 0-710	3-tetrahidrofuranilo	A-1	4-NO 2	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 511	511-1-51 1-710	6-Cloro-3-piridilo	A-1	5-NO 2	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 19-2]

Tabla 512	512-1-51 2-710	2-Cloro-5-tiazolilo	A-1	5-NO 2	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 513	513-1-51 3-710	6-Fluoro-3-piridilo	A-1	5-NO 2	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 514	514-1-51 4-710	6-Bromo-3-piridilo	A-1	5-NO 2	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 515	515-1-51 5-710	6-Cloro-5-fluoro-3-piridilo	A-1	5-NO 2	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 19-3]

Tabla 516	516-1-51 6-710	2-Cloro-5-pirimidinilo	A-1	5-NO 2	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 517	517-1-51 7-710	5-Cloropirazin-2-ilo	A-1	5-NO 2	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 518	518-1-51 8-710	6-Cloropiridazin-3-ilo	A-1	5-NO 2	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 519	519-1-51 9-710	2-Cloro-5-oxazolilo	A-1	5-NO 2	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 19-4]

Tabla 520	520-1-52 0-710	6-trifluorometil-3-piridilo	A-1	5-NO 2	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 521	521-1-52 1-710	3-tetrahidrofuranilo	A-1	5-NO 2	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 522	522-1-52 2-710	6-Cloro-3-piridilo	A-1	6-NO 2	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 523	523-1-52 3-710	2-Cloro-5-tiazolilo	A-1	6-NO 2	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 19-5]

Tabla 524	524-1-52 4-710	6-Fluoro-3-piridilo	A-1	6-NO 2	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 525	525-1-52 5-710	6-Bromo-3-piridilo	A-1	6-NO 2	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 526	526-1-52 6-710	6-Cloro-5-Fluoro-3-piridilo	A-1	6-NO 2	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 527	527-1-52 7-710	2-Cloro-5-pirimidinilo	A-1	6-NO 2	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 19-6]

Tabla 528	528-1-52 8-710	5-Cloropirazin-2-ilo	A-1	6-NO 2	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 529	529-1-52 9-710	6-Cloropiridazin-3-ilo	A-1	6-NO 2	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 530	530-1-53 0-710	2-Cloro-5-oxazolilo	A-1	6-NO 2	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

ES 2 631 986 T3

Tabla 531	531-1-53 1-710	6-trifluorometil-3-piridilo	A-1	6-NO 2	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
-----------	----------------	-----------------------------	-----	--------	---

[Tabla 19-7]

Tabla 532	532-1 53 2-710	3-tetrahidrofuranilo	A-1	6-NO 2	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 533	533-1 53 3-710	6-Cloro-3-piridilo	A-1	3-OC H3	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 534	534-1 53 4-710	2-Cloro-5-tiazolilo	A-1	3-OC H3	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 535	535-1 53 5-710	6-Fluoro-3-piridilo	A-1	3-OC H3	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 19-8]

Tabla 536	536-1-53 6-710	6-Bromo-3-piridilo	A-1	3-OC H3	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 537	537-1-53 7-710	6-Cloro-5-fluoro-3-piridilo	A-1	3-OC H3	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 538	538-1-53 8-710	2-Cloro-5-pirimidinilo	A-1	3-OC H3	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 539	539-1-53 9-710	5-Cloropirazin-2-ilo	A-1	3-OC H3	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 19-9]

Tabla 540	540-1- 54 0-710	6-Cloropiridazin-3-ilo	A-1	3-OC H3	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
-----------	--------------------	------------------------	-----	---------	---

[Tabla 20-1]

Tabla A					
	N.º de compuesto	Ar	A	Y	R
Tabla 541	541-1-54 1-710	2-Cloro-5-oxazolilo	A-1	3-OC H3	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 542	542-1-54 2-710	6-trifluorometil-3-piridilo	A-1	3-OC H3	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 543	543-1-54 3-710	3-tetrahidrofuranilo	A-1	3-OC H3	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 20-2]

Tabla 544	544-1 54 4-710	6-Cloro-3-piridilo	A-1	4-OC H3	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 545	545-1 - 54 5-710	2-Cloro-5-tiazolilo	A-1	4-OC H3	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

ES 2 631 986 T3

Tabla 546	546-1 54 6-710	6-Fluoro-3-piridilo	A-1	4-OC H3	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 547	547-1 - 54 7-710	6-Bromo-3-piridilo	A-1	4-OC H3	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 20-3]

Tabla 548	548-1- 54 8- 710	6-Cloro-5-Fluoro-3-piridilo	A-1	4-OC H3	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 549	549-1- 54 9- 710	2-Cloro-5-pirimidinilo	A-1	4-OC H3	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 550	550-1-55 0- 710	5-Cloropirazin-2-ilo	A-1	4-OC H3	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 551	551-1-55 1- 710	6-Cloropiridazin-3-ilo	A-1	4-OC H3	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 20-4]

Tabla 552	552-1-55 2- 710	2-Cloro-5-oxazolilo	A-1	4-OC H3	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 553	553-1-55 3- 710	6-trifluorometil-3-piridilo	A-1	4-OC H3	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 554	554-1-55 4- 710	3-tetrahidrofuranilo	A-1	4-OC H3	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 555	555-1-55 5- 710	6-Cloro-3-piridilo	A-1	5-OC H3	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 20-5]

Tabla 556	556-1-55 6- 710	2-cloro-5-tiazolilo	A-1	5-OC H3	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 557	557-1-55 7- 710	6-Fluoro-3-piridilo	A-1	5-OC H3	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 558	558-1-55 8- 710	6-Bromo-3-piridilo	A-1	5-OC H3	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 559	559-1-55 9- 710	6-Cloro-5-fluoro-3-piridilo	A-1	5-OC H3	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 20-6]

Tabla 560	560-1-56 0- 710	2-Cloro-5-pirimidinilo	A-1	5-OC H3	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 561	561-1-56 1- 710	5-Cloropirazin-2-ilo	A-1	5-OC H3	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 562	562-1-56 2- 710	6-Cloropiridazin-3-ilo	A-1	5-OC H3	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 563	563-1-56 3- 710	2-Cloro-5-oxazolilo	A-1	5-OC H3	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 20-7]

Tabla 564	564-1-56 4-710	6-trifluorometil-3-piridilo	A-1	5-OC H3	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 565	565-1-56 5-710	3-tetrahidrofuranilo	A-1	5-OC H3	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 566	566-1-56 6-710	6-Cloro-3-piridilo	A-1	6-OC H3	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 567	567-1-56 7-710	2-Cloro-5-tiazolilo	A-1	6-OC H3	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 20-8]

Tabla 568	568-1-56 8-710	6-Fluoro-3-piridilo	A-1	6-OC H3	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 569	569-1-56 9-710	6-Bromo-3-piridilo	A-1	6-OC H3	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 570	570-1-57 0-710	6-Cloro-5-Fluoro-3-piridilo	A-1	6-OC H3	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 571	571-1-57 1-710	2-Cloro-5-pirimidinilo	A-1	6-OC H3	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 20-9]

Tabla 572	572-1 57 2-710	5-Cloropirazin-2-ilo	A-1	6-OC H3	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
-----------	----------------------	----------------------	-----	---------	---

[Tabla 21-1]

Tabla A					
	N.º de compuesto	Ar	A	Y	R
Tabla 573	573-1-57 3-710	6-Cloropiridazin-3-ilo	A-1	6-OC H3	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 574	574-1-57 4-710	2-Cloro-5-oxazolilo	A-1	6-OC H3	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 575	575-1-57 5-710	6-trifluorometil-3-piridilo	A-1	6-OC H3	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

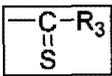
[Tabla 21-2]

Tabla 576	576-1-57 6-710	3-tetrahidrofuranilo	A-1	6-OC H3	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 577	577-1-57 7-710	2,6-dicloro-3-piridilo	A-1	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 578	578-1-57 8-710	3-piridilo	A-1	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
Tabla 579	579-1-57 9-710	4-piridilo	A-1	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B

[Tabla 21-3]

Tabla 580	580-1-58 0-710	6-cloro-3-piridil-N- óxido	A- 1	H	representa una combinación de sustituyentes que corresponde a cada fila de la Tabla B
-----------	-------------------	-------------------------------	---------	---	--

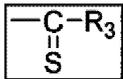
[Tabla 22-1]

Tabla B		
	R	
		R3
20		CF3
21		CHF2
22		CF2Cl
23		CF2CF3
24		CH2Cl
25		CHCl2
26		CCl3
27		CHClBr
28		CHBr2
29		2,3,3-trifluoroacriló
30		CH2CHF2
31		CH2CF3
32		CH=CH2
33		CH2C≡CH

[Tabla 22-2]

34		CH2CF3
35		CH2CH2Ph
36		Me
37		Et
38		n-Pr
39		i-Pr
40		ciclopropilo

[Tabla 35]

Tabla B		
	R	
		
		R3
648		C6F5
649		CH2OCH2C6H5

Los ejemplos preferidos del compuesto representado por la Fórmula (I) incluyen compuestos en la siguiente Tabla 38.

[Tabla 38-1]

N.º de compuesto	Ar	A	Y	R
1-20	6-Cloro-3-piridilo	A-1	H	CSCF3

5

[Tabla 38-2]

1-21	6-Cloro-3-piridilo	A-1	H	CSCHF2
3-20	6-Fluoro-3-piridilo	A-1	H	CSCF3
4-20	6-Bromo-3-piridilo	A-1	H	CSCF3

[Tabla 38-3]

1-22	6-Cloro-3-piridilo	A-1	H	CSCF2C1
1-23	6-Cloro-3-piridilo	A-1	H	CSCF2CF3
5-20	6-Cloro-5-fluoro-3-piridilo	A-1	H	CSCF3

10

[Tabla 38-4]

2-20	2-cloro-5-tiazolilo	A-1	H	CSCF3
10-20	6-trifluorometil-3-piridilo	A-1	H	CSCF3
11-20	3-THF	A-1	H	CSCF3
1-37	6-Cloro-3-piridilo	A-1	H	CSEt
1-39	6-Cloro-3-piridilo	A-1	H	CS-i-Pr

[Tabla 38-5]

1-40	6-Cloro-3-piridilo	A-1	H	CS-ciclopropilo
1-35	6-Cloro-3-piridilo	A-1	H	CSCH2CH2Ph

15

Los ejemplos de compuestos particularmente preferibles de acuerdo con la invención incluyen los compuestos 1-20, 1-21, 3-20, 4-20, 1-22, 1-23 y 5-20.

20

Los ejemplos de especies de insectos contra los que un agente de control de plagas que contiene al menos uno de los compuestos de la presente invención, que está representado por la Fórmula (I), muestra efectos de control son como sigue.

25

Los ejemplos de plagas agrícolas y hortícolas incluyen plagas de lepidópteros (por ejemplo, *Spodoptera litura*, gusano soldado de la col, *Mythimnaseparata*, gusano de la col, polilla de la col, *Spodoptera exigua*, barrenador del tallo de arroz, enrollador de hojas, *Naranga aeneascens*, tortricidos, polilla de la manzana, polilla minadora de hojas, polilla de mechón, *Agrotis* spp, *Helicoverpa* spp, *Heliothis* spp y similares), plagas de hemípteros (por ejemplo, áfidos (*Aphididae*, *Adelgidae*, *Phylloxeridae*) tales como *Myzus persicae*, *Aphis gossypii*, *Aphis fabae*, áfido de la hoja de maíz, áfido del guisante, *Aulacorthum solani*, *Aphis craccivora*, *Macrosiphum euphorbiae*, *Macrosiphum avenae*, *Methopolophium dirhodum*, *Rhopalosiphum padi*, pulgón verde, *Brevicoryne brassicae*, *Lipaphis erysimi*, *Aphis spiraeicola*, áfido rosado de la manzana, tizón de la manzana, *Toxoptera aurantii*, *Toxoptera citricidus* y similares, saltahojas tales como *Nephotettix cincticeps*, *Empoasca vitis* y similares, chicharritas tales como *Laodelphax striatella*, *Nilaparvata lugens*, *Sogatella furcifera* y similares, *Pentatomorpha* tales como *Eysarcoris ventralis*, *Nezara viridula*, *Plautia stali*, *Trigonotylus caelestialium* y similares, moscas blancas (*Aleyrodidae*) tales como mosca blanca de hojas plateadas, *Bemisia tabaci*, mosca blanca de invernadero y similares, cochinillas (*Diaspididae*, *Margarodidae*, *Ortheziidae*, *Acleridae*, *Dactylopiidae*, *Kerridae*, *Pseudococcidae*, *Coccidae*, *Eriococcidae*, *Asterolecaniidae*, *Beesonidae*, *Lecanodiaspididae*, *Cerococcidae* y similares) tales como *Pseudococcus comstocki*, *Planococcus citri*, *Pseudaulacaspis pentagona*, *Aonidiella aurantii* y similares, plagas de coleópteros (por ejemplo, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Callosobruchus chinensis*, *Tenebrio molitor*, *Diabrotica virgifera*, *Diabrotica undecimpunctata howardi*, *Anomala cuprea*, *Anomala rufocuprea*, *Phyllotreta striolata*, *Aulacophora femoralis*, *Leptinotarsa decemlineata*, *Oulema oryzae*, *Bostrichidae*, *Cerambycidae* y similares), *Acarina* (por ejemplo, *Tetranychus urticae*, *Tetranychus kanzawai*, *Panonychus citri* y similares), plagas de himenópteros (por ejemplo, *Tenthredinidae*), plagas de ortópteros (por ejemplo, *Acridioidea*), plagas de dípteros (por ejemplo, mosca doméstica y *Agromyzidae*), plagas de tisanópteros (por ejemplo, *Thrips palmi*, *Frankliniella occidentalis* y similares), nematodo

40

fitoparásito (por ejemplo, *Meloidogyne*, *Pratylenchus*, *Aphelenchoides besseyi*, *Bursaphelenchus xylophilus* y similares) y similares.

5 Los ejemplos de plagas parásitas de animales incluyen *Ixodidae* (por ejemplo, *Amblyomma americanum*, *Amblyomma maculatum*, *Boophilus microplus*, *Dermacentor andersoni*, *Dermacentor occidentalis*, *Dermacentor variabilis*, *Haemaphysalis campanulata*, *Haemaphysalis flava*, *Haemaphysalis longicornis*, *Haemaphysalis megapinosa* Saito, *Ixodes nipponensis*, *Ixodes ovatus*, *Ixodes persulcatus*, *Ixodes ricinus*, *Ixodes scapularis*, *Ornithodoros moubata pacificus* y *Rhipicephalus sanguineus*), *Cheyletidae* (por ejemplo, *Cheyletiella blakei* y *Cheyletiella yasguri*), *Demodex* (por ejemplo, *Demodex canis* y *Demodex cati*), *Psoroptidae* (por ejemplo, *Psoroptes communis*), *Sarcoptidae* (por ejemplo, *Chorioptes bovis* y *Otodectes cynotis*), *Dermanyssidae* (por ejemplo, *Ornithonyssus sylviarum*), *Dermanyssus gallinae*, *Pterolichus* (por ejemplo, *Megninia cubitalis* y *Pterolichus obtusus*), *Trombiculidae* (por ejemplo, *Helenicula miyagawai* y *Leptotrombidium akamushi*), *Shiphonaptera* (por ejemplo, *Ctenocephalides felis*, *Pulex irritans*, *Xenopsylla cheopis* y *Xenopsylla*), *Mallophaga* (por ejemplo, *Trichodectes canis* y *Menopon gallinae*), *Anoplura* (por ejemplo, *Haematopinus suis*, *Linognathus setosus*, *Pediculus humanus*, *Pediculus humanus*, *Pthirus pubis* y *Cimex lectularius*), *Musca domestica*, *Hypoderma bovis*, *Stomoxys calcitrans*, *Gasterophilus*, *Psychodidae* (por ejemplo, *Phlebotomus*), *Glossina morsitans*, *Tabanidae*, *Aedes spp.* (por ejemplo, *Aedes albopictus* y *Aedes aegypti*), *Culex spp.* (por ejemplo, *Culex pipiens pallens*), *Anophelini*, *Ceratopogonidae*, *Simuliidae*, *Reduviidae*, *Monomorium pharaonis*, *Nematoda* (por ejemplo, *Strongyloides*, *Ancylostomatoidea*, *Strongyloidea* (por ejemplo, *Haemonchus contortus* y *Nippostrongylus braziliensis*), *Trichostrongyloidea*, *Metastrongyloidea* (por ejemplo, *Metastrongylus elongatus*, *Angiostrongylus cantonensis* y *Aelurostrongylus abstrusus*), *Oxyuroidea*, *Haterakoidea* (por ejemplo, *Ascaridia galli*), *Ascaridoidea* (por ejemplo, *Anisakis simplex*, *Ascaris suum*, *Parascaris equorum*, *Toxocara canis* y *Toxocara cati*), *Spiuroidea* (por ejemplo, *Subuluroidea*, *Gnathostoma spinigerum*, *Physaloptea praeputialis*, *Ascarops strongylina*, *Draschia megastoma* y *Ascaria hamulosa*, *Dracunculus medinensis*), *Filarioidea* (por ejemplo, *Dirofilaria immitis*, filaria linfática, *Onchocerca volvulus* y *Loa loa*), *Diectophymatoidea*, *Trichinella* (por ejemplo, *Trichuris vulpis* y *Trichinella spiralis*)), *Trematoda* (por ejemplo, *Schistosoma japonicum* y *Fasciola hepatica*), *Acanthocephala*, *Taenia* (por ejemplo, *Pseudophyllidea* (por ejemplo, *Spirometra erinaceieuropaei*) y *Cyclophyllidea* (por ejemplo, *Dipylidium caninum*)), *Protozoa* y similares.

30 Los ejemplos de plagas higiénicas, plagas molestas, plagas de grano almacenado, plagas de producto almacenado y plagas del hogar incluyen *Culicidae spp.* (por ejemplo, *Aedes albopictus* y *Culex pipiens pallens*), *Periplaneta* (por ejemplo, *Periplaneta fuliginosa*, *Periplaneta japonica* y *Blattella germanica*), *Acaridae* (por ejemplo, *Tyrophagus putrescentiae*), *Diptera* (por ejemplo, mosca doméstica, *Sarcophagaperegrina*, *Psychodidae*, *Drosophila* y *Chironomus*), *Simuliidae*, *Ceratopogonidae*, insectos himenópteros (por ejemplo, *Formicidae* tales como *Camponotus japonicus*, *Solenopsis spp.* y similares e *Hymenoptera* tales como *Vespa mandarinia*), Artrópodos de *Isopoda* (por ejemplo, *Porcellio scaber*, *Ligia exotica* y *Armadillidium vulgare*), insectos hemípteros (por ejemplo, *Cimex lectularius*), Artrópodos de *Myriapoda* (por ejemplo, ciempiés, milpiés y *Diplopoda*), Artrópodos de *Araneae* (por ejemplo, *Heteropoda venatoria*), insectos coleópteros (por ejemplo, *Anisodactylus signatus*), Artrópodos de *Collembola* (por ejemplo, *Onychiurus folsomi*), insectos dermápteros (por ejemplo, *Labidura riparia*), insectos ortópteros (por ejemplo, *Stenopelmaticidae*), insectos coleópteros (por ejemplo, *Callosobruchus chinensis*, *Sitophilus zeamais*, *Tenebroides mauritanicus*, *Tribolium castaneum*, *Anthrenus museorum*, *Anobiidae*, *Scolytidae spp.*, *Dermestidae* y *Chlorophorus diadema inhirsutus Matsushita*), insectos lepidópteros (por ejemplo, *Pyralidae* y *Tineidae*), *Hemiptera*, insectos isópteros (por ejemplo, *Coptotermes formosanus*, *Incisitermes minor* (Hagen) y *Odontotermes formosanus*), *Thysanura* (por ejemplo, *Ctenolepisma villosa*) y similares.

45 Entre ellos, los ejemplos preferidos de especies de insectos a los que se aplica el agente de control de plagas de la presente invención incluyen plagas de lepidópteros, plagas de hemípteros, plagas de tisanópteros, plagas de dípteros, plagas de coleópteros, *Siphonaptera* o *Acaridae* parásitos de animales, *Dirofilaria immitis*, mosquitos, *Periplaneta* e insectos isópteros (por ejemplo, al menos una especie de insecto seleccionada del grupo que consiste en la polilla de la col, *Spodoptera litura*, *Aphis gossypii*, *Myzus persicae*, *Laodelphax striatella*, *Nilaparvata lugens*, *Sogatella furcifera*, *Nephotettix cincticeps*, *Trigonotylus caelestialium*, *Plautia stali*, *Frankliniella occidentalis*, *Oulema oryzae*, *Lissorhoptus oryzae*, mosca doméstica, *Haemaphysalis longicornis*, *Dirofilaria immitis*, *Culex pipiens pallens*, *Blattella germanica* y *Coptotermes formosanus*), los ejemplos más preferidos de los mismos incluyen plagas de hemípteros, insectos coleópteros e *Ixodidae* y los ejemplos particularmente preferidos de los mismos incluyen chicharritas, *Nephotettix cincticeps* y chicharritas resistentes a imidacloprid o fipronil.

60 En consecuencia, los ejemplos de un agente de control de plagas proporcionado por la presente invención incluyen un insecticida agrícola y hortícola, un agente para controlar endoparásitos de un animal, un agente para controlar ectoparásitos de un animal, un agente para controlar plagas higiénicas, un agente para controlar plagas molestas, un agente para controlar plagas de grano almacenado y productos almacenados, un agente para controlar plagas del hogar y similares, pero los ejemplos preferidos de los mismos incluyen un insecticida agrícola y hortícola, un agente para controlar endoparásitos de un animal y un agente para controlar ectoparásitos de un animal.

65 El agente de control de plagas de la presente invención puede prepararse usando un vehículo de acuerdo con el uso del mismo además del compuesto representado por la Fórmula (I).

5 Cuando el agente de control de plagas de la presente invención es un agente de control de plagas agrícola, el agente habitualmente se mezcla con un vehículo sólido, vehículo líquido, vehículo gaseoso, tensioactivo, dispersante y otros adyuvantes apropiados para la preparación para proporcionarse en cualquier forma de formulación de concentrados emulsionables, formulaciones líquidas, suspensiones, polvos humectables, fluidos, polvos, gránulos, comprimidos, aceites, aerosoles, fumigantes y similares.

Los ejemplos del vehículo sólido incluyen talco, bentonita, arcilla, caolín, tierra de diatomeas, vermiculita, carbón blanco, carbonato cálcico y similares.

10 Los ejemplos del vehículo líquido incluyen alcoholes tales como metanol, n-hexanol, etilenglicol y similares, cetonas tales como acetona, metil etil cetona, ciclohexano y similares, hidrocarburos alifáticos tales como n-hexano, queroseno, aceite de lámpara y similares, hidrocarburos aromáticos tales como tolueno, xileno, metil naftaleno y similares, éteres tales como éter de dietilo, dioxano, tetrahidrofurano y similares, ésteres tales como acetato de etilo y similares, nitrilos tales como acetonitrilo, isobutil nitrilo y similares, amidas ácidas tales como dimetilformamida, dimetilacetamida y similares, aceites vegetales tales como aceite de soja, aceite de semilla de algodón y similares, dimetil sulfóxido, agua y similares.

Además, los ejemplos del vehículo gaseoso incluyen LPG, aire, nitrógeno, ácido carbónico gas, éter de dimetilo y similares.

20 Como el tensioactivo o el dispersante para la emulsión, dispersión, la difusión y similares, es posible usar, por ejemplo, ésteres de alquilsulfato, sulfonatos de alquil (arilo), éteres de polioxialquilen alquil (arilo), ésteres de alcohol polihídrico, sulfonatos de lignina o similares.

25 Además, como el adyuvante para mejorar las propiedades de la preparación, es posible usar, por ejemplo, carboximetilcelulosa, goma arábiga, polietilenglicol, estearato cálcico o similares.

Los vehículos, tensioactivos, dispersantes y adyuvantes anteriormente mencionados pueden usarse bien solos o bien en combinación, si es necesario.

30 El contenido de ingredientes activos en la preparación no se limita particularmente, pero está habitualmente en el intervalo del 1 al 75 % en peso para el concentrado emulsionable, del 0,3 al 25 % en peso para el polvo, del 1 al 90 % en peso para el polvo humectable y del 0,5 al 10 % en peso para el granulado.

35 La aplicación de los mismos puede realizarse antes y después de la invasión de plagas de insectos.

40 En particular, es posible controlar plagas aplicando una cantidad eficaz de los compuestos representados por la Fórmula (I), una preparación que incluye los mismos y una formulación mixta de otros agentes de control de plagas con el mismo a un objeto seleccionado del grupo que consiste en semillas, raíces, tubérculos, bulbos y rizomas de plantas, plantas germinadas, plantones, suelo, una solución nutriente en cultivo de solución nutriente y un medio sólido en cultivo de solución nutriente y penetrar y migrar el compuesto, la preparación o la formulación mixta hacia las plantas.

45 Cuando el objeto a aplicarse son semillas, raíces, tubérculos, bulbos o rizomas de plantas, los ejemplos apropiados del método de aplicación no se limitan particularmente, pero incluyen un método de inmersión, un método de recubrimiento de polvo, un método de manchado, un método de granulación, un método de recubrimiento y similares siempre que no se alteren la penetración y la migración.

