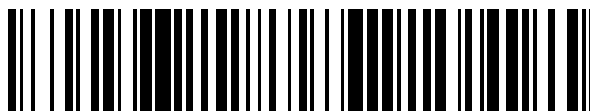


19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 707 398**

51 Int. Cl.:

C07D 401/14	(2006.01)	C07D 417/04	(2006.01)
C07D 405/14	(2006.01)	C07D 417/14	(2006.01)
C07D 413/14	(2006.01)	C07D 471/04	(2006.01)
A01N 43/56	(2006.01)	C07D 513/04	(2006.01)
A01N 43/78	(2006.01)		
C07D 401/04	(2006.01)		
C07D 403/04	(2006.01)		
C07D 407/14	(2006.01)		
C07D 409/14	(2006.01)		
C07D 413/04	(2006.01)		

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

- 86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **09.09.2014 PCT/US2014/054671**
- 87 Fecha y número de publicación internacional: **19.03.2015 WO15038503**
- 96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **09.09.2014 E 14766377 (7)**
- 97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **07.11.2018 EP 3044220**

54 Título: **Pesticidas de azol bicíclico sustituido con heterociclo**

30 Prioridad:

13.09.2013 US 201361877329 P

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

03.04.2019

73 Titular/es:

**FMC CORPORATION (100.0%)
FMC Tower at Cira Center South, 2929 Walnut
Street
Philadelphia, PA 19104, US**

72 Inventor/es:

**CLARK, DAVID, ALAN;
FRAGA, BREENA, GLORIANA y
ZHANG, WENMING**

74 Agente/Representante:

ELZABURU, S.L.P

ES 2 707 398 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

Pesticidas de azol bicíclico sustituido con heterociclo

Campo de la invención

5 Esta invención se refiere a ciertos azoles bicíclicos sustituidos, sus N-óxidos, sales y composiciones adecuadas para usos agronómicos y no agronómicos, y métodos de su uso para controlar plagas de invertebrados tales como artrópodos en medios tanto agronómicos como no agronómicos.

Antecedentes de la invención

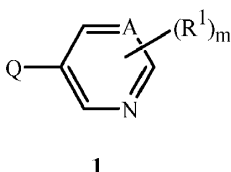
10 El control de plagas de invertebrados es extremadamente importante para conseguir la alta eficiencia de los cultivos. El daño por plagas de invertebrados a los cultivos agronómicos en crecimiento y almacenados puede provocar una reducción significativa en la productividad y por tanto dar por resultado unos mayores costes para el consumidor. El control de plagas de invertebrados en silvicultura, cultivos de invernadero, plantas ornamentales, cultivos de cobertura, productos alimenticios y de fibra almacenados, ganado, hogar, césped, productos de madera y salud pública y animal también es importante. Muchos productos están disponibles comercialmente para estos propósitos, pero continúa la necesidad de nuevos compuestos que sean más efectivos, menos costosos, menos tóxicos, más seguros medioambientalmente o que tengan diferentes sitios de acción.

15 El documento WO2013/106254 describe compuestos pesticidamente activos con un núcleo bicíclico que comprende un anillo pirazol condensado con un anillo fenilo, piridina o pirimidina.

El documento EP-A2274983 describe compuestos activos contra los artrópodos que comprenden un núcleo bicíclico que comprende un anillo oxazol condensado con un anillo fenilo, piridina o pirimidina.

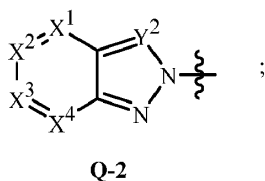
20 **Compendio de la invención**

Esta invención está dirigida a compuestos de Fórmula 1 (que incluyen todos los isómeros geométricos y estereoisómeros), N-óxidos, y sales de los mismos, y composiciones que los contienen y su uso para controlar las plagas de invertebrados:



25 en los que

Q es



A es CH, CR¹ o N;

30 cada R¹ es independientemente halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄ o haloalquiltio C₁-C₄;

m es 0, 1, 2 o 3;

X¹ es CR², y X², X³ y X⁴ son cada uno independientemente CR³; o X² es CR², y X¹, X³ y X⁴ son cada uno independientemente CR³; R² es C(=Z)NR⁶R⁷, N(R⁸)C(=Z)R⁹, C(=NR¹⁰)R¹¹ o Qᵃ;

cada Z es independientemente O o S;

35 cada R³ es independientemente H, halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ o haloalcoxi C₁-C₄;

Y² es CR⁵ᵃ;

R⁵ᵃ es H, halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ o haloalcoxi C₁-C₄;

R⁶ es H, NR¹⁵R¹⁶, OR¹⁷, C(=NR¹⁰)R¹¹, C(O)OR²¹, C(O)NR¹⁵R¹⁶, C(O)R²², S(O)_nR²³ o Q^b; o alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alqueno C₂-C₆ o alquino C₂-C₆, cada uno no sustituido o sustituido con al menos un R^x;

R⁷ es H, o Q^b; o alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alqueno C₂-C₆ o alquino C₂-C₆, cada uno no sustituido o sustituido con al menos un R^x; o

- 5 R⁶ y R⁷ se toman junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos para formar un anillo de 3 a 10 miembros que contienen miembros anulares seleccionados de átomos de carbono y hasta 2 heteroátomos seleccionados independientemente de un átomo de oxígeno, un átomo de azufre, y hasta 2 átomos de nitrógeno, en el que hasta 2 miembros anulares de átomo de carbono se seleccionan independientemente de C(=O) y C(=S) y el miembro anular de átomo de azufre se selecciona de S, S(O) o S(O)₂, estando dicho anillo no sustituido o sustituido con hasta 4 R^x;
- 10 o

R⁶ y R⁷ se toman juntos como =S(O)_pR¹⁸R¹⁹ o =S(=NR²⁰)R¹⁸R¹⁹;

Cada R^x es independientemente halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, cicloalcoxi C₃-C₆, C(=NR¹⁰)R¹¹, C(O)OR²¹, C(O)NR¹⁵R¹⁶, OC(O)R²², NR²⁵R²⁶, NR²⁴C(O)R²², C(O)R²², S(O)_nR²³, Si(R²⁸)₃, OSi(R²⁸)₃ o Q^b;

- 15 R⁸ es H, C(O)OR²¹, C(O)NR¹⁵R¹⁶, C(O)R²², S(O)_nR²³ o Q^b; o alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alqueno C₂-C₆ o alquino C₂-C₆, cada uno no sustituido o sustituido con al menos un R^x;

- R⁹ es H, C(=NR¹⁰)R¹¹, OR²¹ o NR¹⁵R¹⁶, o alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alqueno C₂-C₆ o alquino C₂-C₆, cada uno no sustituido o sustituido con al menos un R^x; o fenilo, fenoxi o un anillo aromático heterocíclico de 5 o 6 miembros, cada uno no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄; o un anillo no aromático heterocíclico de 3 a 6 miembros, conteniendo cada anillo miembros anulares seleccionados de átomos de carbono y hasta 3 heteroátomos independientemente seleccionados de un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y hasta 2 átomos de nitrógeno, en los que hasta 1 miembro anular átomo de carbono se selecciona independientemente de C(=O) y C(=S) y el miembro anular átomo de azufre se selecciona de S, S(O) o S(O)₂, estando cada anillo no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄;
- 20
- 25

cada R¹⁰ es independientemente OR¹², S(O)_nR¹³ o NHR¹⁴;

- 30 cada R¹¹ es independientemente H; o alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alqueno C₂-C₆ o alquino C₂-C₆, cada uno no sustituido o sustituido con al menos un R^x; o alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, cicloalcoxi C₃-C₆, C(O)OR²¹, C(O)NR¹⁵R¹⁶, NR²⁵R²⁶, NR²⁴C(O)R²², C(O)R²² o Q^b;

cada R¹² es independientemente alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, C(O)R²², S(O)_nR¹³ o Q^b;

cada R¹³ es independientemente alquilo C₁-C₄ o haloalquilo C₁-C₄;

- 35 R¹⁴ es alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, C(O)R²² o C(O)OR²¹; o fenilo, no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente seleccionado independientemente del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄;