50 En el caso de las semillas, los ejemplos del método de aplicación incluyen un método de inmersión, un método de recubrimiento de polvo, un método de manchado, un método de pulverización, un método de granulación, un método de recubrimiento y un método de fumigación. El método de inmersión es un método en el que las semillas se sumergen en una solución química líquida, y el método de recubrimiento de polvo se clasifica en un método de recubrimiento de polvo seco en el que un químico granular se adhiere sobre semillas secas y un método de recubrimiento de polvo húmedo en el que un químico granular se adhiere sobre las semillas que se han sumergido ligeramente en agua. Además, el método de manchado es un método en el que un químico suspendido se aplica en la superficie de las semillas dentro de un mezclador y el método de pulverización es un método en el que un químico suspendido se pulveriza sobre la superficie de las semillas. Además, el método de granulación es un método en el que un químico se mezcla con una carga y se trata cuando las semillas se suspenden junto con la carga para formar gránulos que tienen cierto tamaño y forma, el método de recubrimiento es un método en el que una película que contiene un químico se recubre sobre las semillas y el método de fumigación es un método en el que las semillas se esterilizan con un químico que se ha gasificado dentro de un recipiente herméticamente sellado.

60 Cuando el método se aplica a plantas germinadas y plantones, estas plantas pueden protegerse por el tratamiento de todo o una parte de las mismas sumergiendo aplicando el método después de la aplicación, después de brotar del suelo o antes del trasplante.

65

Además, cuando el método se aplica a semillas, raíces, tubérculos, bulbos, rizomas o similares, los ejemplos del método incluyen también un método en el que semillas, raíces, tubérculos, bulbos, rizomas o similares se plantan o se sumergen en el químico durante un tiempo suficiente para penetrar y migrar el químico hacia las plantas. En este caso, el tiempo y la temperatura para sumergir se determinan apropiadamente por aquellos expertos en la materia dependiendo del sujeto a aplicarse, la clase y la cantidad de fármaco y similares. Además, el tiempo de penetración y migración no se limita particularmente, pero es, por ejemplo, 1 hora o más. Además, la temperatura para la penetración y la migración es, por ejemplo, de 5 °C a 45 °C.

Los ejemplos del método para aplicar el químico al suelo incluyen un método en el que los gránulos de los compuestos de la presente invención, una preparación que incluye los mismos y una formulación mixta de otros agentes de control de plagas con los mismos se aplican al suelo o sobre el suelo. Los métodos de aplicación de suelo preferidos incluyen pulverización, aplicación en rayas, aplicación en surcos y aplicación en el agujero de plantación. En este punto, el tratamiento de pulverizado incluye una superficie de tratamiento sobre el área entera a tratarse y una introducción mecánica posterior en el suelo.

Además, la aplicación por empapado del suelo con una solución preparada emulsionando o disolviendo los derivados heterocíclicos que contienen nitrógeno que tienen un grupo 2-imino de la presente invención, una preparación que incluye la misma y una formulación mixta de otros agentes de control de plagas con la misma en agua también es un método ventajoso de aplicación al suelo.

Cuando el método se aplica a una solución nutriente en sistemas de cultivo de soluciones nutrientes tales como cultivo en medio sólido, tales como el cultivo hidropónico, el cultivo en arena, NFT (técnica de película nutriente, por sus siglas en inglés), cultivo en lana de roca y similares para la producción de verduras y plantas con flores, es obvio que los compuestos de la presente invención, una preparación que incluye los mismos y una formulación mixta de otros agentes de control de plagas con los mismos pueden aplicarse directamente a un suelo de cultivo artificial incluyendo vermiculita y un medio sólido incluyendo una estera artificial para plántones en crecimiento.

Además, en los procesos de aplicación, una cantidad eficaz del compuesto de Fórmula (I) o las sales del mismo es preferentemente una cantidad suficiente para el compuesto de Fórmula (1) a penetrar y migrar hacia la planta en el posterior proceso de penetración y migración.

La cantidad eficaz puede determinarse apropiadamente considerando las propiedades del compuesto, la clase y la cantidad de sujeto a aplicarse, la longitud del posterior proceso de penetración y migración, la temperatura y similares, pero, por ejemplo, en el caso de una semilla, el compuesto de fórmula (I) o las sales del mismo se aplica en una cantidad de preferentemente de 1 g a 10 kg y más preferentemente de 10 g a 1 kg, por 10 kg de la semilla. Además, la cantidad del compuesto de Fórmula (I) o las sales del mismo aplicadas al suelo es preferentemente de 0,1 g a 10 kg y más preferentemente de 1 g a 1 kg, por 10 áreas de tierra cultivada. La cantidad del compuesto de Fórmula (I) o las sales del mismo tratada a hojas y tallos de una planta es preferentemente de 0,1 g a 10 kg y más preferentemente de 1 g a 1 kg, por 10 áreas de tierra cultivada.

Cuando el agente de control de plagas de la presente invención es un agente de control para plagas parásitas de animales, el agente se proporciona en forma de formulaciones líquidas, concentrados emulsionables, gotas líquidas, pulverizados, preparaciones de espuma, comprimidos, gránulos, subidas finas, polvo, cápsulas, formulaciones masticables, inyecciones, supositorios, cremas, champús, aclarados, agentes de resina, fumigantes, cebos venenosos y similares y se proporciona en particular preferentemente en forma de formulaciones líquidas y gotas líquidas.

La formulación líquida puede mezclarse también con un adyuvante típico para la preparación, tales como un emulsionante, un dispersante, un agente de dispersión, un agente humectante, un agente de suspensión, un conservante, un propulsor y similares y puede mezclarse también con un formador de película típico. Como el tensioactivo para la emulsión, dispersión, difusión y similares, es posible usar, por ejemplo, jabones, éteres de polioxialquilen alquil (arilo), éteres de polioxietilen alquil arilo, éster de ácido graso de polioxietileno, alcoholes superiores, sulfonatos de alquil arilo y similares. Los ejemplos de dispersantes incluyen caseína, gelatina, polisacáridos, derivados de lignina, sacáridos, polímeros hidrosolubles sintéticos y similares. Los ejemplos de agentes de difusión y humectantes incluyen glicerina, polietilenglicol y similares. Los ejemplos de agentes de suspensión incluyen caseína, gelatina, hidroxipropilcelulosa, goma arábiga y similares y los ejemplos de estabilizantes incluyen antioxidantes fenólicos (BHT, BHA y similares), antioxidantes de amina (difenilamina y similares, antioxidantes de azufre orgánico y similares. Los ejemplos de conservantes incluyen p-oxibenzoato de metilo, p-oxibenzoato de etilo, p-oxibenzoato de propilo, p-oxibenzoato de butilo y similares. Los vehículos, tensioactivos, dispersantes y adyuvantes anteriormente mencionados pueden usarse bien solos o en combinación, si es necesario. Además, los perfumes, los sinérgicos y similares también pueden estar contenidos. Es apropiado que el contenido de los ingredientes activos en el agente de control de plagas de la presente invención sea habitualmente del 1 al 75 % en peso para la formulación líquida.

Los ejemplos de vehículos usados para la preparación de cremas incluyen hidrocarburos no volátiles (parafina líquida y similares), grasas y aceites hidrogenados de lanolina, ácidos grasos superiores, ésteres de ácido graso,

aceites animales y vegetales, aceites de silicona, agua y similares. Además, también pueden usarse emulsionantes, humectantes, antioxidantes, perfumes, bórax y absorbentes ultravioleta solos o en combinación, si es necesario. Los ejemplos de emulsionantes incluyen sorbitán de ácido graso, éter de polioxietilenoalquilo y polioxietileno de ácido graso y similares. Es apropiado que el contenido de los ingredientes activos en el agente de control de plagas de la presente invención sea habitualmente del 0,5 al 70 % en peso para la crema.

Las cápsulas, píldoras o comprimidos pueden usarse de tal manera que los ingredientes activos en la composición de la presente invención se dividan en pequeñas porciones adecuadas, la porción pequeña se mezcla con una solución diluyente o un vehículo tales como almidón, lactosa, talco o similares, un desintegrador y/o un aglutinante, tal como estearato magnésico se añade a la misma y la mezcla se forma en comprimidos, si es necesario.

Las inyecciones necesitan prepararse como una solución aséptica. Para las inyecciones, la solución puede contener, por ejemplo, una sal o glucosa suficientes para isotonicar la solución con la sangre. Los ejemplos de vehículos disponibles para la preparación de inyecciones incluyen ésteres tales como derivados de ácidos grasos de glicérido, benzoato de bencilo, miristato de isopropilo y propilenglicol y similares, y los disolventes orgánicos tales como N-metilpirrolidona y glicerol formal. Es apropiado que el contenido de los ingredientes activos en el agente de control de plagas de la presente invención sea habitualmente del 0,01 al 10 % en peso para la inyección.

Los ejemplos de vehículos para la preparación de agentes de resina incluyen polímeros de cloruro de vinilo, poliuretano y similares. Puede añadirse plastificantes tales como ésteres de ácido ftálico, ésteres de ácido adípico, ácido esteárico y similares a estas bases, si es necesario. Después de que los ingredientes activos se amasen en la base, el producto amasado puede moldearse por moldeado por inyección, moldeado por extrusión, moldeado por presión y similares. Además, el producto moldeado también puede someterse adecuadamente a procesos tales como moldeado, cortado o similares para formar una etiqueta para la oreja para animales o un collar insecticida para animales.

Los ejemplos de vehículos para cebos tóxicos incluyen sustancias de cebo y sustancias de atracción (harinas tales como harina de trigo, harina de maíz y similares, almidón tales como almidón de maíz, almidón de patata y similares, sacáridos tales como azúcar granulado, azúcar de malta, miel y similares, sabores alimenticios tales como glicerina, sabor a cebolla, sabor a leche y similares, polvos animales tales como polvo pupal, polvo de pescado y similares, diversas feromonas y similares). Es apropiado que el contenido de los ingredientes activos en el agente de control de plagas de la presente invención sea habitualmente del 0,0001 al 90 % en peso para el cebo tóxico.

Es posible controlar plagas administrando el agente de control de plagas de la presente invención en un animal bien oralmente o por inyección, o administrando completa o parcialmente el agente en la superficie corporal del animal aplicado. Además, es posible controlar plagas cubriendo sitios, en los que se espera la invasión, el parasitismo y el movimiento de las plagas, con el agente de control de plagas de la presente invención.

El agente de control de plagas de la presente invención puede usarse como tal, pero puede diluirse con agua, vehículos líquidos, champús comercialmente disponibles, enjuagados, cebos, fondo de las cajas de cría y similares y aplicarse en algunos casos.

Además, el agente de control de plagas de acuerdo con la presente invención puede mezclarse con otros insecticidas, fungicidas, miticidas, herbicidas, reguladores del crecimiento vegetal, fertilizantes y similares y la mezcla puede usarse. Los ejemplos de un químico que puede mezclarse y usarse incluyen aquellos descritos en The Pesticide Manual (13a edición y publicado por el British Crop Protection Council) o el SHIBUYA INDEX (15a edición, 2010 y publicado por SHIBUYA INDEX RESEARCH GROUP). Como insecticidas, miticidas o nematocidas, los ejemplos más específicos de los mismos incluyen un compuesto de éster fosfórico orgánico tal como acefato, diclorvos, EPN, fenitrotión, fenamifos, protiofos, profenofos, piraclorvos, clorpirifos-metilo, diazinón, fostiazato, imiciafos, triclofón, tetraclorvinfos, bromofenofos y citioato, un compuesto basado en carbamato tal como metomilo, tiodicarb, aldicarb, oxamilo, propoxur, carbarilo, fenobucarb, etiofencarb, fenotiocarb, pirimicarb, carbofurano y benfuracarb, un derivado de nereistoxina tal como cartap y tiociclam, un compuesto de organocloro tal como dicofol y tetradifón, un compuesto a base de piretroide tal como alletrina, d-d-T alletrina, dl-d-T80 alletrina, piretrinas, fenotrina, flumetrina, ciflutrina, d-d-T80 praretrina, ftaltrina, transflutrina, resmetrina, cifenotrina, extracto de piretrum, sinepirina222, sinepirina 500, permetrina, teflutrina, cipermetrina, deltametrina, cihalotrina, fenvalerato, fluvalinato, etofenprox y silafluofeno, un compuesto basado en urea de benzoilo tal como diflubenzurón, teflubenzurón, flufenoxurón, clorfluazurón y lufenurón, un compuesto tipo hormona juvenil tal como metopreno y un compuesto tipo la hormona de la muda tal como cromafenozida. Además, los ejemplos de otros compuestos incluyen buprofecina, hexitiazox, amitraz, clordimeform, piridaben, fenpiroximato, pirimidifeno, tebufenpirad, tolfenpirad, fluacripirim, acequinocilo, ciflumetofeno, flubendiamida, etiprol, fipronilo, etoxazol, imidacloprid, clotianidina, tiametoxam, acetamiprid, nitenpiram, tiacloprid, dinotefurano, pimetrocina, bifenazato, espiroclifeno, espiromesifeno, flonicamid, clorfenapir, piriproxifeno, indoxacarb, piridalilo, espinosad, avermectina, milbemicina, cienopirafeno, espinetoram, pirifluquinazón, clorantraniliprol, ciantraniliprol, espirotetramat, lepimectina, metaflumizona, pirafluprol, piriprol, hidrametilnón, triazamato, sulfoxaflor, flupiradifurona, flometoquina, piflubumida, pirafluprol, ivermectina, selamectina, moxidectina, doramectina, eprinomectina, oxima de milbemicina, DEET, metoxadiazona, ciromazina, triflumurón, aceite de anís estrellado, triclabendazol, flubendazol, fenbendazol, gluconato sódico de antimonio,

clorhidrato de levamisol, bitionol, diclorofeno, fenotiazina, disulfuro de piperazin-carbono, fosfato de piperazina, adipato de piperazina, citrato de piperazina, diclorhidrato de melarsomina, metiridina, santonina, pamoato de pirantel, pirantel, praziquantel, febantel, emodepsida, benzoato de emamectina, cicloxaprid, 1-((6-cloropiridin-3-il)metil)-4-oxo-3-fenil-4H-pirido[1,2-a]pirimidin-1-io-2-olato, un compuesto orgánico a base de metal, un compuesto a base de dinitro, un compuesto de azufre orgánico, un compuesto a base de urea, un compuesto a base de triazina y un compuesto a base de hidrazina.

El agente de control de plagas de la presente invención puede usarse mezclado con o en combinación con un plaguicida microbiano tal como un agente BT, un agente vírico entomopatígeno y similares.

Los ejemplos del fungicida usado mezclado o en combinación incluyen, por ejemplo, un compuesto basado en estrobilurina tal como azoxistrobina, kresoxim-metilo, trifloxistrobina, metominostrobina y orisastrobina, un compuesto a base de anilinoimidina tal como mepanipirim, pirimetanilo y ciprodinilo, un compuesto a base de azol tal como triadimefón, bitertanol, triflumizol, etaconazol, metoconazol, propiconazol, penconazol, flusilazol, miclobutanilo, ciproconazol, tebuconazol, hexaconazol, procloraz y simeconazol, un compuesto a base de quinoxalina tal como quinometionato, un compuesto a base de ditiocarbamato tal como maneb, zinab, mancozeb, policarbamato y propinab, un compuesto a base de carbamato de fenilo tal como dietofencarb, un compuesto a base de organoclorina tal como clorotalonilo y quintoceno, un compuesto a base de bencimidazol tal como benomilo, tiofanato-metilo y carbendazol, un compuesto a base de amida de fenilo tal como metalaxilo, oxadixilo, ofurasa, benalaxilo, furalaxilo y ciprofuram, un compuesto a base de ácido sulfénico tal como diclofluanid, un compuesto a base de cobre tal como hidróxido de cobre (II) y oxiquinolina de cobre (oxina-cobre), un compuesto a base de isoxazol tal como hidroxisoxazol, un compuesto a base de fósforo orgánico tal como fosetilaluminio y tolclofos-metilo, un compuesto a base de N-halogenotioalquilo tal como captano, captafol y folpet, un compuesto a base de dicarboximida tal como procimidona, iprodiona y vinclozolina, un compuesto a base de carboxanilida tal como flutolanilo, mepromilo, furamepir, tfluzamida, boscalid y pentiopirad, un compuesto a base de morfolina tal como fenpropimorf y dimetomorf, un compuesto a base de tina tal como hidróxido de fentina y acetato de fentina, un compuesto a base de cianopirrol tal como fludioxonilo y fempiclonilo y otros ejemplos incluyen triciclazol, piroquilón, carpropamid, diclocimet, fenoxanilo, ftalida, fluazinam, cimoxanilo, triforina, pirifenox, fenarimol, fenpropidina, pencicurón, ferimzón, ciazofamid, iprovalicarb, bentiavalicarb-isopropilo, iminocladin-albesilato, ciflufenamid, kasugamicina, validamicina, estreptomycin, ácido oxolínico, tebufloquina, probenazol, tiadinilo e isotianilo.

Los ejemplos del herbicida usado en mezcla o en combinación incluyen inhibidores de la síntesis de lípidos, inhibidores de la síntesis de ácido acetoláctico, inhibidores de la fotosíntesis, inhibidores de la oxidación de protoporfirógeno IX, herbicidas blanqueadores, inhibidores de la síntesis de aminoácidos, inhibidores de la dihidropirrol sintasa, inhibidores de la división celular, inhibidores de la síntesis de ácidos grasos de cadena muy larga, inhibidores de la biosíntesis de celulosa, desacopladores, herbicidas tipo auxina, inhibidores del transporte de auxinas y similares. Los ejemplos específicos incluyen aloxidim, alloxidim-sódico, butroxidim, cletodim, clodinafop, clodinafop-propargilo, cicloxidim, cihalofop, cihalofop-butilo, diclofop, diclofop-metilo, fenoxaprop, fenoxaprop-etilo, fenoxaprop-P, fenoxaprop-P-etilo, fluazifop, fluazifop-butilo, fluazifop-P, fluazifop-P-butilo, haloxifop, haloxifop-metilo, haloxifop-P, haloxifop-P-metil éster, metamifop, pinoxadeno, profoxidim, propaquizafop, quizalofop, quizalofop-etilo, quizalofop-tefurilo, quizalofop-P, quizalofop-P-etilo, quizalofop-P-tefurilo, setoxidim, tepraloxidim, tralkoxidim, benfuresato, butilato, cicloato, dalapón, dimepiperato, etil dipropiltiocarbamato (EPTC), esprocarb, etofumesato, flupropanato, molinato, orbencarb, pebulato, prosulfocarb, ácido tricloroacético (TCA), tiobencarb, tiocarbazona, triallato, vernolato, sulfonilureas (amidossulfurón, azimsulfurón, bensulfurón, bensulfurón-metilo, clorimurón, clorimurón-etilo, clorsulfurón, cinosulfurón, ciclosulfamurón, etametsulfurón, etametsulfurón-metilo, etoxisulfurón, flazasulfurón, flucetosulfurón, flupirsulfurón, flupirsulfurón-metil-sodio, foramsulfurón, halosulfurón, halosulfurón-metilo, imazosulfurón, yodosulfurón, yodosulfurón-metilsodio, mesosulfurón, metazosulfurón, metsulfurón, metsulfurón-metilo, nicosulfurón, ortosulfamurón, oxasulfurón, primisulfurón, primisulfurón-metilo, propirsulfurón, prosulfurón, pirazosulfurón, pirazosulfuronetilo, rimsulfurón, sulfometurón, sulfometurón-metilo, sulfosulfurón, tifensulfurón, tifensulfurón-metilo, triasulfurón, tribenurón, tribenurón-metilo, trifloxisulfurón, triflusulfurón, triflusulfurón-metilo, tritosulfurón), imazametabenz, imazametabenz-metilo, imazamox, imazapic, imazapir, imazaquina, imazetapir, herbicidas de triazolopirimidina (cloransulam, cloransulam-metilo, diclosulam, flumetsulam, florasulam, metosulam, penoxsulam), pirimisulfan, piroxsulam, bispiribac, bispiribac-sodio, piribenzoxim, piriftalid, piriminobac, piriminobac-metilo, piritiobac, piritiobac-sodio, flucarbazona, flucarbazona-sodio, propoxicarbazona, propoxicarbazona-sodio, tiencarbazona, tiencarbazona-metilo, herbicidas de triazina (clorotriazinas, triazinonas, triazindionas, metiltiotriazinas y piridazinonas, tales como ametrina, atrazina, cloridazona, cianazina, desmetrina, dimetametrina, hexazinona, metribuzina, prometón, prometrina, propazina, simazina, simetrina, terbutmetón, terbutlazin, terbutrinandrietazin), aril ureas (por ejemplo, clorobromurón, clorotolurón, cloroxurón, dimefurón, diurón, fluometurón, isoproturón, isourón, linurón, metamitrón, metabenziazurón, metobenzurón, metoxurón, monolinurón, neburón, sidurón, tebutiurón y tiadiazurón), carbamatos de fenilo (por ejemplo, desmedifam, karbutilato, fenmedifam y fenmedifam-etilo), herbicidas de nitrilo (por ejemplo, bromofenoxim, bromoxinilo o su sal o su éster o ioxinilo o su sal o su éster), uracilos (por ejemplo, bromacilo, lenacilo y terbacilo), bentazón, bentazón-sodio, piridato, piridafol, pentanoclor, propanilo, inhibidores de la fotosíntesis (por ejemplo, diquat, diquat-dibromuro, paraquat, dicloruro de paraquat, paraquat-dimetilsulfato, acifluorfen, acifluorfen-sodio, azafenidina, bencarbazona, benzfendazona, bifenox, butafenacilo, carfentrazona, carfentrazona-etilo, clometoxifeno, cinidon-etilo, fluzalato, flufenpir, flufenpir-etilo, flumiclorac, flumiclorac-pentilo, flumioxazina, fluoroglucofeno, fluoroglucofeno-etilo, flutiacet,

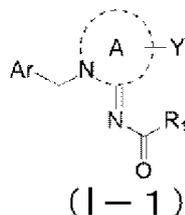
flutiacet-metilo, fomesafeno, halosafeno, lactofeno, oxadiargilo, oxadiazón, oxifluorfeno, pentoxazona, profluzol, piraclonilo, piraflufeno, piraflufeno-etilo, saflufenacilo, sulfentrazona, tidiazimina, beflubutamid, diflufenican, fluridona, flurocloridona, flurtamona, norflurazón, picolinafeno, aclonifeno, amitrol, clomazona, flumeturón, glifosato y su sal, bialafos, bilanafos-sodio, glufosinato, glufosinato-P, glufosinato-amonio, asulam, dinitroanilinas (por ejemplo, 5 benfluralina, butralina, dinitramina, etalfluralina, flucloralina, orizalina, pendimetalina, prodiamina y trifluralina), herbicidas de fosforamido (por ejemplo, amiprofos, amiprofos-metilo y butamifos), herbicidas de ácido benzoico (por ejemplo, clortal y clortal-dimetilo), piridinas (por ejemplo, ditiopir y tiazopir), benzamidas (por ejemplo, propizamida y tebutam), cloroacetamidas (por ejemplo, acetoclor, alaclor, butaclor, dimetaclor, dimetenamid, dimetenamid-P, metazaclor, metolaclor, metolaclor-S, petoxamid, pretilaclor, propaclor, propisoclor y tenilclor), 10 oxiacetanilides (por ejemplo, flufenacet y mefenacet), acetanilidas (por ejemplo, difenamid, naproanilida y napropamida), tetrazolinonas (por ejemplo, fentrazamida), anilofos, cafenstrol, fenoxasulfona, ipfencarbazona, piperofos, piroxasulfona, clortiamid, diclobenilo, flupoxam, isoxaben, dinoseb, dinoterb, 4,6-dinitro-o-cresol (DNOC) y su sal, 2,4-D y su sal o éster, 2,4-DB y su sal o éster, aminopiridil y sus sales (por ejemplo aminopiridil-tris(2-hidroxiopropil)amonio) y ésteres de estos, benazolina, benazolina-etilo, clorambén y su sal o éster, clomeprop, 15 cloprialida y su sal o éster, dicamba y su sal o éster, diclorprop y su sal o éster, diclorprop-P y su sal o éster, fluroxipir y su sal o éster, ácido 2-metil-4-clorofenoxiacético (MCPA) y su sal o éster, MCPA-tioetilo, ácido 4-(2-metil-4-clorofenoxi)butírico (MCPB) y su sal o éster, mecoprop y su sal o éster, mecoprop-P y su sal o éster, picloram y su sal o éster, quinclorac, quinmerac, ácido 2,3,6-triclorobenzoico (TBA(2, 3, 6)) y su sal o éster, triclopir y su sal o éster, aminociclopiraclor y su sal o éster, diflufenzopir y su sal, naptalam y su sal, bromobutida, clorfurenol, 20 clorfurenol-metilo, cinmetilina, cumilurón, dalapón, dazomet, difenzoquat, difenzoquat-metil sulfato, dimetipina, disodio metanearsonato (DSMA), dimrón, endotal y su sal, etobenzanid, flamprop, flamprop-isopropilo, flamprop-metilo, flamprop-M-isopropilo, flamprop-M-metilo, flurenol, flurenol-butilo, flurprimidol, fosamina, fosamina-amonio, indanofan, indaziflam, hidrazida maleica, mefluidida, metam, metiozolina, metil azida, metil bromuro, metil-dimrón, metil yoduro, MSMA, ácido oleico, oxaziclomefona, ácido pelargónico, piributicarb, quinoclamina, triaziflam, tridifana, 25 y 6-cloro-3-(2-ciclopropil-6-metilfenoxi)-4-piridazinol (CAS 499223-49-3) y su sal o éster.

Los ejemplos del agente para controlar parásitos insectos de animales usados en mezcla o en combinación incluyen compuestos de éster de fosfato orgánico, compuestos de carbamato, compuestos de nereistoxina, compuestos de organocloro, compuestos piretroides, compuestos de benzoil urea, compuestos tipo hormona juvenil, compuestos 30 tipo hormona de la muda, compuestos neonicotinoides, bloqueantes del canal de sodio de las células nerviosas, macrolactonas insecticidas, antagonistas del ácido gamma-aminobutírico (GABA), agonistas del receptor de rianodina, ureas insecticidas y similares. Los ejemplos específicos más deseables son diclorvos, EPN, fenitrotión, fenamifos, protiofos, profenofos, piraclorvos, clorpirifos-metilo, diazinón, triclorfón, tetraclorvinfos, bromofenofos, citioato, fentiona y otros compuestos de éster de fosfato orgánico; metomilo, tiodicarb, aldicarb, oxamilo, propoxur, 35 carbarilo, fenobucarb, etiofencarb, fenotiocarb, pirimicarb, carbofuran, benfuracarb y otros compuestos de carbamato; cartap, tiociclam y otros compuestos de nereistoxina; dicofol, tetradifon y otros compuestos de organocloro; aletrina, d-d-T aletrina, dl-d-T80 aletrina, piretrinas, fenotrina, flumetrina, ciflutrina, d-d-T80 praretrina, ftaltrina, translutrina, resmetrina, cifenotrina, extracto de piretrum, sinepirina 222, sinepirina 500, permetrina, teflutrina, cipermetrina, deltametrina, cihalotrina, fenvalerato, fluvalinato, etofenprox, silafluofeno y otros compuestos 40 piretroides; diflubenzurón, teflubenzurón, flufenoxurón, clorfluazurón, lufenurón y otros compuestos de benzoil urea; metopreno y otros compuestos tipo hormona juvenil; y cromafenoza y otros compuestos tipo hormona de la muda. Los ejemplos de otros compuestos incluyen amitraz, clordimeform, fipronilo, etoxazol, imidacloprid, clotianidina, tiametoxam, acetamiprid, nitenpiram, tiacloprid, dinotefuran, espiroclorfenol, piriproxifeno, indoxacarb, espinosad, espinetoram, avermectina, milbemicina, metaflumizona, pirafluprol, piriprol, hidrametilnón, triazamato, sulfoxaflor, 45 flupiradifurona, ivermectina, selamectina, moxidectina, doramectina, eprinomectina, oxima de milbemicina, dietilcarbamazina citrato, deet, metoxadiazona, ciromazina, triflumurón, aceite de anís estrellado, triclabendazol, flubendazol, fenbendazol, gluconato de antimonio y sodio, clorhidrato de levamisol, bitionol, diclorofeno, fenotiazina, bisulfuro de piperazina de carbono, fosfato de piperazina, adipato de piperazina, citrato de piperazina, diclorhidrato de melarsomina, metiridina, santonina, pamoato de pirantel, pirantel, praziquantel, febantel, emodepsida, derquantel, 50 monapantel, benzoato de emamectina, cicloaprid, y un compuesto representado por la siguiente Fórmula (VI), o sales de adición ácida de estas que están disponibles como químicos agrícolas y veterinarios. Los ejemplos de sales de adición ácida de estos incluyen sales de clorhidrato, sales de nitrato, sales de sulfato, sales de fosfato o sales de acetato o similares.

55 [Métodos de síntesis de los compuestos de la invención, precursores de los mismos y compuestos comparativos]

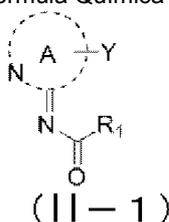
Un compuesto representado por la siguiente Fórmula (I-1)

[Fórmula Química 24]



5 Puede obtenerse haciendo reaccionar un compuesto representado por la siguiente Fórmula (II-1) con un compuesto representado por ArCH₂X [la definición de Ar, A, Y y R₁ tiene el mismo significado que se describe anteriormente y X representa un átomo halógeno u OTs, OMs y similares] en presencia o ausencia de una base.

[Fórmula Química 25]



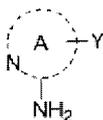
10 Cuando la reacción se realiza en presencia de una base, es posible usar, por ejemplo, un hidruro de metal alcalino tal como hidruro sódico y similares, un carbonato tal como carbonato potásico o carbonato sódico y similares, un hidróxido de metal alcalino tal como hidróxido potásico, hidróxido sódico y similares, aminas terciarias tales como trietilamina, 1,8-diazabicyclo[4.3.0]non-5-eno y similares y piridinas no sustituidas o que contienen sustituyentes, tales como piridina, 4-dimetilaminopiridina y similares, como la base.

15 La reacción puede realizarse sin un disolvente o usando un disolvente que no afecte a la reacción y cuando se usa el disolvente, es posible usar disolventes tales como, por ejemplo, amidas tales como N,N-dimetilformamida y N,N-dimetilacetamida, nitrilos tales como acetonitrilo, sulfóxidos tales como dimetilsulfóxido, éteres tales como éter de dietilo y tetrahidrofurano, ésteres tales como acetato de etilo y acetato de butilo, hidrocarburos aromáticos tales como benceno, xileno y tolueno, alcoholes tales como metanol, etanol, propanol y alcohol isopropílico, cetonas tales como acetona y metil etil cetona, hidrocarburos alifáticos tales como hexano, heptano y octano e hidrocarburos halógenos tales como diclorometano, cloroformo, clorobenceno y diclorobenceno, bien solos o en combinación de dos o más de los mismos, pero se usan preferentemente N,N-dimetilformamida y similares.

25 La reacción puede realizarse habitualmente de 0 °C a 200 °C y se prefiere que los reactivos se añadan de 20 °C a 40 °C y la reacción se realice de 60 °C a 80 °C.

30 El compuesto representado por la Fórmula (II-1) puede obtenerse haciendo reaccionar un compuesto representado por R₁-C(=O)X, R₁-C(=O)OC(=O)R₁, R₁C(=O)OR' [X representa un átomo halógeno u OTs, OMs y similares, R' representa un grupo alquilo C₁ a C₆ y la definición de R₁, A e Y tiene el mismo significado que la definición descrita anteriormente] y similares con un compuesto representado por en la siguiente fórmula (II) en presencia o ausencia de una base.

[Fórmula Química 26]



35 Cuando la reacción se realiza en presencia de una base, es posible usar, por ejemplo, un hidruro de metal alcalino tal como hidruro sódico y similares, un carbonato tal como carbonato potásico y similares o carbonato sódico y similares, un hidróxido de metal alcalino tal como hidróxido potásico, hidróxido sódico y similares, aminas terciarias tales como trietilamina, 1,8-diazabicyclo[4.3.0]non-5-eno y similares y piridinas no sustituidas o que contienen sustituyentes, tales como piridina, 4-dimetilaminopiridina y similares, como la base.

40

La reacción puede realizarse sin un disolvente o usando un disolvente que no afecte a la reacción. Cuando se usa el disolvente, es posible usar disolventes tales como, por ejemplo, amidas tales como N,N-dimetilformamida y N,N-dimetilacetamida, nitrilos tales como acetonitrilo, sulfóxidos tales como dimetilsulfóxido, éteres tales como éter de dietilo y tetrahidrofurano, ésteres tales como acetato de etilo y acetato de butilo, hidrocarburos aromáticos tales como benceno, xileno y tolueno, alcoholes tales como metanol, etanol y propanol, cetonas tales como acetona y metil etil cetona, hidrocarburos alifáticos tales como hexano, heptano y octano, hidrocarburos halógenos tales como diclorometano, cloroformo, clorobenceno y diclorobenceno, bien solos o en combinación de dos o más de los mismos, pero se usan preferentemente tolueno, N,N-dimetilformamida, acetonitrilo, éteres, diclorometano, cloroformo y similares.

La reacción puede realizarse habitualmente de -80 °C a 100 °C y se realiza preferentemente en un intervalo de 20 °C a 50 °C.

El compuesto representado por la Fórmula (II-1) puede obtenerse haciendo reaccionar el compuesto representado por la fórmula (III) con un ácido carboxílico representado por R1-COOH [la definición de R1 tiene el mismo significado que la definición descrita anteriormente] usando un agente de condensación de deshidratación en presencia o ausencia de una base, o puede obtenerse realizando la reacción usando pentaóxido de fósforo, ácido sulfúrico, ácido polifosfórico, cloruro de tionilo, oxiclóruo de sodio y dicloruro de oxalilo en ausencia de una base.

Es posible usar un compuesto basado en carbodiimida tal como dicitclohexilcarbodiimida, clorhidrato de 1-etil-3-(3-dimetilaminopropil)-carbodiimida y similares como el agente de condensación de deshidratación.

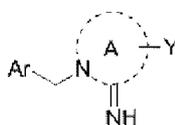
Cuando la reacción se realiza en presencia de una base, es posible usar, por ejemplo, un carbonato tal como carbonato potásico o carbonato sódico y similares, aminas terciarias tales como trietilamina, 1,8-diazabicyclo[4.3.0]non-5-eno y similares y piridinas no sustituidas o que contienen sustituyentes, tales como piridina, 4-dimetilaminopiridina y similares, como la base.

La reacción se realiza preferentemente usando un disolvente, y es posible usar disolventes tales como, por ejemplo, amidas tales como N,N-dimetilformamida y N,N-dimetilacetamida, nitrilos tales como acetonitrilo, sulfóxidos tales como dimetilsulfóxido, éteres tales como éter de dietilo y tetrahidrofurano, ésteres tales como acetato de etilo y acetato de butilo, hidrocarburos aromáticos tales como benceno, xileno y tolueno, cetonas tales como acetona y metil etil cetona, hidrocarburos alifáticos tales como hexano, heptano y octano, hidrocarburos halógenos tales como diclorometano, cloroformo, clorobenceno y diclorobenceno, bien solos o en combinación de dos o más de los mismos, pero se usan preferentemente N,N-dimetilformamida, acetonitrilo, éteres, diclorometano, cloroformo y similares.

La reacción puede realizarse habitualmente de -80 °C a 100 °C y se realiza preferentemente en un intervalo de 20 °C a 50 °C.

El compuesto representado por la Fórmula (I-1) puede obtenerse haciendo reaccionar un compuesto representado por R1-C(=O)X, R1-C(=O)OC(=O)R1, R1C(=O)OR' [X representa un átomo halógeno u OTs, OMs y similares, R' representa un grupo alquilo C1 a C6 y la definición de Ar, A, R1 e Y tiene el mismo significado que la definición descrita anteriormente] y similares con un compuesto representado por en la siguiente fórmula (IV) en presencia o ausencia de una base.

[Fórmula Química 27]



(IV)

Cuando la reacción se realiza en presencia de una base, es posible usar, por ejemplo, un hidruo de metal alcalino tal como hidruo sódico y similares, un carbonato tal como carbonato potásico o carbonato sódico y similares, un hidróxido de metal alcalino tal como hidróxido potásico, hidróxido sódico y similares, aminas terciarias tales como trietilamina, 1,8-diazabicyclo[4.3.0]non-5-eno y similares y piridinas no sustituidas o que contienen sustituyentes, tales como piridina, 4-dimetilaminopiridina y similares, como la base.

La reacción puede realizarse sin un disolvente o usando un disolvente que no afecte a la reacción. Cuando se usa el disolvente, es posible usar disolventes tales como, por ejemplo, amidas tales como N,N-dimetilformamida y N,N-dimetilacetamida, nitrilos tales como acetonitrilo, sulfóxidos tales como dimetilsulfóxido, éteres tales como éter de dietilo y tetrahidrofurano, ésteres tales como acetato de etilo y acetato de butilo, hidrocarburos aromáticos tales como benceno, xileno y tolueno, alcoholes tales como metanol, etanol y propanol, cetonas tales como acetona y

metil etil cetona, hidrocarburos alifáticos tales como hexano, heptano y octano, hidrocarburos halógenos tales como diclorometano, cloroformo, clorobenceno y diclorobenceno y agua, bien solos o en combinación de dos o más de los mismos, se usan preferentemente tolueno, N,N-dimetilformamida, acetonitrilo, éteres, diclorometano, cloroformo o similares.

5 La reacción puede realizarse habitualmente de -80 °C a 100 °C y se realiza preferentemente en un intervalo de 20 °C a 50 °C. El compuesto representado por la Fórmula (I-1) puede obtenerse haciendo reaccionar el compuesto representado por la fórmula (IV) con un ácido carboxílico representado por R1-COOH [la definición de R1 - tiene el mismo significado que la definición descrita anteriormente] usando un agente de condensación de deshidratación en presencia o ausencia de una base, o puede obtenerse realizando la reacción usando pentaóxido de fósforo, ácido sulfúrico, ácido polifosfórico, cloruro de tionilo, oxiclorigenato de fósforo y dicloruro de oxalilo en ausencia de una base.

15 Es posible usar un compuesto basado en carbodiimida tal como dicitohexilcarbodiimida, clorhidrato de 1-etil-3-(3-dimetilaminopropil)-carbodiimida y similares como el agente de condensación de deshidratación.

20 Cuando la reacción se realiza en presencia de una base, es posible usar, por ejemplo, un carbonato tal como carbonato potásico o carbonato sódico y similares, aminas terciarias tales como trietilamina, 1,8-diazabicyclo[4.3.0]non-5-eno y similares y piridinas no sustituidas o que contienen sustituyentes, tales como piridina, 4-dimetilaminopiridina y similares, como la base.

25 La reacción se realiza preferentemente usando un disolvente, y es posible usar disolventes tales como, por ejemplo, amidas tales como N,N-dimetilformamida y N,N-dimetilacetamida, nitrilos tales como acetonitrilo, sulfóxidos tales como dimetilsulfóxido, éteres tales como éter de dietilo y tetrahidrofurano, ésteres tales como acetato de etilo y acetato de butilo, hidrocarburos aromáticos tales como benceno, xileno y tolueno, cetonas tales como acetona y metil etil cetona, hidrocarburos alifáticos tales como hexano, heptano y octano, hidrocarburos halógenos tales como diclorometano, cloroformo, clorobenceno y diclorobenceno, bien solos o en combinación de dos o más de los mismos, pero se usan preferentemente diclorometano, cloroformo y similares.

30 La reacción puede realizarse habitualmente de -80 °C a 100 °C y se realiza preferentemente en un intervalo de 20 °C a 50 °C. El compuesto representado por la Fórmula (IV) puede obtenerse haciendo reaccionar el compuesto representado por la Fórmula (III) con un compuesto representado por ArCH₂X [la definición de Ar y X tiene el mismo significado que la definición descrita anteriormente] en presencia o ausencia de una base.

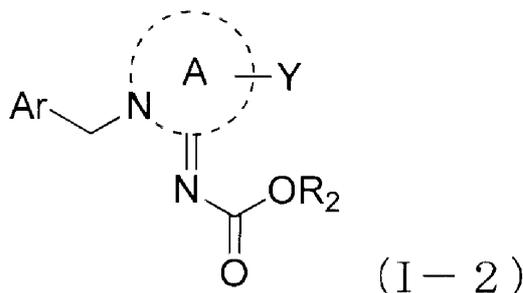
35 Cuando la reacción se realiza en presencia de una base, es posible usar, por ejemplo, un hidruro de metal alcalino tal como hidruro sódico, un carbonato tal como carbonato potásico o carbonato sódico, un hidróxido de metal alcalino tal como hidróxido potásico e hidróxido sódico, aminas terciarias tales como trietilamina y 1,8-diazabicyclo[4.3.0]non-5-eno y piridinas no sustituidas o que contienen sustituyentes, tales como piridina y 4-dimetilaminopiridina y similares como la base.

40 La reacción puede realizarse sin un disolvente o usando un disolvente que no afecte a la reacción. Cuando se usa el disolvente, es posible usar disolventes tales como, por ejemplo, amidas tales como N,N-dimetilformamida y N,N-dimetilacetamida, nitrilos tales como acetonitrilo, sulfóxidos tales como dimetilsulfóxido, éteres tales como éter de dietilo y tetrahidrofurano, ésteres tales como acetato de etilo y acetato de butilo, hidrocarburos aromáticos tales como benceno, xileno y tolueno, alcoholes tales como metanol, etanol y propanol, cetonas tales como acetona y metil etil cetona, hidrocarburos alifáticos tales como hexano, heptano y octano e hidrocarburos halógenos tales como diclorometano, cloroformo, clorobenceno y diclorobenceno y agua, bien solos o en combinación de dos o más de los mismos, pero se usan preferentemente tolueno, N,N-dimetilformamida, acetonitrilo, éteres, diclorometano, cloroformo o similares.

50 La reacción puede realizarse habitualmente de -80 °C a 100 °C y se realiza preferentemente en un intervalo de 20 °C a 80 °C.

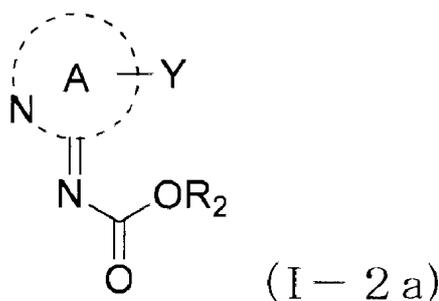
55 Cuando la Fórmula (I-1) se sintetiza a través de la Fórmula (II-1) a partir del compuesto representado por la Fórmula (III), o cuando la Fórmula (I-1) se sintetiza a través de la Fórmula (IV) a partir del compuesto representado por la Fórmula (III), la reacción puede realizarse continuamente sin sacar la Fórmula (II-1) o la Fórmula (IV), o las reacciones a partir de la Fórmula (III) a la Fórmula (I-1) pueden realizarse simultáneamente en el mismo recipiente.

[Fórmula Química 28]



5 Para explicación, el compuesto representado por la Fórmula (I-2) puede obtenerse haciendo reaccionar un compuesto representado por la siguiente Fórmula (I-2a) con un compuesto representado por ArCH_2X [la definición de Ar, A, Y y R_2 tiene el mismo significado que la definición descrita anteriormente y X representa un átomo halógeno u OTs, OMs y similares] en presencia o ausencia de una base.

[Fórmula Química 29]



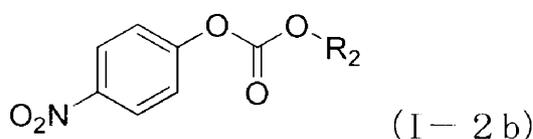
10 Cuando la reacción se realiza en presencia de una base, es posible usar, por ejemplo, un hidruro de metal alcalino tal como hidruro sódico y similares, un carbonato tal como carbonato potásico o carbonato sódico y similares, un hidróxido de metal alcalino tal como hidróxido potásico, hidróxido sódico y similares, aminas terciarias tales como trietilamina, 1,8-diazabicyclo[4.3.0]non-5-eno y similares y piridinas no sustituidas o que contienen sustituyentes, tales como piridina, 4-dimetilaminopiridina y similares, como la base.

15 La reacción puede realizarse sin un disolvente o usando un disolvente que no afecte a la reacción y cuando se usa el disolvente, es posible usar disolventes tales como, por ejemplo, amidas tales como N,N-dimetilformamida y N,N-dimetilacetamida, nitrilos tales como acetonitrilo, sulfóxidos tales como dimetilsulfóxido, éteres tales como éter de dietilo y tetrahidrofurano, ésteres tales como acetato de etilo y acetato de butilo, hidrocarburos aromáticos tales como benceno, xileno y tolueno, alcoholes tales como metanol, etanol, propanol y alcohol isopropílico, cetonas tales como acetona y metil etil cetona, hidrocarburos alifáticos tales como hexano, heptano y octano e hidrocarburos halógenos tales como diclorometano, cloroformo, clorobenceno y diclorobenceno, bien solos o en combinación de dos o más de los mismos, se usan preferentemente N,N-dimetilformamida y similares.

25 La reacción puede realizarse habitualmente de $0\text{ }^\circ\text{C}$ a $200\text{ }^\circ\text{C}$ y se prefiere que los reactivos se añadan de $20\text{ }^\circ\text{C}$ a $40\text{ }^\circ\text{C}$ y la reacción se realiza de $60\text{ }^\circ\text{C}$ a $80\text{ }^\circ\text{C}$.

30 El compuesto representado por la Fórmula (I-2a) puede obtenerse haciendo reaccionar el compuesto anteriormente descrito representado por la Fórmula (III) con un compuesto representado por $\text{R}_2\text{OC}(=\text{O})\text{X}$ (la definición de R_2 y X tiene el mismo significado que la definición descrita anteriormente) o representada por la siguiente Fórmula (I-2b) en presencia o ausencia de una base.

[Fórmula Química 30]



35

5 Cuando la reacción se realiza en presencia de una base, es posible usar, por ejemplo, un hidruro de metal alcalino tal como hidruro sódico y similares, un carbonato tal como carbonato potásico o carbonato sódico y similares, un hidróxido de metal alcalino tal como hidróxido potásico, hidróxido sódico y similares, aminas terciarias tales como trietilamina, 1,8-diazabicyclo[4.3.0]non-5-eno y similares y piridinas no sustituidas o que contienen sustituyentes, tales como piridina, 4-dimetilaminopiridina y similares, como la base.

10 La reacción puede realizarse sin un disolvente o usando un disolvente que no afecte a la reacción y cuando se usa el disolvente, es posible usar disolventes tales como, por ejemplo, amidas tales como N,N-dimetilformamida y N,N-dimetilacetamida, nitrilos tales como acetonitrilo, sulfóxidos tales como dimetilsulfóxido, éteres tales como éter de dietilo y tetrahidrofurano, ésteres tales como acetato de etilo y acetato de butilo, hidrocarburos aromáticos tales como benceno, xileno y tolueno, alcoholes tales como metanol, etanol, propanol y alcohol isopropílico, cetonas tales como acetona y metil etil cetona, hidrocarburos alifáticos tales como hexano, heptano y octano e hidrocarburos halógenos tales como diclorometano, cloroformo, clorobenceno y diclorobenceno, bien solos o en combinación de dos o más de los mismos, se usan preferentemente acetonitrilo, diclorometano y similares.

15 La reacción puede realizarse habitualmente de 0 °C a 200 °C y se realiza preferentemente de 20 °C a 80 °C.

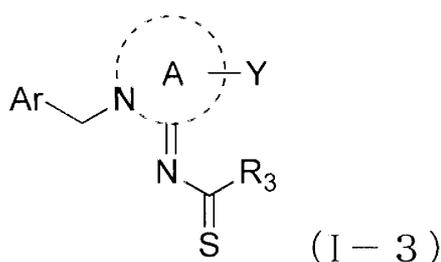
20 El compuesto representado por la Fórmula (I-2) puede obtenerse haciendo reaccionar el compuesto anteriormente descrito representado por la Fórmula (IV) con un compuesto representado por R₂OC(=O)X (la definición de R₂ y X tiene el mismo significado que la definición descrita anteriormente) o representada por la Fórmula (I-2b) anteriormente descrita en presencia o ausencia de una base.

25 Cuando la reacción se realiza en presencia de una base, es posible usar, por ejemplo, un hidruro de metal alcalino tal como hidruro sódico y similares, un carbonato tal como carbonato potásico o carbonato sódico y similares, un hidróxido de metal alcalino tal como hidróxido potásico, hidróxido sódico y similares, aminas terciarias tales como trietilamina, 1,8-diazabicyclo[4.3.0]non-5-eno y similares y piridinas no sustituidas o que contienen sustituyentes, tales como piridina, 4-dimetilaminopiridina y similares, como la base.

30 La reacción puede realizarse sin un disolvente o usando un disolvente que no afecte a la reacción y cuando se usa el disolvente, es posible usar disolventes tales como, por ejemplo, amidas tales como N,N-dimetilformamida y N,N-dimetilacetamida, nitrilos tales como acetonitrilo, sulfóxidos tales como dimetilsulfóxido, éteres tales como éter de dietilo y tetrahidrofurano, ésteres tales como acetato de etilo y acetato de butilo, hidrocarburos aromáticos tales como benceno, xileno y tolueno, alcoholes tales como metanol, etanol, propanol y alcohol isopropílico, cetonas tales como acetona y metil etil cetona, hidrocarburos alifáticos tales como hexano, heptano y octano e hidrocarburos halógenos tales como diclorometano, cloroformo, clorobenceno y diclorobenceno, bien solos o en combinación de dos o más de los mismos, se usan preferentemente acetonitrilo, diclorometano y similares.

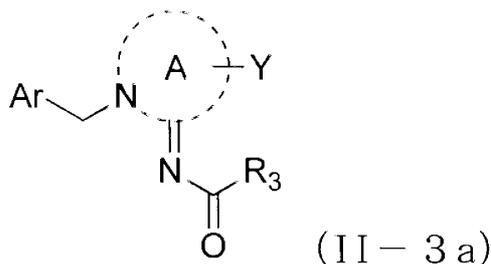
35 La reacción puede realizarse habitualmente de 0 °C a 200 °C y se realiza preferentemente de 20 °C a 80 °C.

40 [Fórmula Química 31]



45 El compuesto representado por la Fórmula (I-3) puede sintetizarse actuando un reactivo sulfurante sobre un compuesto (la definición de Ar, A Y y R₃ tiene el mismo significado que la definición descrita anteriormente) representado por la siguiente Fórmula (II-3a), que puede sintetizarse de la misma manera que se describe en la Fórmula (I-1), en presencia o ausencia de una base.

[Fórmula Química 32]



5 Cuando la reacción se realiza en presencia de una base, es posible usar, por ejemplo, un hidruro de metal alcalino tal como hidruro sódico y similares, un carbonato tal como carbonato potásico o carbonato sódico y similares, un hidróxido de metal alcalino tal como hidróxido potásico, hidróxido sódico y similares, aminas terciarias tales como trietilamina, 1,8-diazabicyclo[4.3.0]non-5-eno y similares y piridinas no sustituidas o que contienen sustituyentes, tales como piridina, 4-dimetilaminopiridina y similares, como la base, pero se usan preferentemente carbonato potásico, carbonato sódico o similares.

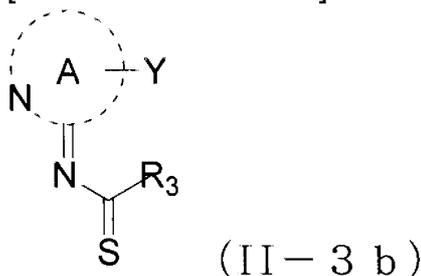
10 Como el reactivo sulfurante, puede usarse reactivo de Lawesson, sulfuro de hidrógeno y similares.