- cada R¹⁵ es independientemente H, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₄, C(O)R²⁷ o S(O)₂R²⁷; o fenilo o un anillo aromático heterocíclico de 5 o 6 miembros, cada uno no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄;
- 40

cada R¹⁶ es independientemente H, alquilo C₁-C₆ o haloalquilo C₁-C₄; o

- R¹⁵ y R¹⁶ se toman junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos para formar un anillo de 3 a 7 miembros que contiene miembros anulares seleccionados de átomos de carbono y hasta 2 heteroátomos independientemente seleccionados de un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y hasta 2 átomos de nitrógeno, en el que hasta 2 miembros anulares átomo de carbono se seleccionan independientemente de C(=O) y C(=S) y el miembro anular átomo de azufre se selecciona de S, S(O) o S(O)₂, estando dicho anillo no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄;
- 45

- R¹⁷ es alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆ o haloalquilo C₁-C₄; o fenilo, no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄;
- 50

cada R¹⁸ es independientemente alquilo C₁-C₄ o haloalquilo C₁-C₄; o fenilo, no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄,

cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄;

cada R¹⁹ es independientemente alquilo C₁-C₄ o haloalquilo C₁-C₄; o fenilo, no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄; o

5 R¹⁸ y R¹⁹ se toman junto con el átomo de azufre al que están unidos para formar un anillo;

R²⁰ es H, ciano, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄ o C(O)R²²; o fenilo, no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄;

10 cada R²¹ es independientemente alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆ o halocicloalquilo C₃-C₆; o fenilo, no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄;

cada R²² es independientemente alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆ o halocicloalquilo C₃-C₆; o fenilo, no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄;

15 cada R²³ es independientemente alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, cicloalquilalquilo C₃-C₆ o halocicloalquilalquilo C₃-C₆; o fenilo, no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄;

cada R²⁴ es independientemente alquilo C₁-C₄;

20 cada R²⁵ es independientemente H, alquilo C₁-C₄ o haloalquilo C₁-C₄; o fenilo, no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄;

25 cada R²⁶ es independientemente alquilo C₁-C₄ o haloalquilo C₁-C₄; o fenilo, no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄; o

30 R²⁵ y R²⁶ se toman independientemente junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos para formar un anillo de 3 a 7 miembros que contiene miembros anulares seleccionados de átomos de carbono y hasta 2 heteroátomos independientemente seleccionados de un átomo de oxígeno, un átomo de azufre, y hasta 2 átomos de nitrógeno, en el que hasta 2 miembros anulares átomo de carbono se seleccionan independientemente de C(=O) y C(=S) y el miembro anular átomo de azufre se selecciona de S, S(O) o S(O)₂, estando dicho anillo no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄;

35 cada R²⁷ es independientemente alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆ o NR²⁹R³⁰; o fenilo o un anillo aromático heterocíclico de 5 a 6 miembros, cada uno no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄;

cada R²⁸ es independientemente alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆ o fenilo;

40 cada R²⁹ es independientemente H o Q^b; o alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alqueno C₂-C₆ o alquino C₂-C₆, cada uno no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄;

cada R³⁰ es independientemente H o Q^b; o alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alqueno C₂-C₆ o alquino C₂-C₆, cada uno no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄; o

45 R²⁹ y R³⁰ se toman junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos para formar un anillo de 3 a 10 miembros que contiene miembros anulares seleccionados de átomos de carbono y hasta 2 heteroátomos independientemente seleccionados de un átomo de oxígeno, un átomo de azufre, y hasta 2 átomos de nitrógeno, en el que hasta 2 miembros anulares átomo de carbono se seleccionan independientemente de C(=O) y C(=S) y el miembro anular átomo de azufre se selecciona de S, S(O) o S(O)₂, estando dicho anillo no sustituido o sustituido con hasta 4 sustituyentes independientemente seleccionados del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄;

50 Q^a es un anillo o sistema anular aromático de 5 a 10 miembros, conteniendo cada anillo o sistema anular miembros anulares seleccionados de átomos de carbono y hasta 3 heteroátomos independientemente seleccionados de un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y hasta 3 átomos de nitrógeno, en el que hasta 2 miembros anulares átomo