15 La reacción puede realizarse sin un disolvente o usando un disolvente que no afecte a la reacción y cuando se usa el disolvente, es posible usar disolventes tales como, por ejemplo, amidas tales como N,N-dimetilformamida y N,N-dimetilacetamida, nitrilos tales como acetonitrilo, sulfóxidos tales como dimetilsulfóxido, éteres tales como éter de dietilo y tetrahidrofurano, ésteres tales como acetato de etilo y acetato de butilo, hidrocarburos aromáticos tales como benceno, xileno y tolueno, alcoholes tales como metanol, etanol y propanol, cetonas tales como acetona y metil etil cetona, hidrocarburos alifáticos tales como hexano, heptano y octano e hidrocarburos halógenos tales como diclorometano, cloroformo, clorobenceno y diclorobenceno, bien solos o en combinación de dos o más de los mismos, pero se usan preferentemente tolueno, tetrahidrofurano y similares.

20 La reacción puede realizarse habitualmente de -80 °C a 100 °C y se realiza preferentemente en un intervalo de 20 °C a 80 °C.

25 El compuesto representado por la Fórmula (I-3) puede obtenerse haciendo reaccionar un compuesto representado por la siguiente Fórmula (II-3b) con un compuesto representado por ArCH₂X [la definición de Ar, A, Y y R₃ tiene el mismo significado que la definición descrita anteriormente y X representa un átomo halógeno u OTs, OMs y similares] en presencia o ausencia de una base.

[Fórmula Química 33]



30 Cuando la reacción se realiza en presencia de una base, es posible usar, por ejemplo, un hidruro de metal alcalino tal como hidruro sódico y similares, un carbonato tal como carbonato potásico o carbonato sódico y similares, un hidróxido de metal alcalino tal como hidróxido potásico, hidróxido sódico y similares, aminas terciarias tales como trietilamina, 1,8-diazabicyclo[4.3.0]non-5-eno y similares y piridinas no sustituidas o que contienen sustituyentes, tales como piridina, 4-dimetilaminopiridina y similares, como la base.

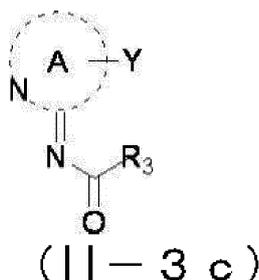
35 La reacción puede realizarse sin un disolvente o usando un disolvente que no afecte a la reacción y cuando se usa el disolvente, es posible usar disolventes tales como, por ejemplo, amidas tales como N,N-dimetilformamida y N,N-dimetilacetamida, nitrilos tales como acetonitrilo, sulfóxidos tales como dimetilsulfóxido, éteres tales como éter de dietilo y tetrahidrofurano, ésteres tales como acetato de etilo y acetato de butilo, hidrocarburos aromáticos tales como benceno, xileno y tolueno, alcoholes tales como metanol, etanol propanol y alcohol isopropílico, cetonas tales como acetona y metil etil cetona, hidrocarburos alifáticos tales como hexano, heptano y octano e hidrocarburos halógenos tales como diclorometano, cloroformo, clorobenceno y diclorobenceno, bien solos o en combinación de dos o más de los mismos, pero se usa preferentemente N,N-dimetilformamida.

45

La reacción puede realizarse habitualmente de 0 °C a 200 °C y se prefiere que los reactivos se añadan de 20 °C a 40 °C y la reacción se realiza de 60 °C a 80 °C.

Un compuesto representado por la siguiente Fórmula (II-3b) puede sintetizarse actuando un reactivo sulfurante sobre un compuesto (la definición de A, Y y R₃ tiene el mismo significado que la definición descrita anteriormente) representado por la siguiente Fórmula (II-3c), que puede sintetizarse de la misma manera que se describe en la Fórmula (II-1), en presencia o ausencia de una base.

[Fórmula Química 34]



Cuando la reacción se realiza en presencia de una base, es posible usar, por ejemplo, un hidruro de metal alcalino tal como hidruro sódico y similares, un carbonato tal como carbonato potásico o carbonato sódico y similares, un hidróxido de metal alcalino tal como hidróxido potásico, hidróxido sódico y similares, aminas terciarias tales como trietilamina, 1,8-diazabicyclo[4.3.0]non-5-eno y similares y piridinas no sustituidas o que contienen sustituyentes, tales como piridina, 4-dimetilaminopiridina y similares, como la base, pero se usan preferentemente carbonato potásico, carbonato sódico o similares.

Como el reactivo sulfurante, puede usarse pentasulfuro de fósforo, reactivo de Lawesson, sulfuro de hidrógeno y similares.

La reacción puede realizarse sin un disolvente o usando un disolvente que no afecte a la reacción y cuando se usa el disolvente, es posible usar disolventes tales como, por ejemplo, amidas tales como N,N-dimetilformamida y N,N-dimetilacetamida, nitrilos tales como acetonitrilo, sulfóxidos tales como dimetilsulfóxido, éteres tales como éter de dietilo y tetrahidrofurano, ésteres tales como acetato de etilo y acetato de butilo, hidrocarburos aromáticos tales como benceno, xileno y tolueno, alcoholes tales como metanol, etanol y propanol, cetonas tales como acetona y metil etil cetona, hidrocarburos alifáticos tales como hexano, heptano y octano e hidrocarburos halógenos tales como diclorometano, cloroformo, clorobenceno y diclorobenceno, bien solos o en combinación de dos o más de los mismos, pero se usan preferentemente tolueno, N,N-dimetilformamida, acetonitrilo, éteres, diclorometano y cloroformo.

La reacción puede realizarse habitualmente de -80 °C a 100 °C y se realiza preferentemente en un intervalo de 20 °C a 80 °C.

Ejemplos

Posteriormente, la presente invención se describirá específicamente con referencia a los Ejemplos, pero la presente invención no se limita a los Ejemplos. Los siguientes ejemplos de referencia no son parte de la invención, pero se describen en el presente documento para fines comparativos.

Ejemplo de Referencia 1:

N-[1-((6-cloropiridin-3-il)metil)piridin-2(1H)-iliden-2,2,2-trifluoroacetamida (Compuesto P212)

(1) Se disolvieron 25 g (270 mmol) de 2-aminopiridina en 200 ml de diclorometano anhidro, se añadió 41 ml (30 g, 300 mmol) de trietilamina al mismo, y la mezcla se enfrió a 0 °C. Se añadieron gota a gota 38 ml (57 g, 270 mmol) de ácido trifluoroacético anhidro al mismo durante 15 minutos y la mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante 2 horas. Después de que la reacción se completara, la solución de reacción se inyectó en aproximadamente 100 ml de agua helada y la mezcla se agitó durante 10 minutos. La mezcla se transfirió a un embudo separador para realizar una separación de líquidos y la capa orgánica se lavó dos veces con 150 ml de agua y dos veces con 150 ml de una solución acuosa de HCl al 1 %, se secó sobre sulfato magnésico anhidro y se concentró a presión reducida para obtener 36 g (rendimiento del 71 %) de 2,2,2-trifluoro-N-(piridin-2(1H)-iliden)acetamida.

RMN-1H (CDCl₃, δ, ppm) 7,20 (1H, ddd), 7,83 (1H, td), 8,20 (1H, d), 8,35 (1H, d), 10,07 (1H, a)
 RMN-13C (CDCl₃, δ, ppm): 115,3, 115,5(q), 121,6, 139,1, 147,9, 149,5, 155,3(q)

MS:m/z=191 (M+H)

(2) 20 g (126 mmol) de 2-cloro 5-clorometil piridina se disolvieron en 200 ml de acetonitrilo anhidro, 24 g (126 mmol) de 2,2,2-trifluoro-N-(piridin-2(1H)-iliden)acetamida obtenida mediante el método descrito anteriormente y 21 g (151 mmol) de carbonato potásico se añadieron al mismo y la mezcla resultante se calentó y se dejó a reflujo durante 6 horas, y después se agitó a temperatura ambiente durante 10 horas. Después de que la reacción se completara, la solución de reacción se filtró y el filtrado se concentró a presión reducida. Se añadió éter de dietilo al mismo durante cristalización y los cristales obtenidos de esta manera se recogieron y se lavaron bien con éter de dietilo y agua. Los cristales obtenidos de esta manera se secaron a presión reducida a 60 °C durante 1 hora para obtener el material objeto. Cantidad obtenida 26 g (rendimiento del 66 %).

RMN-1H (CDCl₃, δ, ppm): 5,57 (2H, s), 6, 92 (1H, td), 7,31 (1H, d), 7,80 (1H, td), 7,87 (1H, dd), 7,99 (1H, dd), 8,48 (2H, m)

RMN-13C (CDCl₃, δ, ppm): 53,8, 115,5, 117,2(q), 122,1, 124,7, 130,0, 139,2, 140,0, 142,5, 149,7, 151,8, 158,9, 163,5 (q)

MS: m/z=316 (M+H)

(3) Análisis de cristal en polvo de rayos X

En la difracción de rayos X en polvo, la medición se realizó bajo las siguientes condiciones.

Nombre del dispositivo: RINT-2200 (Rigaku Corporation)

Rayos X: Cu-Ka (40 kV, 20 mA)

Intervalo de barrido: 4 a 40°, anchura de muestreo: 0,02° y velocidad de barrido: 1°/min

Los resultados son como sigue.

Ángulo de difracción (2θ) 8,7°, 14,2°, 17,5°, 18,3°, 19,8°, 22,4°, 30,9° y 35,3°

(4) Calorimetría diferencial de barrido (DSC)

En la calorimetría diferencial de barrido, la medición se realizó bajo las siguientes condiciones.

Nombre del dispositivo: DSC-60

Celda de muestreo: aluminio

Intervalo de temperatura: 50 °C a 250 °C (velocidad de calentamiento: 10 °C/min)

Como resultado, el punto de fusión se observó de 155 °C a 158 °C.

Otro método del Ejemplo de Referencia 1

3,00 g (18,6 mmol) de 2-cloro-5-clorometil piridina se disolvieron en 20 ml de DMF anhidro, se añadieron 1,75 g (18,6 mmol) de 2-aminopiridina al mismo y la mezcla resultante se agitó a 80 °C durante 8 horas y a temperatura ambiente durante 5 horas. Después de que la reacción se completara, se destiló el DMF a presión reducida, se añadió acetonitrilo al mismo para precipitar un sólido, y el sólido se recogió, se lavó bien con acetonitrilo y se secó para obtener 2,07 g (rendimiento del 44 %) de clorhidrato de 1-[(6-cloropiridin-3-il)metil]piridin-2(1H)-imina.

RMN-1H (DMSO-d₆, δ, ppm): 5,65(2H, s), 6,96(1H, t), 7,23(1H, m), 7,57(1H, d), 7,80(1H, m), 7,91(1H, m), 8,28(1H, m), 8,49(1H, d), 9,13(2H, s a)

50 mg (0,20 mmol) del clorhidrato de 1-[(6-cloropiridin-3-il)metil]piridin-2(1H)-imina obtenido por el método anteriormente descrito se disolvieron en 5 ml de diclorometano anhidro, se añadieron 122 mg (1,00 mmol) de DMAP y 50 mg (0,24 mmol) de ácido trifluoroacético anhidro al mismo en secuencia en condiciones de frío en hielo y la mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante 1 hora. Después de que la reacción se completara, la solución de reacción se diluyó con diclorometano, se lavó con ácido clorhídrico al 1 % y después se secó durante anhidro sulfato magnésico. El diclorometano se destiló a presión reducida para obtener el material objeto. Cantidad obtenida 42 mg (rendimiento del 67 %). La RMN fue la misma que la del método anteriormente descrito.

Ejemplo de Referencia 2:

2-2- dibromo-N-[1-((6-cloropiridin-3-il)metil)piridin-2(1H)-iliden]-acetamida (Compuesto P241)

200 mg (0,78 mmol) del clorhidrato de 1-[(6-cloropiridin-3-il)metil]piridin-2(1H)-imina obtenido por el método descrito en otro método del Ejemplo de Referencia 1, 238 mg (1,95 mmol) de DMAP y 224 mg (1,17 mmol) de EDC-HCl se disolvieron en 10 ml de diclorometano anhidro, se añadieron 101 ml (202 mg, 1,17 mmol) de ácido dibromoacético al mismo y la mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante toda la noche. Después de que la reacción se completara, la solución de reacción se diluyó con diclorometano, se lavó una vez con agua y dos veces con una solución acuosa de HCl al 1 % y después se secó sobre sulfato magnésico anhidro y se concentró a presión reducida para obtener el material objeto. Cantidad obtenida 50 mg (rendimiento del 15 %)

RMN-1H (CDCl₃, δ, ppm): 5,56(2H, s), 5,99(1H, s), 6,78(1H, td), 7,33(1H, d), 7,69(1H, td), 7,76(1H, dd), 7,93(1H, dd), 8,39(1H, d), 8,50(1H, d)

RMN-13C (CDCl₃, δ, ppm) : 44,6, 53,1, 113,7, 121,9, 124,8, 130,1, 138,2, 139,7, 141,2, 149,5, 152,0, 159,4, 172,2

Ejemplo de Referencia 3:

N-[1-((6-cloro-5-fluoropiridin-3-il)metil)piridin-2(1H)-iliden]-2,2,2-trifluoroacetamida (Compuesto P227)

5 Se disolvieron 4,00g (27,6 mmol) de 2-cloro-3-fluoro-5-metilo piridina en 80 ml de tetracloruro de carbono, se añadieron 7,37 g (41,4 mmol) de N-bromosuccinimida y 20 mg de peróxido de benzoilo al mismo y la mezcla resultante se calentó y se dejó a reflujo durante toda la noche. Después de que la reacción se completara, la solución de reacción se devolvió a temperatura ambiente, se concentró a presión reducida y se purificó por cromatografía en columna en gel de sílice (hexano: acetato de etilo = 19:1) para obtener 3,06 g (rendimiento 51 %) de 5-(bromometil)-2-cloro-3-fluoropiridina.

10 RMN-1H (CDCl₃, δ, ppm) : 4,45(2H, s), 7,54(1H, td), 8,23(1H, s)

Se disolvieron 50 mg (0,22 mmol) de la 5-(bromometil)-2-cloro-3-fluoropiridina obtenida por el método anteriormente mencionado en 5 ml de anhidro acetonitrilo, 42 mg (0,22 mmol) de 2,2,2-trifluoro-N-(piridin-2(1H)-iliden)acetamida obtenida por el método descrito en (1) del Ejemplo de Referencia 1 y se añadieron 36 mg (0,26 mmol) de carbonato potásico al mismo en secuencia y la mezcla resultante se calentó y se dejó a reflujo durante 7 horas. Después de que la reacción se completara, la solución de reacción se devolvió a temperatura ambiente para filtrar materiales insolubles y el filtrado se concentró a presión reducida. Se añadió éter de dietilo al mismo para precipitar un sólido y de esta manera el sólido se recogió, se lavó con éter de dietilo y después se secó a presión reducida en un desecador para obtener el material objeto. Cantidad obtenida 29 mg (rendimiento del 40 %).

20 RMN-1H (CDCl₃, δ, ppm) : 5,54 (2H, s), 6,89(1H, td), 7,76(1H, dd), 7,80(1H, td), 7,85(1H, d), 8,29(1H, d), 8,57(1H, d)

Ejemplo de Referencia 4:

N-[1-((6-fluoropiridin-3-il)metil)piridin-2(1H)-iliden]-2,2,2-trifluoroacetamida (Compuesto P229)

25 500 mg (4,50 mmol) de 2-fluoro-5-metilo piridina se disolvieron en 50 ml de tetracloruro de carbono, se añadieron 1,20 g (6,76 mmol) de N-bromosuccinimida y 20 mg de peróxido de benzoilo al mismo y la mezcla resultante se calentó y se dejó a reflujo durante 2,5 horas. Después de que la reacción se completara, la solución de reacción se devolvió a temperatura ambiente y el disolvente se destiló a presión reducida y se purificó por cromatografía en columna en gel de sílice (hexano: acetato de etilo = 19:1) para obtener 300 mg (rendimiento del 35 %) de 5-bromometilo-2-fluoropiridina.

35 57 mg (0,30 mmol) de la 5-bromometilo-2-fluoropiridina obtenida por el método anteriormente mencionado se disolvieron en 10 ml de anhidro acetonitrilo, 57 mg (0,30 mmol) de 2,2,2-trifluoro-N-(piridin-2(1H)-iliden)acetamida sintetizada por el método descrito en (1) del Ejemplo de Referencia 1 y 69 mg (0,50 mmol) de carbonato potásico se añadieron al mismo en secuencia y la mezcla resultante se calentó y se dejó a reflujo durante 6 horas. Después de que la reacción se completara, la solución de reacción se devolvió a temperatura ambiente para filtrar materiales insolubles y el filtrado se concentró a presión reducida. El filtrado se purificó por cromatografía en columna en gel de sílice (hexano: acetato de etilo = 1:1 → 3:1) para obtener el material objeto. Cantidad obtenida 21 mg (rendimiento del 23 %).

40 RMN-1H (CDCl₃, δ, ppm): 5,56 (2H, s), 6,89 (1H, td), 6,94 (1H, d), 7,79 (1H, td), 7,87 (1H, d), 8,03 (1H, m), 8,31 (1H, s), 8,54(1H, d)

MS: m/z = 300(M+H)

Ejemplo de Referencia 5:

N-[1-((6-bromopiridin-3-il)metil)piridin-2(1H)-iliden]-2,2,2-trifluoroacetamida (Compuesto P231)

50 500 mg (2,92 mmol) de 2-bromo-5-metilopiridina se disolvieron en 15 ml de tetracloruro de carbono, se añadieron 623 mg (3,50 mmol) de N-bromosuccinimida y 10 mg de peróxido de benzoilo al mismo y la mezcla resultante se calentó y se dejó a reflujo durante 19 horas. Después de que la reacción se completara, la solución de reacción se devolvió a temperatura ambiente, se concentró a presión reducida y se purificó por cromatografía en columna en gel de sílice (hexano: acetato de etilo = 19:1) para obtener 143 mg (rendimiento 20 %) de 2-bromo-5-bromometilopiridina.

55 RMN-1H (CDCl₃, δ, ppm): 4,42 (2H, s), 7,47(1H, d), 7,59(1H, dd), 8,38(1H, d)

60 70 mg (0,28 mmol) de la 2-bromo-5-bromometilopiridina obtenida por el método anteriormente mencionado se disolvieron en 10 ml de anhidro acetonitrilo, se añadieron 54 mg (0,28 mmol) de 2,2,2-trifluoro-N-(piridin-2(1H)-iliden)acetamida sintetizada por el método descrito en (1) del Ejemplo de Referencia 1 y 46 mg (0,34 mmol) de carbonato potásico al mismo en secuencia, y la mezcla resultante se calentó y se dejó a reflujo durante 6 horas. Después de que la reacción se completara, la solución de reacción se devolvió a temperatura ambiente para filtrar materiales insolubles, y el filtrado se concentró a presión reducida. Se añadió éter de dietilo al mismo para precipitar un sólido y de esta manera el sólido se recogió, se lavó con éter de dietilo y después se secó a presión reducida en un desecador para obtener el material objeto. Cantidad obtenida 81 mg (rendimiento del 82 %).

65 RMN-1H (CDCl₃, δ, ppm): 5,52 (2H, s), 6,88(1H, t), 7,48 (1H, d), 7,78(2H, m), 7,84(1H, d), 8,44(1H, d), 8,53(1H, d)
MS:m/z = 360(M+H)

Ejemplo de Referencia 6:

2-cloro-N-[1-((6-cloropiridin-3-il)metil)piridin-2(1H)-iliden]-acetamida (Compuesto P236)

5 70 mg (0,27 mmol) del clorhidrato de 1-[(6-cloropiridin-3-il)metil]piridin-2(1H)-imina obtenido por el método descrito en otro método del Ejemplo de Referencia 1 se disolvieron en 4 ml de diclorometano anhidro, se añadieron 82 mg (0,67 mmol) de DMAP, 25mg (0,27 mmol) de ácido cloroacético y 62 mg (0,32 mmol) de EDC-HCl al mismo en secuencia y la mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante toda la noche. Después de que la reacción se completara, se añadió diclorometano al mismo para diluir la mezcla y la mezcla se lavó con agua y una
10 solución acuosa de HCl al 1 %, se secó sobre sulfato magnésico anhidro y se concentró a presión reducida para obtener el material objeto. Cantidad obtenida 4 mg (rendimiento del 5 %).
RMN-1H (CDCl₃, δ, ppm): 4, 17 (2H, s), 5,46(2H, s), 6,64(1H, td), 7,31(1H, d), 7,60(1H, td), 7,64(1H, dd), 7,80(1H, dd), 8,32(1H, d), 8,45(1H, d)
MS:m/z = 296(M+H)

Ejemplo de Referencia 7:

N-[1-((6-cloropiridin-3-il)metil)piridin-2(1H)-iliden]-2,2-difluoroacetamida (Compuesto P238)

20 400 mg (4,26 mmol) de 2-aminopiridina se disolvieron en 10 ml de anhidro diclorometano, se añadieron 322 ml (490 mg, 5,11 mmol) de ácido difluoroacético, 982 mg (5,10 mmol) de EDC-HCl y 622 mg (5,11 mmol) de DMAP al mismo y la mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante 61 horas. Después de que la reacción se completara, la solución de reacción se diluyó con diclorometano, se lavó una vez con agua y dos veces con una
25 solución acuosa de HCl al 1 % y después se secó sobre sulfato magnésico anhidro y se concentró a presión reducida para obtener 102 mg (rendimiento del 14 %) de 2,2-difluoro-N-(piridin-2(1H)-iliden)acetamida.
RMN-1H (CDCl₃, δ, ppm): 6,03(1H, t), 7,15(1H, m), 7,78(1H, td), 8,20(1H, d), 8,34(1H, dd), 8,72(1H, s a)

30 100 mg (0,58 mmol) de la 2,2-difluoro-N-(piridin-2(1H)-iliden)acetamida obtenida por el método anteriormente mencionado se disolvieron en 10 ml de anhidro acetonitrilo, se disolvieron 94 mg (0,58 mmol) de 2-cloro-5-clorometilpiridina en 5 ml de acetonitrilo anhidro y se añadieron al mismo y posteriormente se añadieron 84 mg (0,63 mmol) de carbonato potásico al mismo y la mezcla resultante se calentó y se dejó a reflujo durante 140 minutos. Después de que la reacción se completara, la solución de reacción se devolvió a temperatura ambiente para filtrar materiales insolubles y el filtrado se concentró a presión reducida. Se añadió éter al mismo para precipitar un sólido y de esta manera el sólido se recogió y se secó bien para obtener el material objeto. Cantidad obtenida 63 mg
35 (rendimiento del 37 %).
RMN-1H (CDCl₃, δ, ppm): 5,52(2H, s), 5,90(1H, t), 6,79(1H, td), 7,33(1H, d), 7,71(1H, m), 7,77(1H, dd), 7,85(1H, dd), 8,45(1H, d), 8,50(1H, d)
RMN-13C (DMSO-d₆, δ, ppm): 53,0, 111,0(t), 115,2, 120,7, 124,7, 131,7, 140,6, 141, 6, 143,2, 150,4, 150,9, 158,3, 169,4(t)
40 MS:m/z = 298 (M+H)

Ejemplo de Referencia 8:

2-cloro-N-[1-((6-cloropiridin-3-il)metil)piridin-2(1H)-iliden]-2,2-difluoroacetamida (Compuesto P239)

45 200 mg (2,13 mmol) de 2-aminopiridina se disolvieron en 5 ml de diclorometano, se añadieron 491 mg (2,55 mol) de EDC-HCl, 311 mg (2,55 mmol) de DMAP y 187 ml (2,23 mmol, 290 mg) de ácido clorodifluoroacético al mismo en secuencia y la mezcla resultante se agitó durante toda la noche. Después de que la reacción se completara, la solución de reacción se diluyó con diclorometano, se lavó con agua y ácido clorhídrico al 1 % y después se secó sobre sulfato magnésico anhidro para obtener 105 mg (rendimiento del 24 %) de 2-cloro-2,2-difluoro-N-(piridin-2(1H)-iliden)acetamida.
50 RMN-1H (CDCl₃, δ, ppm): 7,19(1H, dd), 7,82(1H, m), 8,18(1H, d), 8,36(1H, d), 9,35(1H, s a)

55 53 mg (0,33 mmol) de 2-cloro-5-clorometilo piridina disueltos en 6 ml de anhidro acetonitrilo se añadieron a 68 mg (0,33 mmol) de la 2-cloro-2,2-difluoro-N-(piridin-2(1H)-iliden)acetamida sintetizada por el método anteriormente mencionado y posteriormente, 50 mg (0,36 mmol) de carbonato potásico se añadieron al mismo y la mezcla resultante se calentó y se dejó a reflujo durante 1 hora. Después de que la reacción se completara, la solución de reacción se devolvió a temperatura ambiente y después se concentró a presión reducida. Se añadió éter de dietilo al mismo para precipitar un sólido y de esta manera el sólido se recogió y se secó para obtener el material objeto.
60 Cantidad obtenida 49 mg (rendimiento 45 %).
RMN-1H (CDCl₃, δ, ppm): 5,56(2H, s), 6,92(1H, t), 7,33(1H, d), 7,82(1H, m), 7,91(1H, dd), 8,02(1H, d), 8,45(1H, d), 8,48(1H, d)
RMN-13C (CDCl₃, δ, ppm): 53,8, 115,2, 120,1 (t), 122,1, 124,8, 139,0, 140,0, 142,3, 150,0, 151,9, 159,1, 159,1, 165,8(t) MS:m/z = 332(M+H)

65

Ejemplo de Referencia 9:

2,2,2-tricloro-N-[1-((6-cloropiridin-3-il)metil)piridin-2(1H)-iliden]-acetamida (Compuesto P235)

- 5 70 mg (0,27 mmol) del clorhidrato de 1-[(6-cloropiridin-3-il)metilo]piridin-2(1H)-imina obtenido por el método descrito en otro método del Ejemplo de Referencia 1 se disolvieron en 4 ml de diclorometano anhidro, se añadieron 94 ml (0,68 mmol, 68 mg) de trietilamina y 33 mg (0,27 mmol, 49 mg) de cloruro de tricloroacetilo al mismo en secuencia y la mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante 1 hora. Después de que la reacción se completara, agua se añadió al mismo para parar la reacción y separación de líquidos se realizó con diclorometano y agua. La
 10 capa orgánica se lavó una vez con agua y dos veces con ácido clorhídrico al 1 %, se secó sobre sulfato magnésico anhidro y se concentró a presión reducida. Se añadió éter de dietilo al mismo para precipitar un sólido y de esta manera el sólido se recogió y se secó para obtener el material objeto. Cantidad obtenida 61 mg (rendimiento del 62 %).
 15 RMN-1H (CDCl₃, δ, ppm): 5,59(2H, s), 6,86(1H, t), 7,32(1H, d), 7,78(1H, td), 7,91(2H, m), 8,43(1H, d), 8,50(1H, d)
 MS:m/z = 364(M+H)

Ejemplo de Referencia 10:

N-[1-((6-cloropiridin-3-il)metil)piridin-2(1H)-iliden]-2,2,3,3,3-pentafluoropropanamida (Compuesto P242)

- 20 300 mg (3,19 mmol) de 2-aminopiridina se disolvieron en 15 ml de diclorometano anhidro, se añadieron 919 mg (4,78 mmol) de EDC-HCl, 583 mg (4,78 mmol) de DMAP y 397 ml (628 mg, 3,83 mmol) de ácido pentafluoropropiónico al mismo en secuencia y la mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante toda la noche. Después de que la reacción se completara, la solución de reacción se diluyó con diclorometano, se lavó una vez con agua y dos
 25 veces con ácido clorhídrico al 1 % y después se secó sobre sulfato magnésico anhidro y se concentró a presión reducida para obtener 85 mg (rendimiento del 11 %) de 2,2,3,3,3-pentafluoro-N-(piridin-2(1H)-iliden)propanamida.