5 de carbono se seleccionan independientemente de C(=O) y C(=S) y el miembro anular átomo de azufre se selecciona de S, S(O) o S(O)₂, estando cada anillo o sistema anular no sustituido o sustituido con al menos un R^x; o un anillo parcialmente saturado de 3 a 6 miembros, conteniendo cada anillo miembros anulares seleccionados de átomos de carbono y hasta 2 heteroátomos independientemente seleccionados de un átomo de oxígeno, un átomo de azufre, y hasta 2 átomos de nitrógeno, en el que hasta 2 miembros anulares átomo de carbono se seleccionan independientemente de C(=O) y C(=S) y el miembro anular átomo de azufre se selecciona de S, S(O) o S(O)₂, cada anillo no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄;

10 cada Q^b es independientemente fenilo, un anillo aromático heterocíclico de 5 a 6 miembros o un anillo no aromático heterocíclico de 3 a 6 miembros, conteniendo cada anillo miembros anulares seleccionados de átomos de carbono y hasta 2 heteroátomos independientemente seleccionados de un átomo de oxígeno, un átomo de azufre, y hasta 2 átomos de nitrógeno, en el que hasta 2 miembros anulares átomo de carbono se seleccionan independientemente de C(=O) y C(=S) y el miembro anular átomo de azufre se selecciona de S, S(O) o S(O)₂, cada anillo no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄;

15 cada n es independientemente 0, 1 o 2; y

p es 1 o 2.

20 Esta invención también proporciona una composición que comprende un compuesto de Fórmula 1, un *N*-óxido o una sal del mismo, y al menos un componente adicional seleccionado del grupo que consiste en tensioactivos, diluyentes sólidos y diluyentes líquidos. En una realización, esta invención también proporciona una composición para controlar una plaga de invertebrados que comprende un compuesto de Fórmula 1, un *N*-óxido o una sal del mismo, y al menos un componente adicional seleccionado del grupo que consiste en tensioactivos, diluyentes sólidos y diluyentes líquidos, comprendiendo dicha composición adicionalmente además al menos un compuesto o agente biológicamente activo adicional.

25 También se describen composiciones de pulverización para controlar una plaga de invertebrados que comprenden un compuesto de Fórmula 1, un *N*-óxido o una sal del mismo, o las composiciones descritas anteriormente, y un propelente. También se describen composiciones cebo para controlar una plaga de invertebrados que comprende un compuesto de Fórmula 1, un *N*-óxido o una sal del mismo, o las composiciones descritas en las realizaciones anteriores, uno o más materiales alimenticios, opcionalmente un atrayente, y opcionalmente un humectante.

30 También se describen dispositivos trampa para controlar una plaga de invertebrados que comprenden dicha composición cebo y un alojamiento adaptado para recibir dicha composición cebo, en los que el alojamiento tiene al menos una abertura dimensionada para permitir que la plaga de invertebrados pase a través de la abertura de manera que la plaga de invertebrados tenga acceso a dicha composición cebo desde una posición externa al alojamiento, y en los que el alojamiento se adapta adicionalmente para situarse en o cerca de una ubicación de actividad potencial o conocida para la plaga de invertebrados.

35 Esta invención proporciona un método para controlar una plaga de invertebrados que comprende poner en contacto la plaga de invertebrados o su medio con una cantidad biológicamente efectiva de un compuesto de Fórmula 1, un *N*-óxido o una sal del mismo (p.ej., como una composición descrita en la presente memoria), con la condición de que el método no sea un método de tratamiento del cuerpo humano o animal mediante terapia. Esta invención también se refiere a dicho método en el que la plaga de invertebrados o su medio se ponen en contacto con una composición que comprende una cantidad biológicamente efectiva de un compuesto de fórmula 1, un *N*-óxido o una sal del mismo, y al menos un componente adicional seleccionado del grupo que consiste en tensioactivos, diluyentes sólidos y diluyentes líquidos, comprendiendo dicha composición opcionalmente además una cantidad biológicamente efectiva de al menos un compuesto o agente biológicamente activo adicional.