- 30 52 mg (0,32 mmol) de 2-cloro-5-clorometilopiridina se disolvieron en 8 ml de acetonitrilo anhidro y se añadieron 49 mg (0,35 mmol) de carbonato potásico a 77 mg (0,32 mmol) de la 2,2,3,3,3-pentafluoro-N-(piridin-2(1H)-iliden)propanamida obtenida por el método anteriormente mencionado y la mezcla resultante se calentó y se dejó a reflujo durante 11 horas. Después de que la reacción se completara, la solución de reacción se devolvió a temperatura ambiente para filtrar materiales insolubles y el filtrado se concentró a presión reducida. El filtrado se purificó por cromatografía en columna en gel de sílice (hexano: acetato de etilo = 1:3) para obtener el material
 35 objeto. Cantidad obtenida 12 mg (rendimiento del 10 %).
 RMN-1H (CDCl₃, δ, ppm): 5,56(2H, s), 6,90(1H, td), 7,32(1H, d), 7,79(2H, m), 7,84(1H, d), 8,43(1H, d), 8,56(1H, d)
 MS:m/z = 366(M+H)

Ejemplo de Referencia 11:

- 40 N-[1-((2-cloropirimidin-5-il)metil)piridin-2(1H)-iliden]-2,2,2-trifluoroacetamida (Compuesto P243)

- 45 1,04 g (8,13 mmol) de 2-cloro-5-metil pirimidina se disolvieron en 30 ml de tetracloruro de carbono, se añadieron 1,73 g (9,75 mmol) de N-bromosuccinimida y 20 mg de peróxido de benzoilo al mismo y la mezcla resultante se calentó y se dejó a reflujo durante 6 horas. Después de que la reacción se completara, la solución de reacción se devolvió a temperatura ambiente, se concentró a presión reducida y se purificó por cromatografía en columna en gel de sílice (hexano: acetato de etilo = 3:1) para obtener 641 mg (rendimiento del 38 %) de 5-bromometil-2-cloropiridina.
 RMN-1H (CDCl₃, δ, ppm): 4,42(2H, s), 8,66(2H, s)

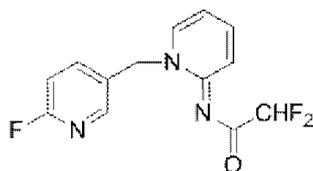
- 50 104 mg (0,50 mmol) de la 5-bromometil-2-cloropiridina obtenida por el método anteriormente mencionado se disolvieron en 6 ml de acetonitrilo anhidro, se añadieron 96 mg (0,50 mmol) de 2,2,2-trifluoro-N-(piridin-2(1H)-iliden)acetamida obtenida por el método descrito en (1) del Ejemplo de Referencia 1 y 76 mg (0,55 mmol) de carbonato potásico al mismo y la mezcla resultante se calentó y se dejó a reflujo durante 1 hora. Después de que la
 55 reacción se completara, la solución de reacción se devolvió a temperatura ambiente para filtrar materiales insolubles y el filtrado se concentró a presión reducida. Se añadió éter de dietilo al mismo para precipitar un sólido y de esta manera el sólido se recogió, se lavó con éter de dietilo y después se secó a presión reducida en un desecador para obtener el material objeto. Cantidad obtenida 92 mg (rendimiento del 58 %).
 60 RMN-1H (CDCl₃, δ, ppm): 5,54 (2H, s), 6,98(1H, m), 7,87(1H, m), 8,18(1H, m), 8,48(1H, m), 8,83(2H, m)
 RMN-13C (CDCl₃, δ, ppm): 60,0, 115,6, 117,1(q), 122,1, 127,5, 139,2, 142,9, 158,8, 160,3(2C), 161,4, 163,8(q)
 MS:m/z = 317(M+H)

Los compuestos P213 a P226, P228, P230, P232 a P234, P240 y P244 descritos en las Tablas 1 y 2 se obtuvieron de la misma manera que en los Ejemplos de Referencia 1 a 11.

65

Ejemplo de síntesis 1: (Ejemplo de Referencia - para explicación)

2,2-difluoro-N-[(6-fluoropiridin-3-il)metil]piridin-2(1 H)-iliden]acetamida (Compuesto 3-3)

[Fórmula Química 46]

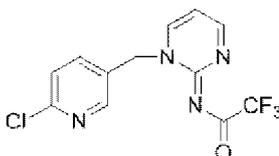
5

- (1) 400 mg (4,26 mmol) de 2-aminopiridina se disolvieron en 10 ml de diclorometano anhidro, se añadieron 322 ml (490 mg, 5,11 mmol) de ácido difluoroacético, 982 mg (5,10 mmol) de EDC-HCl y 622 mg (5,11 mmol) de DMAP al mismo y la mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante 61 horas. Después de que la reacción se completara, la solución de reacción se diluyó con diclorometano, se lavó una vez con agua y dos veces con una solución acuosa de HCl al 1 % y después se secó sobre sulfato magnésico anhidro y se concentró a presión reducida para obtener 102 mg (rendimiento del 14 %) de 2,2-difluoro-N-(piridin-2(1H)-iliden]acetamida. RMN-1H (CDCl₃, δ, ppm): 6,03(1H, t), 7,15(1H, m), 7,78(1H, td), 8,20(1H, d), 8,34(1H, dd), 8,72(1H, s a)
- (2) 128 mg (0,75 mmol) de 5-bromometil-2-fluoropiridina se disolvieron en 3 ml de DMF anhidro, 116 mg (0,68 mmol) de 2,2-difluoro-N-[piridin-2(1H)-iliden]acetamida se disolvieron en 3 ml de anhidro DMF y se añadieron al mismo y posteriormente, se añadieron 103 mg (0,75 mmol) de carbonato potásico al mismo y la mezcla resultante se agitó a 65 °C durante 2 horas. Después de que la reacción se completara, la solución de reacción se devolvió a temperatura ambiente y se añadieron acetato de etilo y agua al mismo para realizar la separación de líquidos. La capa orgánica se lavó con ácido clorhídrico al 1 %, después se secó sobre sulfato magnésico anhidro y se concentró a presión reducida. Una pequeña cantidad de hexano y éter de dietilo se añadieron al mismo para precipitar cristales y de esta manera los cristales se recogieron y se secaron para obtener el material objeto. Cantidad obtenida 50 mg (rendimiento del 26 %).

25

Ejemplo de síntesis 2: (Ejemplo de Referencia - para explicación)

N-[1-((6-cloropiridin-3-il)metil)pirimidin-2(1H)-iliden]-2,2,2-trifluoroacetamida (Compuesto 190-2)

[Fórmula Química 47]

30

35

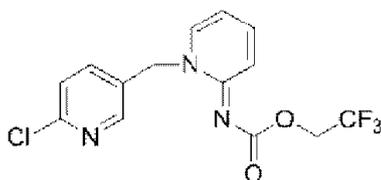
40

45

- (1) 300 mg (1,86 mmol) de 2-cloro-5-clorometilpiridina se disolvieron en 6 ml de DMF anhidro, se añadieron 118 mg (1,24 mmol) de 2-aminopirimidina al mismo y la mezcla resultante se agitó a 80 °C durante 8 horas. Después de que la reacción se completara, la solución de reacción se devolvió a temperatura ambiente para destilar el DMF a presión reducida. Se añadió éter de dietilo al mismo y de esta manera la cristalización ocurrió en la superficie de la pared de un matraz berenjena. El éter de dietilo se retiró por decantación y se secó bien para obtener clorhidrato de 1-((6-cloropiridin-3-il)metil)pirimidin-2(1H)-imina. Cantidad obtenida 107 mg (rendimiento del 34 %)
- (2) 71 mg (0,27 mmol) del clorhidrato de 1-((6-cloropiridin-3-il)metil)pirimidin-2(1H)-imina obtenido por el método anteriormente mencionado se suspendieron en 5 ml de anhidro diclorometano, se añadieron 114 ml (0,83 mmol, 83 mg) de trietilamina y 53 ml (0,38 mmol) de trifluoroacético anhídrido al mismo en secuencia y la mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante 2 horas. Después de que la reacción se completara, se añadieron diclorometano y agua a la solución de reacción para realizar la separación de líquidos y la capa orgánica se secó sobre sulfato magnésico anhidro y después se concentró a presión reducida. Una pequeña cantidad de éter de dietilo se añadió al mismo para precipitar los cristales y de esta manera se recogieron los cristales, se lavó con una pequeña cantidad de éter de dietilo y después se secó para obtener el material objeto. Cantidad obtenida 24 mg (rendimiento del 28 %).

Ejemplo de síntesis 3: (Ejemplo de Referencia - para explicación)

2,2,2-trifluoroetil-[1-((6-cloropiridin-3-il)metil)piridin-(2H)-iliden]carbamato (Compuesto 1-17)

[Fórmula Química 48]

5

10

15

20

25

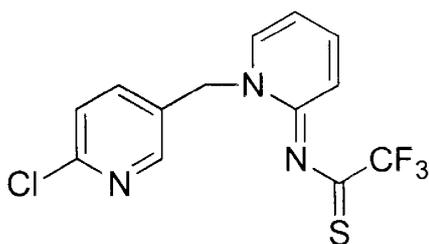
(1) 3,00 g (18,6 mmol) de 2-cloro-5-clorometilpiridina se disolvieron en 20 ml de DMF anhidro, se añadieron 1,75 g (18,6 mmol) de 2-aminopiridina al mismo y la mezcla resultante se agitó a 80 °C durante 8 horas y a temperatura ambiente durante 5 horas. Después de que la reacción se completara, se destiló el DMF a presión reducida, se añadió acetonitrilo al mismo para precipitar un sólido y el sólido se recogió, se lavó bien con acetonitrilo y después se secó para obtener 2,07 g (rendimiento del 44 %) de clorhidrato de 1-[(6-cloropiridin-3-il)metil]piridin-2(1H)-imina.

RMN-1H (DMSO-d₆, δ, ppm): 5,65(2H, s), 6,96(1H, t), 7,23(1H, m), 7,57(1H, d), 7,80(1H, m), 7,91(1H, m), 8,28(1H, m), 8,49(1H, d)

10 ml de anhidro acetonitrilo se añadieron a 150 mg (0,66 mmol) del clorhidrato de 1-[(6-cloropiridin-3-il)metil]piridin-2(1H)-imina obtenido por el método anteriormente mencionado, 177 mg (0,66 mmol) de 4-nitrofenilo(2,2,2-trifluoroetil)carbamato y 200 mg (1,46 mmol) de carbonato potásico se añadieron y la mezcla resultante se agitó a 50 °C durante 2 horas. Después de que la reacción se completara, la solución de reacción se devolvió a temperatura ambiente para filtrar materiales insolubles y el filtrado se concentró a presión reducida. Se añadieron diclorometano y agua al mismo para realizar la separación de líquidos y la capa orgánica se lavó con ácido clorhídrico al 1 %, después se secó sobre sulfato magnésico anhidro y se concentró a presión reducida. Una pequeña cantidad de Se añadió éter de dietilo al mismo para precipitar los cristales y de esta manera se recogieron los cristales y se secó bien para obtener el material objeto. Cantidad obtenida 48 mg (rendimiento 21 %).

Ejemplo de síntesis 4:

N-[1-((6-cloropiridin-3-il)metil)piridin-2(1H)-iliden]-2,2,2-trifluoroetantioamida (Compuesto 1-20)

[Fórmula Química 49]

30

35

40

45

(1) Se disolvieron 25 g (270 mmol) de 2-aminopiridina en 200 ml de diclorometano anhidro, se añadieron 41 ml (30 g, 300 mmol) de trietilamina al mismo y la mezcla se enfrió a 0 °C. Se añadieron 38 ml (57 g, 270 mmol) de ácido trifluoroacético anhidro gota a gota al mismo durante 15 minutos y la mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante 2 horas. Después de que la reacción se completara, la solución de reacción se inyectó en aproximadamente 100 ml de agua helada y la mezcla se agitó durante 10 minutos. La mezcla se transfirió a un embudo separador para realizar separación de líquidos y la capa orgánica se lavó dos veces con 150 ml de agua y dos veces con 150 ml de una solución acuosa de HCl al 1 %, se secó sobre sulfato magnésico anhidro y se concentró a presión reducida para obtener 36 g (rendimiento 71 %) de 2,2,2-trifluoro-N-(piridin-2(1H)-iliden)acetamida.

RMN-1H (CDCl₃, δ, ppm): 7,20(1H, m), 7,83(1H, m), 8,20(1H, d), 8,35(1H, d), 10,07(1H, s a)

RMN-13C (CDCl₃, δ, ppm): 115,3, 115,5(q), 121,6, 139,1, 147,9, 149,5, 155,3(q)

(2) Se disolvieron 20 g (126 mmol) de 2-cloro 5-clorometilpiridina en 200 ml de acetonitrilo anhidro, se añadieron 24 g (126 mmol) de 2,2,2-trifluoro-N-(piridin-2(1H)-iliden)acetamida obtenida mediante el método descrito anteriormente y 21 g (151 mmol) de carbonato potásico al mismo y la mezcla resultante se calentó y se dejó a reflujo durante 6 horas y después se agitó a temperatura ambiente durante 10 horas. Después de que la reacción se completara, la solución de reacción se filtró y el filtrado se concentró a presión reducida. Se añadió éter de

dietilo al mismo durante cristalización y los cristales obtenidos de esta manera se recogieron y se lavaron bien con éter de dietilo y agua. Los cristales obtenidos de esta manera se secaron a presión reducida a 60 °C durante 1 hora para obtener N-[1-((6-cloropiridin-3-il)metil)piridin-2(1H)-iliden]-2,2,2-trifluoroacetamida. Cantidad obtenida 26 g (rendimiento del 66 %).

5 RMN-1H (CDCl₃, δ, ppm): 5,57(2H, s), 6,92(1 H, td), 7,31(1 H,d), 7,80(1 H, td), 7,87(1H, dd), 7,99(1H, dd), 8,48(2H, m) RMN-13C (CDCl₃, δ, ppm): 53,8, 115,5, 117,2(q), 122,1, 124,7, 130,0, 139,2, 140,0, 142,5, 149,7, 151,8, 158,9, 163,5(q)
MS:m/z = 316(M+H)

10 (3) Se añadieron 180 ml de tolueno a 16,3 g (36,7 mmol) de pentasulfuro de fósforo, se añadieron 6,72 g (63,4 mmol) de carbonato sódico al mismo y la mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante 5 minutos. 20,0 g (63,4 mmol) de la N-[1-((6-cloropiridin-3-il)metil)piridin-2(1H)-iliden]-2,2,2-trifluoroacetamida obtenida mediante el método descrito anteriormente se añadió al mismo y la mezcla resultante se agitó a 50 °C durante 19 horas. Se añadieron 150 ml de acetato de etilo a la solución de reacción, la mezcla resultante se agitó a 50 °C durante 10 minutos, después se filtraron los materiales insolubles y se usaron 250 ml de acetato de etilo para lavar la mezcla. La mezcla se transfirió a un embudo separador, se lavó en el mismo con 300 ml de un agua con bicarbonato sódico saturada y 200 ml de una solución salina saturada y después se concentró a presión reducida. Se añadieron 200 ml de agua al mismo para precipitar los cristales.

20 La mezcla se agitó a temperatura ambiente durante 1 hora y después se recogieron los cristales, se sometió a lavado de suspensión dos veces con 150 ml de agua y dos veces con 150 ml de hexano y se secó a 60 °C a presión reducida durante 2 horas para obtener el material objeto. Cantidad obtenida 19,5 g (rendimiento del 94 %).

25 RMN-1H (CDCl₃, δ, ppm): 5,48 (2H, s), 7,12(1H, td), 7,34(1H, d), 7,77(1H, dd), 7,96(1H, m), 8,05(1H, dd), 8,45(1H, d)
MS:m/z = 332(M+H)

Las condiciones de preparación de los compuestos obtenidos en los Ejemplos de síntesis 1 a 4 se muestran en las Tablas 41 a 43 y los datos del espectro se muestran en las siguientes Tablas 48 y 49.

30 Además, los métodos de síntesis en la Tabla se describen como sigue.

- A: el mismo método que en el Ejemplo de síntesis 1
- B: el mismo método que en el Ejemplo de síntesis 2
- C: el mismo método que en el Ejemplo de síntesis 3
- D: el mismo método que en el Ejemplo de síntesis 4

35

[Tabla 41]

N.º de compuesto	Material bruto 1	Material bruto 2	Base y similares	Disolvente	Temperatura de reacción, Tiempo	Método de síntesis	Rendimiento (%)
1-20	20,0 g (63,4 mmol) de N-[1-((6-cloropiridin-3-il)metil)piridin-2(1H)-iliden]-2,2,2-trifluoroacetamida	16,3 g (36,7 mmol) de pentasulfuro de fósforo	6,72 mg (63,4 mmol) de carbonato sódico	Tolueno	50 °C, 19 h	D	94

[Tabla 42-1]

N° de Compuesto	Material bruto 1	Material bruto 2	Base y similares	Disolvente	Temperatura de reacción, Tiempo	Método sintético	Rendimiento (%)
1-21	23 mg (0,077 mmol) de N-[1-((6-cloropiridin-3-il)metil)piridin-2(1H)-iliden]-2,2-difluoroacetamida	41 mg (0,092 mmol) de pentasulfuro de fósforo	10 mg (0,092 mmol) de carbonato sódico	THF	Temperatura ambiente, 2 h	D	49
3-20	30 mg (0,10 mmol) de N-[1-((6-fluoropiridin-3-il)metil)piridin-2(1H)-iliden]-2,2,2-trifluoroacetamida	49 mg (0,11 mmol) de pentasulfuro de fósforo	12mg (0,11 mmol) de carbonato sódico	THF	Temperatura ambiente, 3 h	D	49
4-20	30 mg (0,083 mmol) de N-[1-((6-bromopiridin-3-il)metil)piridin-2(1H)-iliden]-2,2,2-trifluoroacetamida	41 mg (0,09 mmol) de pentasulfuro de fósforo	10mg (0,09 mmol) de carbonato sódico	THF	Temperatura ambiente, 3 h	D	61

[Tabla 42-2]

1-22	37 mg (0,11 mmol) de 2-cloro-N-[1-((6-cloropiridin-3-il)metil)piridin-2(1H)-iliden]-2,2-difluoroacetamida	49 mg (0,11 mmol) de pentasulfuro de fósforo	12 mg (0,11 mmol) de carbonato sódico	THF	Temperatura ambiente, 4 h	D	31
1-23	31 mg (0,085 mmol) de N-[1-((6-cloropiridin-3-il)metil)piridin-2(1H)-iliden]-2,2,3,3,3-pentafluoropropanamida	38 mg (0,085 mmol) de pentasulfuro de fósforo	9 mg (0,0854 mmol) de carbonato sódico	THF	Temperatura ambiente, 4 h	D	59

[Tabla 42-3]

5-20	36 mg (0,11 mmol) de N-[1-((6-cloro-5-fluoropiridin-3-il)metil)piridin-2(1H)-iliden]-2,2,2-trifluoroacetamida	49 mg (0,11 mmol) de pentasulfuro de fósforo	12 mg (0,11 mmol) de carbonato sódico	THF	Temperatura ambiente, 4 h	D	100
------	---	--	---------------------------------------	-----	---------------------------	---	-----

[Tabla 43-1]

N.º de Compuesto	Material bruto 1	Material bruto 2	Base y similares	Disolvente	Temperatura de reacción, Tiempo	Método sintético	Rendimiento (%)
2-20	70 mg (0,22 mmol) de N-[1-((2-clorotiazol-5-il)metil)piridin-2(1H)-iliden]-2,2,2-trifluoroacetamida	107 mg (0,24 mmol) de pentasulfuro de fósforo	25 mg (0,24 mmol) de carbonato sódico	THF	Temperatura ambiente, 4 h	D	11
10-20	130 mg (0,37 mmol) de 2,2,2-trifluoro-N-[1-((6-trifluorometil)piridin-3-il)metil]piridin-2(1H)-iliden]-acetamida	181 mg (0,41 mmol) de pentasulfuro de fósforo	43 mg (0,41 mmol) de carbonato sódico	THF	Temperatura ambiente, 4 h	D	93

[Tabla 43-2]

11-20	40 mg (0,15 mmol) de 2,2,2-trifluoro-N-[1-((tetrahidrofuran-3-il)metil)piridin-2(1H)-iliden)]acetamida	65 mg (0,11 mmol) de pentasulfuro de fósforo	16 mg (0,15 mmol) de carbonato sódico	THF	Temperatura ambiente, 4 h	D	53
1-37	78 mg (0,28 mmol) de N-[1-((6-cloropiridin-3-il)metil)piridin-2(1H)-iliden]-propionamida	125 mg (0,28 mmol) de pentasulfuro de fósforo	30 mg (0,28 mmol) de carbonato sódico	THF	Temperatura ambiente, 2 h	D	21
1-39	180 mg (0,96 mmol) de N-[1-((6-cloropiridin-3-il)metil)piridin-2(1H)-iliden]-isobutilamida	341 mg (0,75 mmol) de pentasulfuro de fósforo	102 mg (0,96 mmol) de carbonato sódico	THF	Temperatura ambiente, 2 h	D	29
1-40	54 mg (0,19 mmol) de N-[1-((6-cloropiridin-3-il)metil)piridin-2(1H)-iliden]-ciclopropancarboxiamida	54 mg (0,19 mmol) de pentasulfuro de fósforo	20 mg (0,19 mmol) de carbonato sódico	THF	Temperatura ambiente, 2 h	D	12

[Tabla 43-3]

1-35	26 mg (0,074 mmol) de N-[1-((6-cloropiridin-3-il)metil)piridin-2(1H)-iliden]-3-fienilpropanamida	26 mg (0,06 mmol) de pentasulfuro de fósforo	8 mg (0,074 mmol) de carbonato sódico	THF	Temperatura ambiente, 1,5 h	D	23
------	--	--	---------------------------------------	-----	-----------------------------	---	----

[Tabla 48-1]

N.º de compuesto	RMN-1H (CDCl ₃ , δ, ppm)	EM o IR (KBr, v, cm ⁻¹)
1-20	5,48 (2H, s), 7,12 (1H, td), 7,34 (1H, d), 7,77 (1H, dd), 7,96 (1H, m), 8,05 (1H, dd), 8,45 (1H, d), 8,56 (1H, d)	m/z = 332 (M+H)

[Tabla 48-2]

1-21	5,49 (2H, s), 6,21 (1H, t), 7,05 (1H, td), 7,34 (1H, d), 7,82 (1H, dd), 7,90 (1H, m), 7,94 (1H, dd), 8,45 (1H, d), 8,49 (1H, d)	m/z = 314,0346 (M+H)
3-20	5,51 (2H, s), 6,95 (1H, d), 7,15 (1H, td), 7,96 (2H, m), 8,09 (1H, d), 8,29 (1H, d), 8,52 (1H, d)	m/z = 316,0559 (M+H)
4-20	5,47 (2H, s), 7,13 (1H, m), 7,50 (1H, m), 7,66 (1H, m), 7,97 (1H, m), 8,07 (1H, m), 8,43(1 H,s), 8,54 (1H, m)	m/z = 375,9 (M+H)
1-22	5,49 (2H, s), 7,09 (1H, td), 7,35 (1H, d), 7,78 (1H, dd), 7,95 (2H, m), 8,46 (1H, d), 8,55 (1 H, d)	m/z = 347,9972 (M+H)
1-23	5,47 (2H, s), 7,10 (1H, td), 7,34 (1H, d), 7,68 (1H, dd), 7,95 (2H, m), 8,41 (1H,d), 8,55 (1 H,dd)	m/z = 382,0246 (M+H)
5-20	5,49 (2H, s), 7,10 (1H, m), 7,65 (1H, dd), 7,96 (1H, m), 8,00 (1H, m), 8,27 (1H, d), 8,63 (1H, d)	m/z = 350,0188 (M+H)

[Tabla 49-1]

N.º de compuesto	RMN-1H (CDCl ₃ , δ, ppm)	EM o IR (KBr, v, cm ⁻¹)
2-20	5,57 (2H, s), 7,12 (1H, m), 7,68 (1H, s), 7,97 (1H, m), 8,12 (1H, d), 8,67 (1H, d)	m/z = 338 (M+H)
10-20	5,58 (2H, s), 7,12 (1H, m), 7,70 (1H, d), 7,97 (2H, m), 8,02 (1H, s), 8,62 (1H, d), 8,77 (1H, s)	m/z = 366 (M+H)

N.º de compuesto	RMN-1H (CDCl ₃ , δ, ppm)	EM o IR (KBr, ν, cm ⁻¹)
11-20	1,69 (1H, m), 2,07 (1H, m), 2,84 (1H, m), 3,59 (1H, dd), 3,71 (1H, dd), 3,77 (1H, m), 3,96 (1H, m), 4,13 (1H, dd), 4,42 (1H, dd), 7,11 (1H, m), 7,92 (1H, dd), 7,98 (1H, m), 8,40 (1H, d)	m/z = 291 (M+H)

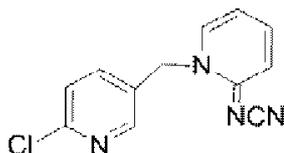
[Tabla 49-2]

1-37	1,28 (3H, t), 2,88 (2H, q), 5,41 (2H, s), 6,86 (1H, t), 7,35 (1H, d), 7,75 (3H, m), 8,10 (1H, d), 8,44 (1H, d)	m/z = 292 (M+H)
1-39	1,26 (6H, d), 2,55 (1H, m), 5,51 (2H, s), 6,98 (1H, m), 7,36 (1H, d), 7,76 (1H, dd), 7,77 (2H, m), 8,08 (1H, d), 8,44 (1H, d)	m/z = 306 (M+H)
1-40	0,92 (2H, m), 1,22 (2H, m), 2,40 (1H, m), 5,36 (2H, s), 6,77 (1H, td), 7,34 (1H, d), 7,66 (2H, m), 7,71 (1H, dd), 8,14 (1H, d), 8,41 (1H, d)	m/z = 304 (M+H)
1-35	3,18 (4H, m), 5,05 (2H, s), 6,83 (1H, td), 7,05 (1H, t), 7,25 (2H, m), 7,38 (3H, m), 7,59 (1H, dd), 7,67 (1H, d), 7,72 (1H, td), 7,99 (1H, d), 8,30 (1 H,d)	m/z = 368 (M+H)

(Ejemplo de síntesis del Compuesto Comparativo)

5 Ejemplo Comparativo 1: N-[1-cloropiridin-3-il]metil]piridin-2(1H)-iliden]cianamida (Documento de Patente 5, Compuesto 20)

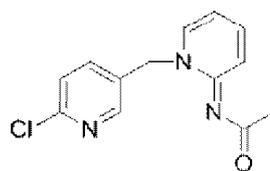
[Fórmula Química 58]



10 128 mg (0,58 mmol) de la 1-[(6-cloropiridin-3-il)metil]piridin-2(1H)-imina obtenida mediante el método anteriormente descrito se disolvieron en 5 ml de DMF anhidro, se añadieron 40 mg (net 24 mg, 1,04 mmol) de NaH (fase oleaginoso, pureza del 60 %) al mismo y la mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante 30 minutos. Se añadieron 60 mg (0,57 mmol) of bromuro de cianógeno al mismo y la mezcla resultante se agitó durante toda la noche. Después de que se completara la reacción, agua y acetato de etilo se añadieron a la solución de reacción para realizar la separación de líquidos. La capa orgánica se secó sobre sulfato magnésico anhidro, después se concentró a presión reducida y se purificó por una placa de TLC (una hoja de placa de 0,5 mm, evolucionado con 100 % acetato de etilo) para obtener el material objeto. Cantidad obtenida 14 mg (rendimiento del 10 %).
 15 RMN ¹N (CDCl₃, δ, ppm): 5,28 (2H, s), 6,55 (1H, m), 7,33 (2H, m), 7,56 (2H, m), 7,75 (1H, dd), 8,40 (1H, d)

20 Ejemplo comparativo 2: N-[1-((6-cloropiridin-3-il)metil]piridin-2(2H)-iliden]acetamida (Documento de Patente 3, Compuesto 2)

[Fórmula Química 59]

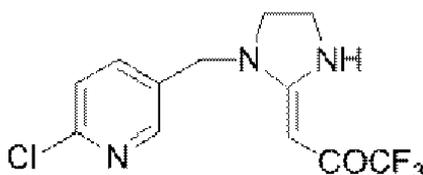


25 20 ml de diclorometano anhidro se añadieron a 118 mg (0,46 mmol) del clorhidrato de 1-[(6-[cloropiridin-3-il]metil]piridin-2(1H)-imina obtenido mediante el método anteriormente descrito, se añadieron 159 ml (1,16 mmol, 116 mg) de trietilamina y 33 ml de cloruro de acetilo al mismo y la mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante 15 minutos. Se añadió agua a la solución de reacción para parar la reacción y la separación de líquidos se realizó con cloroformo y agua. La capa orgánica se lavó con una solución acuosa de cloruro de amonio saturada y después se concentró, se añadió hexano al mismo para precipitar un sólido y de esta manera el sólido se recogió, se lavó y se sometió a secado por baño para obtener el material objeto. Cantidad obtenida 21 mg (rendimiento del 17 %).

RMN ¹N (CDCl₃, δ, ppm) : 2,21 (3H, s), 5,35 (2H, s), 6,46 (1H, m), 7,32 (1H, d), 7,48 (2H, m), 7,75 (1H, d), 8,10 (1H, dd), 8,45 (1H, dd)
MS:m/z = 322 (M+H)

- 5 Ejemplo comparativo 3: 3-[1-((6-cloropiridin-3-il)metil)imidazolidin-2-iliden]-1,1,1-trifluoropropan-2-ona (Documento de Patente 2, Ejemplo 4)

[Fórmula Química 60]



- 10 Se añadieron 20 ml de etilendiamina a 2,0 g (12,4 mmol) de 2-cloro-5-clorometilpiridina y la mezcla resultante se agitó durante toda la noche. Después de que se completara la reacción, la mezcla se concentró a presión reducida y se añadió acetonitrilo al mismo para filtrar materiales insolubles. La mezcla se concentró a presión reducida para obtener 2,45 g (rendimiento: 100 %) de N-((6-cloropiridin-3-il)metil)etan-1,2-diamina.

- 15 77 mg (0,42 mmol) de la N-((6-cloropiridin-3-il)metil)etan-1,2-diamina obtenida mediante el método anteriormente mencionado se disolvieron en 8 ml de anhidro acetonitrilo, la solución resultante se añadió a 60 mg (0,28 mmol) de la 1,1,1-trifluoro-4,4-bis(metiltio)-3-butilen-2-ona obtenida mediante el método anteriormente descrito y la mezcla resultante se calentó y se sometió a reflujo durante 40 minutos. Después de que se completara la reacción, la solución de reacción se devolvió a temperatura ambiente y se concentró a presión reducida y se añadieron acetato de etilo y agua al mismo para realizar la separación de líquidos. La capa orgánica se lavó con sulfato magnésico anhidro, se concentró a presión reducida y se purificó por cromatografía en columna en gel de sílice (hexano: acetato de etilo = 3:1) para obtener el material objeto. Cantidad obtenida 59 mg (rendimiento del 69 %).

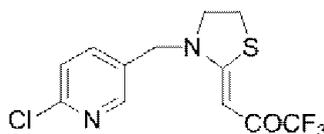
20 RMN ¹N (CDCl₃, δ, ppm): 3,49 (2H, t), 3,78 (2H, t), 4,40 (2H, s), 5,13 (1H, s), 7,37 (1H, d), 7,56 (1H, dd), 8,31 (1H, d), 9,34 (1H, s a)

25 m/z = 306 (M+H)

Ejemplo comparativo 4:

- 30 3-[3-((6-cloropiridin-3-il)metil)thiazolin-2-iliden]-1,1,1-trifluoropropan-2-ona (Documento de Patente 2, Ejemplo 3)

[Fórmula Química 61]



- 35 Se añadieron 15 ml de DMF anhidro a 1,30 g (33,9 mmol, 780 mg) de NaH (fase oleaginosa, pureza del 60 %) y la mezcla resultante se enfrió a 0 °C. 1,52 ml (1,90 g, 17,0 mmol) de 1,1,1-trifluoroacetone se añadieron gota a gota al mismo y la mezcla resultante se agitó a 0 °C durante 10 minutos. Se añadieron 7,0 ml (110 mmol, 8,35 g) de disulfuro de carbono al mismo y la mezcla resultante se agitó a 5 °C durante 1 hora. Posteriormente, la solución de reacción se enfrió a 0 °C, se añadieron 2,1 ml (34,0 mmol, 4,81 g) de yoduro de metilo al mismo y la mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante toda la noche. Después de que se completara la reacción, la solución de reacción se inyectó en agua helada y la mezcla se agitó hasta que el hielo se fundió completamente. La mezcla se transfirió a un embudo separador y se extrajo con acetato de etilo y la capa orgánica se lavó con una solución salina saturada, después se secó con sulfato magnésico anhidro y se concentró a presión reducida. La capa orgánica se purificó por cromatografía en columna en gel de sílice (hexano: acetato de etilo = 95:5) y se recogió una fracción que incluye el material objeto y se concentró a presión reducida. Se añadió hexano al mismo para precipitar un sólido y de esta manera el sólido se recogió, se lavó con hexano y después se secó bien para obtener 460 mg de 1,1,1-trifluoro-4,4-bis(metiltio)-3-buten-2-ona (rendimiento del 13 %).

45 RMN ¹N (CDCl₃, δ, ppm): 2,56 (3H, s), 2,58 (2H, s), 6,25 (1H, s)

- 50 Se añadieron 36 mg (0,46 mmol) de 2-aminoetanol disuelto en 10 ml de etanol a 100 mg (0,46 mmol) de la 1,1,1-trifluoro-4,4-bis(metiltio)-3-buten-2-ona obtenida mediante el método anteriormente mencionado y la mezcla resultante se calentó y se sometió a reflujo durante 6 horas y se agitó a temperatura ambiente durante 13 horas. Después de que se completara la reacción, se destiló el etanol a presión reducida y la mezcla se disolvió en acetato

de etilo y se lavó una vez con agua. La mezcla se secó sobre sulfato magnésico anhidro y después se concentró a presión reducida para obtener 73 mg (rendimiento del 81 %) de 1,1,1-trifluoro-3-(tiazolidin-2-iliden)propan-2-ona.

RMN ¹N (CDCl₃, δ, ppm): 3,35 (2H, m), 4,02 (2H, m), 5,61 (1H, s), 10,40 (1H, s a)

5 80 mg (0,50 mmol) de 2-cloro-5-clorometilpiridina disuelta en 8 ml de acetonitrilo anhidro y se añadieron 69 mg (0,50 mmol) de carbonato potásico a 65 mg (0,33 mmol) de la 1,1,1-trifluoro-3-(tiazolidin-2-iliden)propan-2-ona obtenida mediante el método anteriormente mencionado y la mezcla resultante se calentó y se sometió a reflujo durante 2 horas. Después de que se completara la reacción, la solución de reacción se devolvió a temperatura ambiente para filtrar materiales insolubles y el filtrado se concentró a presión reducida. El filtrado se purificó por cromatografía en columna en gel de sílice (hexano: acetato de etilo = 1:1 → 1:3) para obtener el material objeto. Cantidad obtenida 53

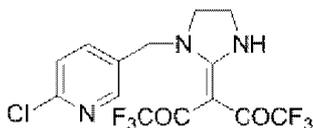
10 mg (rendimiento del 50 %)
RMN ¹N (CDCl₃, δ, ppm) : 3,20 (2H, t), 3,73 (2H, t), 4,61 (2H, s), 5,80 (1H, s), 7,36 (1H, d), 7,53 (1H, dd), 8,31 (1H, d)

MS: m/z = 323 (M+H)

15 Ejemplo comparativo 5:

3-[1-((6-cloropiridin-3-il)metil)imidazolidin-2-iliden]-1,1,1,5,5,5-hexafluoropentan-2,4-diona (Documento de Patente 2, Ejemplo 5)

[Fórmula Química 62]



20 31 mg (0,10 mmol) de la 3-[1-((6-[cloropiridin-3-il)metil)imidazolidin-2-iliden]-1,1,1-trifluoropropan-2-ona obtenida mediante el método anteriormente descrito se disolvieron en 2 ml de diclorometano anhidro, se añadieron 20 μl (0,25 mmol, 20 mg) de piridina y 28 μl (0,20 mmol, 42 mg) de anhídrido trifluoroacético en secuencia y la mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante 30 minutos. El progreso de la reacción se confirmó por TLC y quedó el material bruto y se añadieron de esta manera 84 μl (0,60 mmol, 62 mg) de anhídrido trifluoroacético al mismo y la mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante 1 hora. Después de que se completara la reacción, la solución de reacción se concentró a presión reducida y se purificó por una placa de TLC (una hoja de placa de 0,5 mm, evolucionado con hexano: acetato de etilo = 2:8) para obtener el material objeto. Cantidad obtenida 30 mg (rendimiento del 75 %).

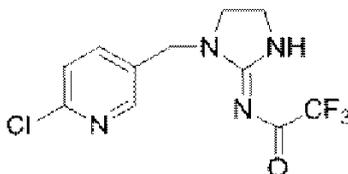
RMN ¹N (CD₃OD, δ, ppm): 3,87 (4H, m), 4,51 (2H, s), 7,50 (1H, d), 7,82 (1H, dd), 8,35 (1H, d)

MS: m/z = 402 (M+H)

35 Ejemplo comparativo 6:

N-[1-((6-cloropiridin-3-il)metil)imidazolidin-2-iliden]-2,2,2-trifluoroacetamida (Documento de Patente 2, Ejemplo 7)

[Fórmula Química 63]



40 4,61 g (2,49 mmol) de N-((6-cloropiridin-3-il)metil)etan-1,2-diamina se sintetizaron por el método anteriormente descrito. El compuesto se disolvió en 40 ml de acetonitrilo anhidro, se añadieron 4,60 g (21,3 mmol) del dimetil(2,2,2- trifluoroacetil)carbonimidatiditoato obtenido mediante el método anteriormente descrito al mismo y la mezcla resultante se calentó y se sometió a reflujo durante 90 minutos. Después de que se completara la reacción, la solución de reacción se devolvió a temperatura ambiente, el disolvente se destiló a presión reducida y el sólido precipitado se recogió y se lavó con una pequeña cantidad de acetonitrilo para obtener el material objeto. Cantidad obtenida 2,17 g (rendimiento del 33 %).

RMN ¹N (CDCl₃, δ, ppm) : 3,50 (2H, m), 3,76 (2H, m), 4,60 (2H, s), 7,34 (1H, d) 7,70 (1H, dd) 8,33 (1H, d)

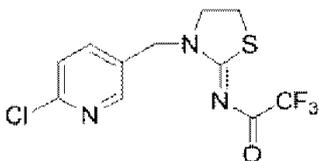
Punto de fusión: 168-170 °C

50

Ejemplo comparativo 7:

N-[3-((6-cloropiridin-3-il)metil)tiazolín-2-ilidén]-2,2,2-trifluoroacetamida (Documento de Patente 2, Ejemplo 6)

[Fórmula Química 64]



5

Se añadieron 20 ml de etanol a 77 mg (1,0 mmol) de 2-aminoetanotiol, se añadieron 216 mmol (1,0 mmol) del dimetil(2,2,2-trifluoroacetil)carbonimidoditioato sintetizado por el método anteriormente descrito al mismo y la mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante toda la noche. Después de que se completara la reacción, el disolvente se destiló a presión reducida y se purificó por cromatografía en columna en gel de sílice (hexano: acetato de etilo = 1:1) para obtener 100 mg (rendimiento del 51 %) de 2,2,2-trifluoro-N-(tiazolín-2-ilidén)acetamida. La reacción se realizó de nuevo por el mismo método de síntesis y 2,2,2-trifluoro-N-(tiazolín-2-ilidén)acetamida se puso junta para obtener 350 mg del compuesto.

10

15

Se añadieron 2 ml de DMF y 18 ml de THF a 162 mg (0,82 mmol) de la 2,2,2-trifluoro-N-(tiazolín-2-ilidén)acetamida obtenida mediante el método anteriormente descrito, se añadieron 150 mg (1,09 mmol) de carbonato potásico al mismo y la mezcla resultante se calentó y se sometió a reflujo durante 20 horas. Después de que se completara la reacción, la solución de reacción se devolvió a temperatura ambiente para filtrar materiales insolubles y el filtrado se concentró a presión reducida. El filtrado se purificó por placas de TLC (dos hojas de placas de 0,5 mm, evolucionado con 100 % de acetato de etilo) para obtener el material objeto. Cantidad obtenida 230 mg (rendimiento del 87 %).
RMN ¹N (CDCl₃, δ, ppm): 3,27 (2H, m), 3,73 (2H, m), 4,86 (2H, s), 7,36 (1H, d), 7,72 (1H, dd), 8,36 (1H, d)
Punto de fusión: 96 °C

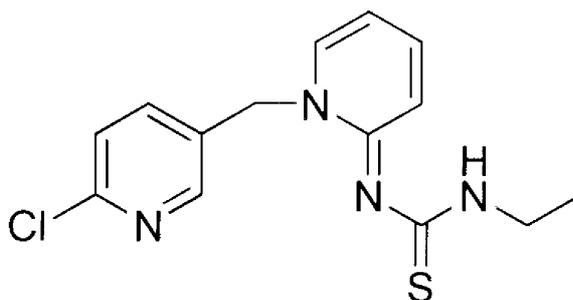
20

Ejemplo comparativo 8:

25

1-[1-((6-cloropiridin-3-il)metil)piridin-2(1H)-ilidén]-3-etiltiurea (Documento de Patente 3, Solicitud de Patente japonesa abierta N.º 5-78323, Tabla 1, Compuesto N.º 51)

[Fórmula Química 65]



30

Se añadieron 10 ml de acetonitrilo a 200 mg (0,78 mmol) de clorhidrato de 1-[(6-cloropiridin-3-il)metil]piridin-2(1H)-imina sintetizado mediante el método descrito en el Ejemplo de síntesis 3, se añadieron 118 ml (0,86 mmol) de trietilamina y 68 ml (0,78 mmol) de isotiocianato de etilo al mismo en secuencia y la mezcla resultante se calentó y se sometió a reflujo durante 11 horas. Después de que se completara la reacción, la solución de reacción se devolvió a temperatura ambiente y se concentró a presión reducida y la separación de líquidos se realizó con acetato de etilo y una solución acuosa de ácido clorhídrico al 1 %. Un agua de bicarbonato sódico saturada se añadió a la capa de agua para hacer a la capa básica y la capa se extrajo una vez con acetato de etilo. La capa se secó sobre sulfato magnésico anhidro y después se concentró a presión reducida para obtener un compuesto objeto. Cantidad obtenida 120 mg (rendimiento del 56 %).

35

40

RMN ¹H (CDCl₃, δ, ppm) : 1,06, 1,23 (3H, tx2), 3,21,3,71 (2H, mx2), 5,23, 5,32 (2H, sx2), 6,25, 6,42 (1H, s ax2), 6,37, 6,51 (1H, mx2), 7,31-7,37 (2H, m), 7,47 (1H, m), 7,62 (1H, m), 8,14-8,22 (1H, m), 8,35 (1H, m)

MS: m/z= 307 (M+H)

Punto de fusión: 162-164 °C

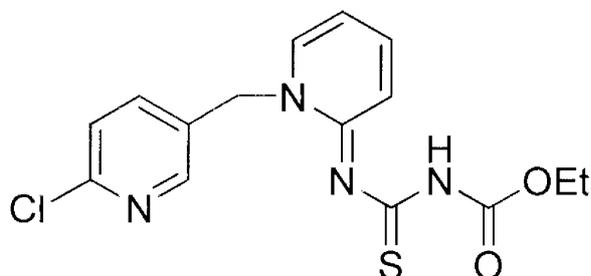
45

Ejemplo comparativo 9:

1-[1-((6-cloropiridin-3-il)metil)piridin-2(1H)-iliden]-3-etoxicarboniltiurea (Documento de Patente 3, Solicitud de Patente japonesa abierta N.º 5-78323, Tabla 1, Compuesto No. 56)

5

[Fórmula Química 66]



10 ml de acetonitrilo se añadieron a 200 mg (0,78 mmol) de clorhidrato de 1-[(6-cloropiridin-3-il)metil]piridin-2(1H)-imina sintetizado mediante el método descrito en el Ejemplo de síntesis 3, se añadieron 118 ml (0,86 mmol) de trietilamina y 96 ml (0,82 mmol) de isotiocianato de etoxicarbonilo al mismo y la mezcla resultante se calentó y se sometió a reflujo durante 1 hora. Después de que se completara la reacción, la solución de reacción se devolvió a temperatura ambiente y se concentró a presión reducida y la separación de líquidos se realizó con acetato de etilo y un agua de bicarbonato sódico saturada. La capa orgánica se lavó una vez con agua, después se secó sobre sulfato magnésico anhidro y se concentró a presión reducida para obtener el material objeto. Cantidad obtenida 156 mg (rendimiento del 57 %). 17 mg del material objeto obtenido purificando 30 mg del material objeto con una placa de TLC (una hoja de una placa de 0,5 mm evolucionada dos veces con hexano: acetato de etilo = 1:3) se proporcionó para la medición de datos de espectro y el ensayo biológico.

15 RMN 1H (CDCl₃, δ, ppm) : 1,27 (3H, t), 4,16 (2H, q), 5,52 (2H, s), 6,82 (1H, td), 8,34 (1H, d), 7,72 (2H, m), 7,94 (2H, m), 8,34 (1H, d), 8,46 (1H, d)

20 MS:m/z= 351 (M+H)

Punto de fusión: 141-143 °C

[Ejemplo de preparación]

25 Ejemplo de preparación 1 [Gránulos]

Compuesto	1-20 5 % en peso
Bentonita	40 % en peso
Talco	10 % en peso
Arcilla	43 % en peso
Ligninsulfonato cálcico	2 % en peso

Los ingredientes se molieron y mezclaron homogéneamente, se añadió agua a los mismos para amasar los ingredientes exhaustivamente y después la mezcla se granuló y se secó para obtener gránulos.

30

Ejemplo de Preparación 2 [Fluidos]

Compuesto 1-21	25 % en peso
POE sulfato de poliestirilfenil éter	5 % en peso
Propilenglicol	6 % en peso
Bentonita	1 % en peso
Solución acuosa de goma xantana al 1 %	3 % en peso
PRONALEX-300 (TOHO Chemical Industry Co., Ltd.)	0,05 % en peso
ADDAC827 (KI Chemical Industry Co., Ltd.)	0,02 % en peso
Agua	Añadido hasta el 100 % en peso

35 Todos los ingredientes excepto la solución acuosa de goma xantana al 1 % y una cantidad adecuada de agua se premezclaron juntos desde la combinación y la mezcla se molió después mediante un molino en húmedo. En lo sucesivo, la solución acuosa de goma xantana al 1 % y el agua restante se añadieron a la misma para obtener fluidos al 100 % en peso.

Ejemplo de Preparación 3 [Polvo]

Compuesto 1-20	2 % en peso
Arcilla	60 % en peso
Talco	37 % en peso
Estearato cálcico	1 % en peso

Los ingredientes se mezclaron homogéneamente para obtener polvo.

5

Ejemplo de Preparación 4 [Gotas líquidas]

Compuesto 1-20	10 % en peso
Alcohol bencílico	74,9 % en peso
Carbonato de propileno	15 % en peso
BHT	0,1 % en peso

Los ingredientes se agitaron homogéneamente y se disolvieron para obtener gotas líquidas.

10

Ejemplo de Preparación 5 [Gránulos]

Compuesto 1-20	2 % en peso
Probenazol	24 % en peso
Aglutinante	3,0 % en peso
Agente mejorador granular	0,5 % en peso
Arcilla	70,5

Los ingredientes se molieron y mezclaron homogéneamente, se añadió agua a los mismos para amasar los ingredientes exhaustivamente y después la mezcla se granuló y se secó para obtener gránulos.

15

[Ejemplo de Ensayo]

Ejemplo de Ensayo 1 ensayo de control de *Plutella xylostella*

20

Un disco foliar que tiene un diámetro de 5,0 cm se cortó de una col cultivada en tarro y se pulverizó al disco foliar una solución de fármaco del compuesto de la presente invención a una concentración predeterminada, que se había preparado de tal manera que fuera un 50 % de agua acetona (disponible un 0,05 % de Tween20). Después de un proceso de secado al aire, se liberaron al mismo larvas de segundo estadio. En lo sucesivo, las larvas se dejaron estar en una cámara termostática (16 horas de periodo de luz - 8 horas de periodo de oscuridad) a 25 °C. Tres días después de la liberación, se observó la supervivencia o la muerte en las larvas y se calculó la mortalidad de las larvas mediante la siguiente ecuación. Ensayo por duplicado.

25

$$\text{Mortalidad de larvas (\%)} = \left\{ \frac{\text{número de larvas muertas}}{\text{número de larvas que sobrevivieron} + \text{número de larvas muertas}} \right\} \times 100$$

30

Como resultado, los compuestos 1-21, 3-20 y 4-20 exhibieron actividad insecticida teniendo una mortalidad del 80 % o mayor mediante un tratamiento foliar a 500 ppm.

35

Además, los compuestos 1-20, 1-21, 4-20, 1-22, 1-23, 5-20 y 2-20 exhibieron actividad insecticida teniendo una mortalidad del 80 % o mayor mediante un tratamiento foliar a 100 ppm.

Mientras tanto, el Ejemplo Comparativo 8 (Solicitud de Patente japonesa abierta N.º 5-78323, Compuesto N.º 51 en la Tabla 1) exhibió una mortalidad del 20 % en el tratamiento a 500 ppm.

40

Ejemplo de Ensayo 2 ensayo de control de plagas contra *Spodoptera litura*

Un disco foliar que tiene un diámetro de 5,0 cm se cortó de una col cultivada en tarro y se pulverizó al disco foliar una solución de fármaco del compuesto de la presente invención a una concentración predeterminada, que se había preparado de tal manera que fuera un 50 % de agua acetona (disponible un 0,05 % de Tween20). Después de un proceso de secado al aire, se liberaron al mismo larvas de tercer estadio. En lo sucesivo, las larvas se dejaron estar en una cámara termostática (16 horas de periodo de luz - 8 horas de periodo de oscuridad) a 25 °C. Tres días después de la liberación, se observó la supervivencia o la muerte en las larvas y se calculó la mortalidad de las

45

larvas mediante la siguiente ecuación. Ensayo por duplicado.

$$\text{Mortalidad de larvas (\%)} = \left\{ \frac{\text{número de larvas muertas}}{\text{número de larvas que sobrevivieron} + \text{número de larvas muertas}} \right\} \times 100$$

5 Como resultado, los compuestos 1-21, 3-20 y 4-20 exhibieron actividad insecticida teniendo una mortalidad del 80 % o mayor mediante un tratamiento foliar a 500 ppm. Además, el compuesto 1-20 exhibió actividad insecticida teniendo una mortalidad del 80 % o mayor mediante un tratamiento foliar a 100 ppm.

10 Mientras tanto, el Ejemplo Comparativo 8 (Solicitud de Patente japonesa abierta N.º 5-78323, Compuesto N.º 51 en la Tabla 1) y el Ejemplo Comparativo 9 (lo mismo Compuesto 56) exhibieron una mortalidad del 10 % y del 11 % en el tratamiento a 500 ppm, respectivamente.

15 Ejemplo de Ensayo 3 ensayo de control de plaga de *Aphis gossypii*

Un disco foliar que tiene un diámetro de 2,0 cm se cortó de un pepino cultivado en tarro y se pulverizó al disco foliar una solución de fármaco del compuesto de la presente invención a una concentración predeterminada, que se había preparado de tal manera que fuera un 50 % de agua acetona (disponible un 0,05 % de Tween20). Después de un proceso de secado al aire, se liberaron al mismo larvas de primer estadio. En lo sucesivo, las larvas se dejaron estar en una cámara termostática (16 horas de periodo de luz - 8 horas de periodo de oscuridad) a 25 °C. Tres días después de la liberación, se observó la supervivencia o la muerte en las larvas y se calculó la mortalidad de las larvas mediante la siguiente ecuación. Ensayo por duplicado.

$$\text{Mortalidad de larvas (\%)} = \left\{ \frac{\text{número de larvas muertas}}{\text{número de larvas que sobrevivieron} + \text{número de larvas muertas}} \right\} \times 100$$

25 Como resultado, el compuesto 11-20 exhibió actividad insecticida teniendo una mortalidad del 80 % o mayor mediante un tratamiento foliar a 500 ppm.

30 Además, los compuestos 1-20, 1-21, 3-20, 4-20, 2-20, 10-20, 11-20, 1-37, 1-40 y 1-35, exhibieron actividad insecticida teniendo una mortalidad del 80 % o mayor mediante un tratamiento foliar a 100 ppm.

Además, los compuestos 1-20, 1-21, 3-20 y 1-37, exhibieron actividad insecticida teniendo una mortalidad del 80 % o mayor mediante un tratamiento foliar a 20 ppm.

35 Ejemplo de Ensayo 4 ensayo de control de plagas contra *Aulacophora femoralis*

Un disco foliar que tiene un diámetro de 2,8 cm se cortó de un pepino cultivado en tarro y se pulverizó al disco foliar una solución de fármaco del compuesto de la presente invención a una concentración predeterminada, que se había preparado de tal manera que fuera un 50 % de agua acetona (disponible un 0,05 % de Tween20). Después de un proceso de secado al aire, se liberaron al mismo adultos. En lo sucesivo, los adultos se dejaron estar en una cámara termostática (16 horas de periodo de luz - 8 horas de periodo de oscuridad) a 25 °C. Tres días después de la liberación, se observó la supervivencia o la muerte en los adultos y se calculó la mortalidad de los adultos mediante la siguiente ecuación. Ensayo por duplicado.

$$\text{Mortalidad de adultos (\%)} = \left\{ \frac{\text{número de adultos muertos}}{\text{número de adultos que sobrevivieron} + \text{número de adultos muertos}} \right\} \times 100$$

50 Como resultado, los compuestos 1-20 y 4-20 exhibieron actividad insecticida teniendo una mortalidad del 80 % o mayor mediante un tratamiento foliar a 10 ppm.

Ejemplo de Ensayo 5 ensayo de control de plagas contra *Callosobruchus chinensis*

55 Se trató 1 µl (/cabeza) de una solución de fármaco del compuesto de la presente invención preparado a una concentración predeterminada con acetona en la espalda de adultos de *Callosobruchus chinensis*. Después del tratamiento de fármaco, los adultos se transfirieron a una copa de plástico y se dejaron estar en una cámara termostática a 25 °C. Veinticuatro horas después del tratamiento, se observó la supervivencia o la muerte de los adultos y se calculó la mortalidad de los adultos mediante la siguiente ecuación.

$$\text{Tasa de adultos agonizados (\%)} = \left\{ \frac{\text{número de adultos muertos}}{\text{número de adultos que sobrevivieron} + \text{número de adultos muertos}} \right\} \times 100$$

60 Como resultado, el compuesto 1-20 exhibió actividad insecticida teniendo una mortalidad del 80 % o mayor en la tasa a 0,1 µg/cabeza.

65

Ejemplo de Ensayo 6 ensayo de control de plagas de *Laodelphax striatella*

Una solución de fármaco del compuesto de la presente invención a una concentración predeterminada, que se había preparado de tal manera que fuera un 50 % de agua acetona (disponible un 0,05 % de Tween20), se pulverizó en las hojas a un plantón de arroz cultivado en tarro. Después de un proceso de secado al aire, se liberaron al mismo 5 larvas de segundo estadio. En lo sucesivo, las larvas se dejaron estar en una cámara termostática (16 horas de periodo de luz - 8 horas de periodo de oscuridad) a 25 °C. Tres días después de la liberación, se observó la supervivencia o la muerte en las larvas y se calculó la mortalidad de las larvas mediante la siguiente ecuación. Ensayo por duplicado.

$$\text{Mortalidad de larvas (\%)} = \left\{ \frac{\text{número de larvas muertas}}{\text{número de larvas que sobrevivieron} + \text{número de larvas muertas}} \right\} \times 100$$

Como resultado, los compuestos 1-20 y 4-20 exhibieron actividad insecticida teniendo una mortalidad del 80 % o mayor mediante un tratamiento foliar a 1,25 ppm.

Ejemplo de Ensayo 7 ensayo de control de plagas de *Frankliniella occidentalis*

Un disco foliar que tiene un diámetro de 2,8 cm se cortó de una judía cultivada en tarro y se pulverizó al disco foliar una solución de fármaco del compuesto de la presente invención a una concentración predeterminada, que se había preparado de tal manera que fuera un 50 % de agua acetona (disponible un 0,05 % de Tween20). Después de un proceso de secado al aire, se liberaron al mismo larvas de primer estadio. En lo sucesivo, las larvas se dejaron estar en una cámara termostática (16 horas de periodo de luz - 8 horas de periodo de oscuridad) a 25 °C. Tres días después de la liberación, se observó la supervivencia o la muerte en las larvas y se calculó la mortalidad de las 20 larvas mediante la siguiente ecuación. Ensayo por duplicado.

$$\text{Mortalidad de larvas (\%)} = \left\{ \frac{\text{número de larvas muertas}}{\text{número de larvas que sobrevivieron} + \text{número de larvas muertas}} \right\} \times 100$$

Como resultado, los compuestos 1-20, 1-21, 3-20 y 4-20 exhibieron actividad insecticida teniendo una mortalidad del 80 % o mayor mediante un tratamiento foliar a 500 ppm.

Además, los compuestos 1-20 y 1-21 exhibieron actividad insecticida teniendo una mortalidad del 80 % o mayor mediante un tratamiento foliar a 100 ppm.

Mientras tanto, el Ejemplo Comparativo 8 (Solicitud de Patente japonesa abierta N.º 5-78323, Compuesto N.º 51 en la Tabla 1) exhibió una mortalidad del 15 % en el tratamiento a 500 ppm.

Ejemplo de Ensayo 8 ensayo de control de plagas de *Trigonotylus caelestialium*

Hojas y tallos de plantones de trigo cuatro días después de la diseminación de los plantones se sumergieron durante 30 segundos en una solución de fármaco del compuesto de la presente invención a una concentración predeterminada, que se había preparado de tal manera que fuera un 50 % de agua acetona (disponible un 0,05 % de Tween20). Después de un proceso de secado al aire, las hojas y tallos de plantones de trigo se colocaron en un tubo de vidrio y se liberaron al mismo tubo de vidrio dos larvas de segundo estadio de *Trigonotylus caelestialium*. Después de que las larvas se liberaran, el tubo se tapó para dejar a las larvas estar en una cámara termostática a 25 °C. Para suministrar agua al trigo durante el ensayo, se dio agua al trigo desde el fondo del tubo de vidrio. Tres días después del tratamiento, se observó la supervivencia o la muerte en las larvas y se calculó la mortalidad de las 45 larvas mediante la siguiente ecuación.

$$\text{Mortalidad de larvas (\%)} = \left\{ \frac{\text{número de larvas muertas}}{\text{número de larvas que sobrevivieron} + \text{número de larvas muertas}} \right\} \times 100$$

Como resultado, los compuestos 1-20, 1-21, 3-20 y 4-20 exhibieron actividad insecticida teniendo una mortalidad del 80 % o mayor mediante un tratamiento de inmersión de la solución del fármaco a 50 ppm.

Además, los compuestos 1-20, 1-21, 3-20, 4-20, 1-22 y 1-23 exhibieron actividad insecticida teniendo una mortalidad del 80 % o mayor mediante un tratamiento de inmersión de la solución del fármaco a 10 ppm.

Ejemplo de Ensayo 9 ensayo de control de plagas de *Laodelphax striatella*

Las raíces de plantones de trigo ocho días después de la diseminación de los plantones se trataron con una solución de fármaco del compuesto de la presente invención a una concentración predeterminada, que se había preparado de tal manera que fuera un 10 % de agua acetona. El fármaco se absorbió desde las raíces durante 72 horas y después se liberaron a las mismas diez larvas de segundo estadio de *Laodelphax striatella*. En lo sucesivo, las 65 larvas se dejaron estar en una cámara termostática (16 horas de periodo de luz-8 horas de periodo de oscuridad) a

25 °C. Siete días después de la liberación, se observó la supervivencia o la muerte en las larvas y se calculó la mortalidad de las larvas mediante la siguiente ecuación. El ensayo se realizó por duplicado.

$$5 \quad \text{Mortalidad de larvas (\%)} \left\{ \frac{\text{número de larvas muertas}}{\text{número de larvas que sobrevivieron} + \text{número de larvas muertas}} \right\} \times 100$$

Como resultado, los compuestos 1-20, 1-21, 3-20, 4-20 y 2-20 exhibieron actividad insecticida teniendo una mortalidad del 80 % o mayor en la tasa de 20 µg/línea germinal.

10 Además, los compuestos 1-20, 1-21, 3-20, 4-20, 1-22, 1-23 y 5-20 exhibieron actividad insecticida teniendo una mortalidad del 80 % o mayor en la tasa de 2 µg/línea germinal.

15 Mientras tanto, el Ejemplo Comparativo 8 (Solicitud de Patente japonesa abierta N.º 5-78323, Compuesto N.º 51 en la Tabla 1) exhibió una mortalidad del 50 % en la tasa de 20 µg/línea germinal.

<Ensayo de tratamiento por irrigación del suelo>

Ejemplo de Ensayo 10 ensayo de control de plagas de *Laodelphax striatella*

20 Un plantón de arroz cultivado en tarro se sometió a tratamiento de irrigación del suelo con una solución de fármaco del compuesto de la presente invención a una concentración predeterminada, que se había preparado de tal manera que fuera un 10 % de agua acetona. Tres días después del tratamiento, se liberaron a la misma diez larvas de segundo estadio de *Laodelphax striatella*. En lo sucesivo, las larvas se dejaron estar en una cámara termostática (16 horas de periodo de luz-8 horas de periodo de oscuridad) a 25 °C. Tres días después de la liberación, se observó la supervivencia o la muerte en las larvas y se calculó la mortalidad de las larvas mediante la siguiente ecuación. El ensayo se realizó por duplicado.

$$30 \quad \text{Mortalidad de larvas (\%)} \left\{ \frac{\text{número de larvas muertas}}{\text{número de larvas que sobrevivieron} + \text{número de larvas muertas}} \right\} \times 100$$

Como resultado, los compuestos 1-20, 1-21, 3-20, 4-20, 1-22, 1-23 y 5-20 exhibieron actividad insecticida teniendo una mortalidad del 80 % o mayor en la tasa de 0,05 mg/línea germinal.

35 Mientras tanto, el Ejemplo Comparativo 8 (Documento de Patente 3 Solicitud de Patente japonesa abierta N.º 5-78323, Compuesto N.º 51 en la Tabla 1) y el Ejemplo Comparativo 9 (lo mismo Compuesto 56) exhibieron todos una mortalidad del 0 % en la tasa de 0,05 mg/línea germinal.

Ejemplo de Ensayo 11 ensayo de control de plagas de *Sogatella furcifera*

40 Un plantón de arroz cultivado en tarro se sometió a tratamiento de irrigación del suelo con una solución de fármaco del compuesto de la presente invención a una concentración predeterminada, que se había preparado de tal manera que fuera un 10 % de agua acetona. Tres días después del tratamiento, se liberaron a la misma diez larvas de segundo estadio de *Sogatella furcifera*. En lo sucesivo, las larvas se dejaron estar en una cámara termostática (16 horas de periodo de luz-8 horas de periodo de oscuridad) a 25 °C. Tres días después de la liberación, se observó la supervivencia o la muerte en las larvas y se calculó la mortalidad de las larvas mediante la siguiente ecuación. El ensayo se realizó por duplicado.

$$50 \quad \text{Mortalidad de larvas (\%)} \left\{ \frac{\text{número de larvas muertas}}{\text{número de larvas que sobrevivieron} + \text{número de larvas muertas}} \right\} \times 100$$

Como resultado, los compuestos 1-20 y 4-20 exhibieron actividad insecticida teniendo una mortalidad del 80 % o mayor en la tasa de 0,01 mg/línea germinal.

Ejemplo de Ensayo 12 ensayo de control de plagas de *Nilaparvata lugens*

55 Un plantón de arroz cultivado en tarro se sometió a tratamiento de irrigación del suelo con una solución de fármaco del compuesto de la presente invención a una concentración predeterminada, que se había preparado de tal manera que fuera un 10 % de agua acetona. Tres días después del tratamiento, se liberaron a la misma diez larvas de segundo estadio de *Nilaparvata lugens*. En lo sucesivo, las larvas se dejaron estar en una cámara termostática (16 horas de periodo de luz-8 horas de periodo de oscuridad) a 25 °C. Tres días después de la liberación, se observó la supervivencia o la muerte en las larvas y se calculó la mortalidad de las larvas mediante la siguiente ecuación. El ensayo se realizó por duplicado.

$$65 \quad \text{Mortalidad de larvas (\%)} \left\{ \frac{\text{número de larvas muertas}}{\text{número de larvas que sobrevivieron} + \text{número de larvas muertas}} \right\} \times 100$$

Como resultado, los compuestos 1-20, 1-21, 3-20, 4-20, 1-23 y 5-20 exhibieron actividad insecticida teniendo una mortalidad del 80 % o mayor en la tasa de 0,05 mg/línea germinal.

5 Mientras tanto, el Ejemplo Comparativo 8 (Documento de Patente 3 Solicitud de Patente japonesa abierta N.º 5-78323, Compuesto N.º 51 en la Tabla 1) y el Ejemplo Comparativo 9 (lo mismo Compuesto 56) exhibieron todos una mortalidad del 15 % en la tasa de 0,05 mg/línea germinal.

Ejemplo de Ensayo 13 ensayo de control de plagas de *Oulema oryzae*

10 Un plantón de arroz cultivado en tarro se sometió a tratamiento de irrigación del suelo con una solución de fármaco del compuesto de la presente invención a una concentración predeterminada, que se había preparado de tal manera que fuera un 10 % de agua acetona. Tres días después del tratamiento, se liberaron a la misma dos larvas de segundo estadio de *Oulema oryzae*. En lo sucesivo, las larvas se dejaron estar en una cámara termostática (16 horas de periodo de luz-8 horas de periodo de oscuridad) a 25 °C. Tres días después de la liberación, se observó la supervivencia o la muerte en las larvas y se calculó la mortalidad de las larvas mediante la siguiente ecuación. El ensayo se realizó por duplicado.

$$\text{Mortalidad de larvas (\%)} = \left\{ \frac{\text{número de larvas muertas}}{\text{número de larvas que sobrevivieron} + \text{número de larvas muertas}} \right\} \times 100$$

20 Como resultado, el compuesto 1-20 exhibió actividad insecticida teniendo una mortalidad del 80 % o mayor en la tasa de 0,05 mg/línea germinal.

Ejemplo de Ensayo 14 ensayo de control de plagas de *Nephotettix cincticeps*

25 Un plantón de arroz cultivado en tarro se sometió a tratamiento de irrigación del suelo con una solución de fármaco del compuesto de la presente invención a una concentración predeterminada, que se había preparado de tal manera que fuera un 10 % de agua acetona. Tres días después del tratamiento, se liberaron a la misma cinco larvas de segundo estadio de *Nephotettix cincticeps*. En lo sucesivo, las larvas se dejaron estar en una cámara termostática (16 horas de periodo de luz-8 horas de periodo de oscuridad) a 25 °C. Tres días después de la liberación, se observó la supervivencia o la muerte en las larvas y se calculó la mortalidad de las larvas mediante la siguiente ecuación. El ensayo se realizó por duplicado.

$$\text{Mortalidad de larvas (\%)} = \left\{ \frac{\text{número de larvas muertas}}{\text{número de larvas que sobrevivieron} + \text{número de larvas muertas}} \right\} \times 100$$

35 Como resultado, el compuesto 1-20 exhibió actividad insecticida teniendo una mortalidad del 80 % o mayor en la tasa de 0,05 mg/línea germinal.

40 Efectos contra plagas resistentes a fármacos

<Ensayo de Pulverizado Foliar>

Ejemplo de Ensayo 15 ensayo de control de plagas de *Laodelphax striatella*

45 Una solución de fármaco del compuesto de la presente invención a una concentración predeterminada, que se había preparado de tal manera que fuera un 50 % de agua acetona (disponible un 0,05 % de Tween20), se pulverizó a las hojas a un plantón de arroz cultivado en tarro. Después de un proceso de secado al aire, se liberaron al mismo diez larvas de segundo estadio de *Laodelphax striatella* que exhiben resistencia a fármaco a fipronilo. En lo sucesivo, las larvas se dejaron estar en una cámara termostática (16 horas de periodo de luz - 8 horas de periodo de oscuridad) a 25 °C. Seis días después de la liberación, se observó la supervivencia o la muerte en las larvas y se calculó la mortalidad de las larvas mediante la siguiente ecuación. Ensayo por duplicado.

$$\text{Mortalidad de larvas (\%)} = \left\{ \frac{\text{número de larvas muertas}}{\text{número de larvas que sobrevivieron} + \text{número de larvas muertas}} \right\} \times 100$$

Además, para el origen de las plagas de ensayo, se usaron insectos de *Laodelphax striatella* recogidos al aire libre en la prefectura de Kumamoto en 2006.

60 Como resultado, el compuesto 1-20 exhibió actividad insecticida teniendo una mortalidad del 80 % o mayor mediante un tratamiento foliar a 1,25 ppm.

Ejemplo de Ensayo 16 ensayo de control de plagas de *Nilaparvata lugens*

65 Una solución de fármaco del compuesto de la presente invención a una concentración predeterminada, que se había preparado de tal manera que fuera un 50 % de agua acetona (disponible un 0,05 % de Tween20), se pulverizó a las

hojas a un plantón de arroz cultivado en tarro. Después de un proceso de secado al aire, se liberaron al mismo larvas de segundo estadio de *Nilaparvata lugens* que exhiben resistencia a fármaco a imidacloprid. En lo sucesivo, las larvas se dejaron estar en una cámara termostática (16 horas de periodo de luz - 8 horas de periodo de oscuridad) a 25 °C. Seis días después de la liberación, se observó la supervivencia o la muerte en las larvas y se calculó la mortalidad de las larvas mediante la siguiente ecuación. Ensayo por duplicado.

$$\text{Mortalidad de larvas (\%)} = \left\{ \frac{\text{número de larvas muertas}}{\text{número de larvas que sobrevivieron} + \text{número de larvas muertas}} \right\} \times 100$$

Además, para el origen de las plagas de ensayo, se usaron insectos de *Nilaparvata lugens* recogidos al aire libre en la prefectura de Fukuoka en 2005.

Como resultado, el compuesto 1-20 exhibió actividad insecticida teniendo una mortalidad del 80 % o mayor mediante un tratamiento foliar a 20 ppm.

Ejemplo de Ensayo 17 ensayo de control de plagas de *Sogatella furcifera*

Una solución de fármaco del compuesto de la presente invención a una concentración predeterminada, que se había preparado de tal manera que fuera un 50 % de agua acetona (disponible un 0,05 % de Tween20), se pulverizó a las hojas a un plantón de arroz cultivado en tarro. Después de un proceso de secado al aire, se liberaron al mismo larvas de segundo estadio de *Sogatella furcifera* que exhiben resistencia a fármaco a fipronilo. En lo sucesivo, las larvas se dejaron estar en una cámara termostática (16 horas de periodo de luz - 8 horas de periodo de oscuridad) a 25 °C. Cuatro días después de la liberación, se observó la supervivencia o la muerte en las larvas y se calculó la mortalidad de las larvas mediante la siguiente ecuación. Ensayo por duplicado.

$$\text{Mortalidad de larvas (\%)} = \left\{ \frac{\text{número de larvas muertas}}{\text{número de larvas que sobrevivieron} + \text{número de larvas muertas}} \right\} \times 100$$

Además, para el origen de las plagas de ensayo, se usaron insectos de *Sogatella furcifera* recogidos al aire libre en la ciudad de Odawara en 2010.

Como resultado, el compuesto 1-20 exhibió actividad insecticida teniendo una mortalidad del 80 % o mayor mediante un tratamiento foliar a 20 ppm.

<Ensayo de irrigación del suelo>

Ejemplo de Ensayo 18 ensayo de control de plagas de *Nilaparvata lugens*

Un plantón de arroz cultivado en tarro se sometió a tratamiento de irrigación del suelo con una solución de fármaco del compuesto de la presente invención a una concentración predeterminada, que se había preparado de tal manera que fuera un 10 % de agua acetona. Tres días después del tratamiento, se liberaron al mismo diez larvas de segundo estadio de *Nilaparvata lugens* que exhiben resistencia a fármaco a imidacloprid. En lo sucesivo, las larvas se dejaron estar en una cámara termostática (16 horas de periodo de luz - 8 horas de periodo de oscuridad) a 25 °C. Tres días después de la liberación, se observó la supervivencia o la muerte en las larvas y se calculó la mortalidad de las larvas mediante la siguiente ecuación. El ensayo se realizó por duplicado.

$$\text{Mortalidad de larvas (\%)} = \left\{ \frac{\text{número de larvas muertas}}{\text{número de larvas que sobrevivieron} + \text{número de larvas muertas}} \right\} \times 100$$

Además, por comparación, el ensayo contra alguna población de *Nilaparvata lugens* que es altamente susceptible a imidacloprid se realizó por el mismo método que se describe anteriormente y los resultados del mismo se muestran en la Tabla 43. Como se describe en la Tabla 43, los compuestos 1-20, 1-21, 1-22, 1-23, 3-20, 4-20 y 5-20 exhibieron mortalidad equivalente de larvas contra poblaciones resistentes a fármacos y poblaciones susceptibles de *Nilaparvata lugens*. A partir del ensayo, se vuelve obvio que 1-20, 1-21, 1-22, 1-23, 3-20, 4-20 y 5-20 exhibieron altos efectos insecticidas incluso contra *Nilaparvata lugens* resistente a fármacos.

Además, para el origen de las plagas de ensayo, se usaron los bichos recogidos al aire libre en la prefectura de Kumamoto en 2007 como *Nilaparvata lugens* resistente a fármacos y los bichos recogidos dentro de la prefectura de Kagoshima y después sucesivamente criados en el interior durante un largo tiempo como las poblaciones de *Nilaparvata lugens* susceptible a imidacloprid.

[Tabla 54-1]

Compuestos	Tasa (mg/tarro)	Efectos insecticidas contra <i>Nilaparvata lugens</i> (mortalidad de larvas %)	
		Poblaciones Susceptibles	Poblaciones resistentes a fármacos
		Tres días después del tratamiento	Tres días después del tratamiento
1-20	0,05	96	100
	0,01	95	81
1-21	0,05	67	50
1-22	0,05	75	60
1-23	0,05	85	70
3-20	0,05	100	100
4-20	0,05	95	100
5-20	0,05	91	100
Ejemplo Comparativo 3 (Documento de Patente 2 Ejemplo 4)	0,05		45
Ejemplo Comparativo 4 (Documento de Patente 2 Ejemplo 3)	0,05		25
Ejemplo Comparativo 5 (Documento de Patente 2 Ejemplo 5)	0,05		25
Ejemplo Comparativo 6 (Documento de Patente 2 Ejemplo 7)	0,05		20
Ejemplo Comparativo 8 (Documento de Patente 3 Ejemplo 51)	0,05	15	13

[Tabla 54-2]

Ejemplo comparativo 9 (Documento de Patente 3 Ejemplo 56)	0,05	0	31
Imidacloprid	0,05	90	6
	0,01	73	0

5 Ejemplo de Ensayo 19 ensayo de control de plagas de *Sogatella furcifera*

Un plantón de arroz cultivado en tarro se sometió a tratamiento de irrigación del suelo con una solución de fármaco del compuesto de la presente invención a una concentración predeterminada, que se había preparado de tal manera que fuera un 10 % de agua acetona. Tres días después del tratamiento, se liberaron al mismo diez larvas de segundo estadio de *Sogatella furcifera* que exhiben resistencia a fármaco a fipronilo. En lo sucesivo, las larvas se dejaron estar en una cámara termostática (16 horas de periodo de luz - 8 horas de periodo de oscuridad) a 25 °C. Seis días después de la liberación, se observó la supervivencia o la muerte en las larvas y se calculó la mortalidad de las larvas mediante la siguiente ecuación. El ensayo se realizó por duplicado.

15
$$\text{Mortalidad de larvas (\%)} = \left\{ \frac{\text{número de larvas muertas}}{\text{número de larvas que sobrevivieron} + \text{número de larvas muertas}} \right\} \times 100$$

Además, por comparación, el ensayo contra alguna población de *Sogatella furcifera* que es altamente susceptible a fipronilo se realizó por el mismo método que se describe anteriormente y los resultados del mismo se muestran en la Tabla 44. Como se muestra en la Tabla 44, el compuesto 1-20 exhibió mortalidad equivalente de larvas contra poblaciones resistentes a fármacos y poblaciones susceptibles de *Sogatella furcifera*. A partir del ensayo, se vuelve obvio que el compuesto 1-20 exhibió altos efectos insecticidas incluso contra *Sogatella furcifera* resistente a fármacos.

25 Además, para el origen de las plagas de ensayo, se usaron los bichos recogidos en la ciudad de Odawara en 2010 como *Sogatella furcifera* resistente a fármacos y los bichos recogidos dentro de la ciudad de Chigasaki en 1970 y después sucesivamente criados en el interior durante un largo tiempo como las poblaciones de *Sogatella furcifera*

susceptibles.

[Tabla 55]

Compuestos	Tasa (mg/tarro)	Efectos insecticidas contra <i>Sogatella furcifera</i> (mortalidad de larvas %)	
		Poblaciones Susceptibles	Poblaciones resistentes a fármacos
		Seis días después del tratamiento	Seis días después del tratamiento
1-20	0,01	88	88
	0,005	75	53
Fipronilo	0,05		90
	0,01	100	40
	0,005	100	
	0,01	78	

5 Ejemplo de Ensayo 20 ensayo de control de plagas de *Laodelphax striatella*

Un plantón de arroz cultivado en tarro se sometió a tratamiento de irrigación del suelo con una solución de fármaco del compuesto de la presente invención a una concentración predeterminada, que se había preparado de tal manera que fuera un 10 % de agua acetona. Tres días después del tratamiento, se liberaron al mismo diez larvas de segundo estadio de *Laodelphax striatella* que exhiben resistencia a fármaco a fipronilo. En lo sucesivo, las larvas se dejaron estar en una cámara termostática (16 horas de periodo de luz - 8 horas de periodo de oscuridad) a 25 °C. Seis días después de la liberación, se observó la supervivencia o la muerte en las larvas y se calculó la mortalidad de las larvas mediante la siguiente ecuación. El ensayo se realizó por duplicado.

15
$$\text{Mortalidad de larvas (\%)} = \left\{ \frac{\text{número de larvas muertas}}{\text{número de larvas que sobrevivieron} + \text{número de larvas muertas}} \right\} \times 100$$

Además, por comparación, el ensayo contra alguna población de *Laodelphax striatella* que es altamente susceptible a fipronilo se realizó por el mismo método que se describe anteriormente y los resultados del mismo se muestran en la Tabla 45. Como se muestra en la Tabla 45, el compuesto 1-20 exhibió mortalidad equivalente de larvas contra poblaciones resistentes a fármacos y poblaciones susceptibles de *Laodelphax striatella*. A partir del ensayo, se vuelve obvio que el compuesto 1-20 exhibió altos efectos insecticidas incluso contra *Laodelphax striatella* resistente a fármacos.

25 Además, para el origen de las plagas de ensayo, se usaron los bichos recogidos en la prefectura de Kumamoto en 2006 como *Laodelphax striatella* resistente a fármacos y los bichos sucesivamente criados en el interior durante un largo tiempo como las poblaciones de *Laodelphax striatella* susceptibles.

[Tabla 56]

Compuestos	Tasa (mg/tarro)	Efectos insecticidas contra <i>Laodelphax striatella</i> (mortalidad de larvas %)	
		Poblaciones Susceptibles	Poblaciones resistentes a fármacos
		Seis días después del tratamiento	Seis días después del tratamiento
1-20	0,005	85	79
Fipronilo	0,05		90
	0,02		76
	0,01	100	
	0,005	89	

30 Ejemplo de Ensayo 21 ensayo de control de plagas de *Musca domestica*

Una solución de fármaco del compuesto de la presente invención, que se había ajustado a ser 50 ppm con un líquido de sacarosa al 40 %, se adsorbió en una almohadilla de algodón y la almohadilla de algodón se puso en un vial. Dos adultos criados en el interior se liberaron al mismo. En lo sucesivo, los adultos se dejaron estar dentro a temperatura ambiente de 25 °C. Cuatro días después de la liberación, los adultos se observaron para la supervivencia o la muerte. Cuando dos adultos agonizaron en la muerte, se juzgó ser eficaz.

40 Como resultado, los compuestos 1-20, 1-21, 3-20, 4-20, 1-22, 1-23, 5-20 y 2-20 exhibieron alta actividad que todos los adultos agonizaron en la muerte, en la tasa a 50 ppm.

Ejemplo de Ensayo 22 ensayo de control de plagas de estadios de larva de mosca doméstica

El compuesto 1-20 se mezcló con una cantidad extremadamente pequeña de DMSO y después la mezcla resultante se disolvió en agua desionizada para ajustar la solución del fármaco. 10 ml de la solución del fármaco ajustada a ser 30 ppm se añadió a 10 g de polvo en el que se habían mezclado salvado de trigo, MF feed (Oriental Yeast Co., Ltd) y levadura seca en una relación de 25:5:1 y la mezcla se mezcló bien para preparar un cebo para larvas de estadio de mosca doméstica. Se llenó ligeramente un tubo Falcon de 50 ml con el cebo incluyendo el compuesto y se liberaron 20 huevos al mismo. La boca del tubo Falcon se cubrió con una tapa con malla y el tubo se dejó estar a 25 °C. Veinte días después del tratamiento de fármaco, los números de estadios de larvas, crisálidas y adultos se midieron y se calculó la mortalidad de las larvas, las crisálidas y los adultos mediante la siguiente ecuación. El ensayo se realizó repitiendo cada tratamiento dos veces.

Mortalidad de larvas, crisálidas y adultos (%) = {número de larvas, crisálidas y adultos muertos / (número de larvas, crisálidas y adultos que han sobrevivido + número de larvas, crisálidas y adultos muertos)} x 100

Como resultado, el compuesto 1-20 exhibió una mortalidad del 100 % en la tasa a 30 ppm.

Ejemplo de Ensayo 23 ensayo de control de plagas de *Haemaphysalis longicornis*

30 µl de una solución de acetona del compuesto de la presente invención a 200 ppm y acetona a 10 ppm se puso dentro de un vial de vidrio de 4 ml. El vial de vidrio se cargó en un agitador y se secó por soplado mientras se rotaba para formar una película seca del compuesto en la pared interna del vial. Después de que el vial se secara durante 24 horas o más, 10 ácaros jóvenes de *Haemaphysalis longicornis* se liberaron al mismo y se cubrió el borde del vial. El vial se dejó estar en una cámara termostática en condiciones de oscuridad total a 25 °C y la humedad del 85 %. Un día después de la liberación, se observó la supervivencia o muerte de los insectos, la mortalidad de los insectos se calculó mediante la siguiente ecuación. El ensayo se realizó repitiendo cada tratamiento por duplicado.

Mortalidad de insectos (%) = {número de insectos muertos / (número de insectos que han sobrevivido + número de insectos muertos)} x 100

Como resultado, los compuestos 1-21, 1-22, 1-23, 5-20 y 2-20 exhibieron una actividad insecticida teniendo una mortalidad del 80 % o mayor en la tasa a 200 ppm.

Ejemplo de Ensayo 24 ensayo de control de plagas de *Haemaphysalis longicornis*

Una cápsula con un diámetro de 2 cm y una altura de 2 cm se adhirió a la espalda de un ratón. Se disolvieron 9,5 µg del compuesto de la presente invención en etanol y la mezcla resultante se añadió gota a gota a la superficie del cuerpo del ratón en la cápsula. La cápsula se secó suficientemente, después se liberaron a la misma diez ácaros jóvenes de *Haemaphysalis longicornis* y la parte superior de la cápsula se selló herméticamente con una tapa. El ratón se crió en condiciones de periodo de 12 horas de luz y periodo de 12 horas de oscuridad a 25 °C en una jaula. Cinco días después de la liberación, la cápsula se quitó del mismo para medir los números de ácaros vivos y muertos y los individuos de ácaros jóvenes chupando sangre y la tasa de insectos agonizados en la muerte se calculó de acuerdo con la siguiente ecuación:

Tasa de insectos agonizados en la muerte (%) = {número de insectos agonizados en la muerte / (número de insectos que han sobrevivido + número de insectos agonizados en la muerte)} x 100

Como resultado, los compuestos 1-20 y 4-20 exhibieron actividad insecticida de insectos agonizados en la muerte teniendo una mortalidad del 80 % o mayor en la tasa a 9,5 µg.

Ejemplo de Ensayo 25 ensayo de control de plagas de *Haemaphysalis longicornis*

Tres placas Petri con un diámetro de 9 cm y una altura de 1 cm se adhirieron a la espalda de un perro. Se disolvió el compuesto 1-20 de la presente invención en etanol de tal manera que fuera 5,35 mg/ml y la mezcla se añadió gota a gota a la superficie del cuerpo del perro en la placa Petri. La placa Petri se secó suficientemente, después se liberaron a la misma treinta ácaros jóvenes de *Haemaphysalis longicornis* y la parte superior de la cápsula se selló herméticamente con una tapa. Cada perro se crió en una jaula en condiciones de periodo de 10 horas de luz y periodo de 14 horas de oscuridad a 23 °C. Tres días después de la liberación, las placas Petri se quitaron de los mismos para medir los números de ácaros vivos y muertos y los individuos de ácaros jóvenes chupando sangre y la mortalidad de los ácaros se calculó de acuerdo con la siguiente ecuación:

Mortalidad de ácaros (%) = {número de ácaros muertos / (número de ácaros que han sobrevivido + número de ácaros muertos)} x 100

Como resultado, el compuesto 1-20 exhibió una mortalidad del 100 %.

Ejemplo de Ensayo 26 ensayo de control de plagas de *Ctenocephalides felis*

5 Tres placas Petri con un diámetro de 9 cm y una altura de 1 cm se adhirieron a la espalda de un perro. Se disolvió el compuesto 1-20 de la presente invención en etanol de tal manera que fuera 5,35 mg/ml y la mezcla se añadió gota a gota a la superficie del cuerpo del perro en la placa Petri. La placa Petri se secó suficientemente, después se liberaron a la misma veinte ácaros jóvenes de *Ctenocephalides felis* y la parte superior de la cápsula se selló herméticamente con una tapa. Cada perro se crio en una jaula en condiciones de periodo de 10 horas de luz y periodo de 14 horas de oscuridad a 23 °C. Tres días después de la liberación, las placas Petri se quitaron de los mismos para medir los números de insectos vivos y muertos de *Ctenocephalides felis* y los individuos chupando sangre y la mortalidad de los insectos se calculó de acuerdo con la siguiente ecuación:

$$\text{Mortalidad de insectos (\%)} = \left\{ \frac{\text{número de insectos muertos}}{\text{número de insectos que han sobrevivido} + \text{número de insectos muertos}} \right\} \times 100$$

15 Como resultado, el compuesto 1-20 exhibió una mortalidad del 100 %.

Ejemplo de Ensayo 27 ensayo de control de plagas de *Coptotermes formosanus*

20 Un papel de filtro se dejó empapar en una solución de fármaco del compuesto de la presente invención a una concentración predeterminada, que se había preparado con acetona. El papel de filtro se secó por soplado suficientemente y se puso después en una placa Petri de plástico y se liberaron 5 insectos de *Coptotermes formosanus* (hormiga trabajadora) a la misma. En lo sucesivo, los insectos se dejaron estar en una cámara termostática (periodo de 16 horas de luz - periodo de 8 horas de oscuridad a 25 °C). Siete días después de la liberación, se observó la supervivencia o la muerte de los insectos y se calculó la mortalidad de los insectos por la siguiente ecuación. El ensayo se realizó por duplicado.

$$\text{Mortalidad de insectos (\%)} = \left\{ \frac{\text{número de insectos muertos}}{\text{número de insectos que han sobrevivido} + \text{número de insectos muertos}} \right\} \times 100$$

30 Como resultado, el compuesto 1-20 exhibió actividad insecticida teniendo una mortalidad del 100 % en la tasa a 0,5 µg/cm².

Las actividades biológicas de los compuestos preferidos de la presente invención se describieron en las Tablas 57 y 58.

35

[Tabla 57-1]

(tratamiento foliar)						
		Compuesto 1-20	Compuesto 1-21	Compuesto 3-20	Compuesto 4-20	Compuesto 5-20
Ejemplo de ensayo	Concentración (ppm)	% de mortalidad				
Ejemplo de ensayo 1 <i>Plutella xylostella</i>	100	100	80	55	100	100
	20	100	10	0	70	100
	5	50				20
Ejemplo de ensayo 2 <i>Spodoptera litura</i>	100	90	55	30	20	60
Ejemplo de ensayo 3 <i>Aphis gossypii</i>	100	100	100	100		
	20	100	100	100		
	5	100	100	100	100	100
	1,25	75	100	100	100	55
	0,313		55	15		
Ejemplo de ensayo 4 <i>Aulacophora femoralis</i>	5	100				
	1,25	100				

ES 2 631 986 T3

Ejemplo de ensayo 5 <i>Callosobruchus chinensis</i>	100	100				
	10	100				

[Tabla 57-2]

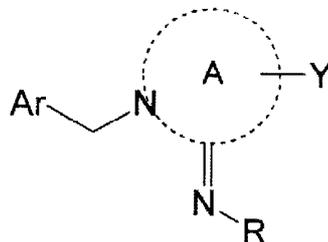
Ejemplo de ensayo 6 <i>Laodelphax striatella</i>	1,25	95				
Ejemplo de ensayo 7 <i>Frankliniella occidentalis</i>	100	80	90	45	60	50
	20	50	80			
Ejemplo de ensayo 8 <i>Trigonotylus caelestialium</i>	50	100	100	100	100	
	10	100	100	100	100	17
	2	50	67	50	33	

[Tabla 58]

Tratamiento de irrigación del suelo						
		Compuesto 1-20	Compuesto 1-21	Compuesto 3-20	Compuesto 4-20	Compuesto 5-20
Ejemplo de Ensayo	Concentración (mg/tarro)	% de mortalidad				
Ejemplo de Ensayo 10 <i>Laodelphax striatella</i>	0,05	100	100	90	100	95
	0,01	91	20		100	52
	0,005	75			35	26
Ejemplo de Ensayo 11 <i>Sogatella furcifera</i>	0,01	88				
	0,005	53				
Ejemplo de Ensayo 12 <i>Nilaparvata lugens</i>	0,05	100	85	100	100	100
	0,01	85	10	100	96	90
	0,005	80				
Ejemplo de Ensayo 14 <i>Nephotettix cincticeps</i>	0,01	100				
	0,001	67				
	0,0001	67				

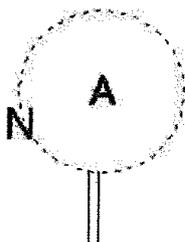
REIVINDICACIONES

1. Un agente de control de plagas que contiene un derivado heterocíclico que contiene nitrógeno y que tiene un grupo 2-imino, que está representado por la siguiente Fórmula (I), o sales del mismo,

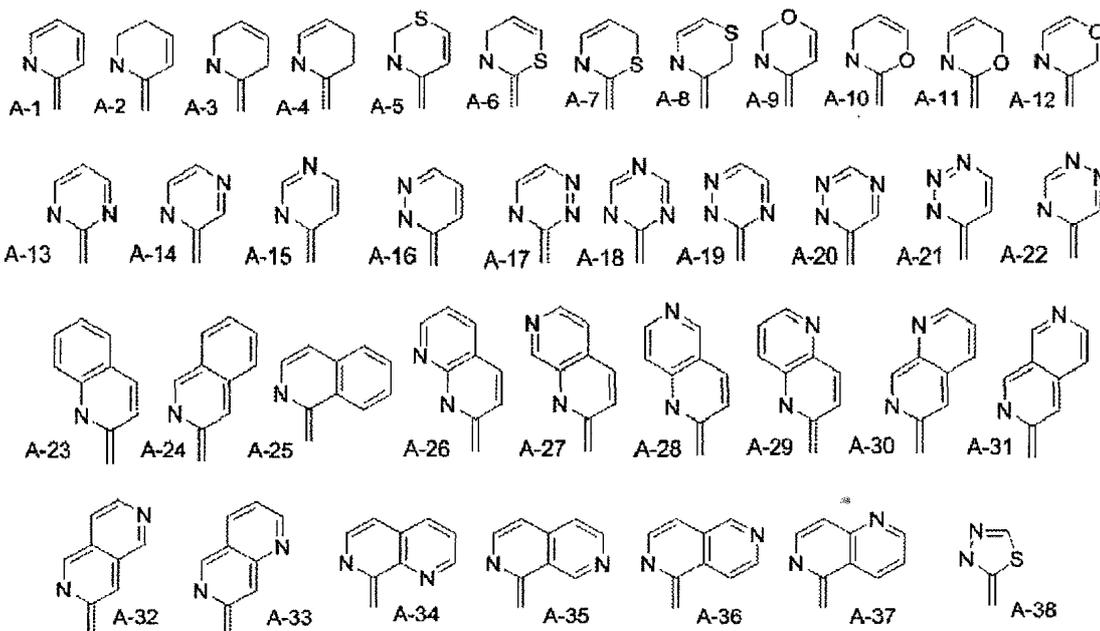


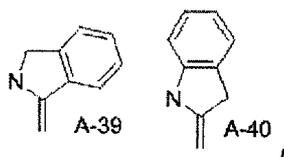
Fórmula (I) ,

en la fórmula Ar representa un grupo fenilo que puede sustituirse con cualquiera de un átomo halógeno, un grupo alquilo C1 a C4 que puede estar sustituido con un átomo halógeno, un grupo alquilo C1 a C4 que puede estar sustituido con un átomo halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo ciano, un grupo nitro; un heterociclo de 5 a 6 miembros que puede sustituirse con cualquiera de un átomo halógeno, un grupo alquilo C1 a C4 que puede estar sustituido con un átomo halógeno, un grupo alquilo C1 a C4 que puede estar sustituido con un átomo halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo ciano y un grupo nitro; o un grupo heterocicloalquilo de 4 a 10 miembros, el anillo representado por la siguiente Fórmula:

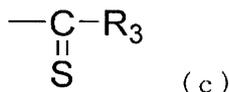


representa uno cualquiera de los anillos representados por las siguientes Fórmulas (A-1) a (A-40):





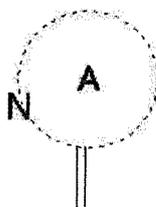
5 Y representa un átomo de hidrógeno, un átomo halógeno, un grupo hidroxilo, un grupo alquilo C1 a C6 que puede estar sustituido con un átomo halógeno, un grupo alquilo C1 a C6 que puede estar sustituido con un átomo halógeno, un grupo ciano o un grupo nitro, y
 R representa un grupo representado por la siguiente Fórmula (c)



10 donde R3 representa un grupo alquilo C1 a C6 que puede estar sustituido con un átomo halógeno.

2. El agente de control de plagas de acuerdo con la reivindicación 1, en el que

15 el anillo representado por la siguiente Fórmula:

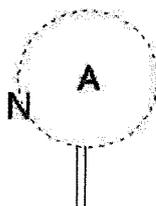


20 representa uno cualquiera de los anillos representados por las Fórmulas (A-1), (A-13) a (A-16), (A-23), (A-25), (A-38) y (A-39).

3. El agente de control de plagas de acuerdo con las reivindicaciones 1 o 2, en el que Ar en la Fórmula (I) es un grupo 6-cloro-3-piridilo, un grupo 6-cloro-5-fluoro-3-piridilo, un grupo 6-fluoro-3-piridilo, un grupo 6-bromo-3-piridilo, un grupo 2-cloro-5-pirimidinilo, un grupo 2-cloro-5-tiazolilo o un grupo 5-cloro-2-pirazinilo.

25 4. El agente de control de plagas de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, en el que

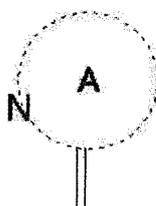
el anillo representado por la siguiente Fórmula:



30 representa un anillo representado por la Fórmula (A-1) e Y representa un átomo de hidrógeno, un átomo halógeno o un grupo ciano.

5. El agente de control de plagas de acuerdo con la reivindicación 1, en el que

Ar representa un grupo 6-cloro-3-piridilo, un grupo 2-cloro-5-tiazolilo, un grupo 6-cloro-5-fluoro-3-piridilo, un grupo 6-fluoro-3-piridilo, un grupo 6-bromo-3-piridilo, un grupo 2-cloro-5-pirimidilo y un grupo 6-trifluorometil-3-piridilo, el anillo representado por la siguiente Fórmula:



40

representa un anillo representado por la Fórmula (A-1),

Y representa un átomo de hidrógeno y

R3 representa un grupo trifluorometilo, un grupo difluorometilo, un grupo clorodifluorometilo o un grupo pentafluoroetilo.

6. El agente de control de plagas de acuerdo con la reivindicación 1, en el que el derivado heterocíclico que contiene nitrógeno que tiene un grupo 2-imino es N-[1-((6-cloropiridin-3-il)metil)piridin-2(1H)-iliden]-2,2,2-trifluoroetanoamida.

7. Un método para controlar una plaga excepto para el tratamiento terapéutico de animales mediante el uso de los agentes de control de plagas de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6.

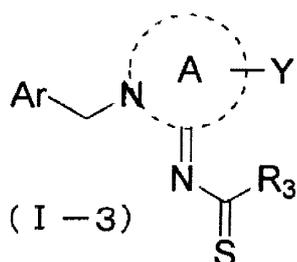
8. El método para controlar plagas de acuerdo con la reivindicación 7, que comprende tratar semillas, raíces, tubérculos, bulbos y rizomas de plantas, plantas germinadas, plantones, suelo, una solución nutriente en cultivo de solución nutriente o un medio sólido en cultivo de solución nutriente con el agente de control de plagas para penetrar y migrar el compuesto representado por la Fórmula (I) hacia las plantas.

9. El método de acuerdo con las reivindicaciones 7 u 8, en donde la plaga es una plaga agrícola y hortícola.

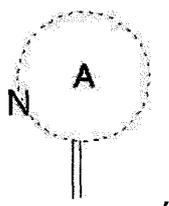
10. El método de acuerdo con la reivindicación 7, en donde la plaga es una plaga parásita de animales.

11. El método de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 7 a 10, en donde la plaga es una plaga que tiene resistencia a fármacos frente a imidacloprid o fipronilo.

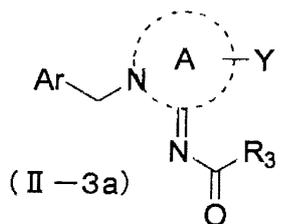
12. Un método para preparar un compuesto representado por la Fórmula (I-3)



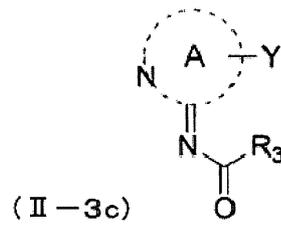
en la que Ar, el anillo representado por la siguiente Fórmula:



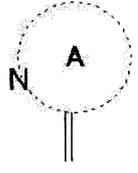
Y y R3 tienen el mismo significado como se define para la Fórmula (I) en la reivindicación 1, comprendiendo el método una reacción de conversión de un átomo de oxígeno en el compuesto representado por la Fórmula (II-3a)



o en el compuesto representado por la Fórmula (II-3c)



5 en un átomo de azufre,
 en dichas Fórmulas II-3a y II-3c el anillo representado por la siguiente Fórmula:



Y y R3 tienen el mismo significado que aquellos definidos como Fórmula (I) en la reivindicación 1.