40 Esta invención también proporciona un método para proteger una semilla de una plaga de invertebrados que comprende poner en contacto la semilla con una cantidad biológicamente efectiva de un compuesto de Fórmula 1, un *N*-óxido o una sal del mismo, (p.ej., como una composición descrita en la presente memoria). Esta invención se refiere también a la semilla tratada. También se describen métodos para proteger un animal de una plaga parasitaria de invertebrados que comprende administrar al animal una cantidad parasitariamente efectiva de un compuesto de Fórmula 1, un *N*-óxido o una sal del mismo, (p.ej., como una composición descrita en la presente invención). Esta invención también proporciona un compuesto de Fórmula 1, un *N*-óxido o una sal del mismo (p.ej., como una composición descrita en la presente memoria) para usar en la protección de un animal de una plaga de invertebrados.

55 Esta invención también proporciona un método para aumentar el vigor de una planta cultivada que comprende poner en contacto la planta cultivada, la semilla a partir de la que se desarrolla la planta cultivada o la ubicación (p.ej., medio de crecimiento) de la planta cultivada con una cantidad biológicamente efectiva de un compuesto de Fórmula 1 (p.ej., como una composición descrita en la presente memoria).

Detalles de la invención

5 Como se usa en la presente memoria, los términos “comprende”, “que comprende”, “incluye”, “que incluye”, “tiene”, “que tiene”, “contiene”, “que contiene”, “caracterizado por” o cualquier otra variación de los mismos, tienen por objeto cubrir una inclusión no exclusiva, sujeta a cualquier limitación indicada explícitamente. Por ejemplo, una composición, mezcla, proceso o método que comprende una lista de elementos no está necesariamente limitado a solo esos elementos sino que pueden incluir otros elementos no enumerados expresamente o inherentes a dicha composición, mezcla, proceso o método.

10 La frase transicional “que consiste en” excluye cualquier elemento, etapa, o ingrediente no especificado. Si está en la reivindicación, cerraría la reivindicación a la inclusión de materiales distintos de los enumerados excepto por impurezas normalmente asociadas con eso. Cuando la frase “que consiste en” aparece en una oración del cuerpo de una reivindicación, en vez de inmediatamente después del preámbulo, limita solo al elemento descrito en esa oración; los demás elementos no se excluyen de la reivindicación como un todo.

15 La frase transicional “que consiste esencialmente en” se usa para definir una composición o método que incluye materiales, etapas, características, componentes o elementos, además de los descritos literalmente, con tal que estos materiales, etapas, características, componentes o elementos adicionales no afecten materialmente a la(s) característica(s) básica(s) y nueva(s) de la invención reivindicada. El término “que consiste esencialmente en” ocupa un nivel medio entre “que comprende” y “que consiste en”.

20 Donde los solicitantes han definido una invención o una parte de la misma con un término de final abierto tal como “que comprende”, debería entenderse fácilmente que (a menos que se indique otra cosa) la descripción debería interpretarse como que describe además dicha invención usando los términos “que consiste esencialmente en” o “que consiste en”.

25 Además, a menos que se indique expresamente lo contrario, “o” se refiere a un o inclusivo y no a un o exclusivo. Por ejemplo, una condición A o B se satisface por cualquiera de lo siguiente: A es cierto (o está presente) y B es falso (o no está presente), A es falso (o no está presente) y B es cierto (o está presente), y tanto A como B son ciertos (o están presentes).

Además, los artículos indefinidos “un” y “una” que preceden a un elemento o componente de la invención tienen por objeto no ser restrictivos con respecto al número de ejemplos (es decir, ocurrencias) del elemento o componente. Por lo tanto “un” o “una” debería leerse como que incluye uno o al menos uno, y la palabra singular del elemento o componente también incluye el plural a menos que el número signifique obviamente que es singular.

30 Como se menciona en esta descripción, el término “plaga de invertebrados” incluye artrópodos, gasterópodos, nematodos y helmintos de importancia económica como plagas. El término “artrópodo” incluye insectos, ácaros, arañas, escorpiones, ciempiés, milpiés, cochinillas y sínfilos. El término “gasterópodo” incluye caracoles, babosas y otros Stylommatophora. El término “nematodo” incluye miembros del filo Nematoda, tal como nematodos fitófagos y nematodos helmintos que parasitan animales. El término “helminto” incluye todos los gusanos parasitarios, tales como ascárides (filo Nematoda), gusanos del corazón (filo Nematoda, clase Secernentea), trematodos (filo Platyhelminthes, clase Tematoda), acantocéfalos (filo Acanthocephala) y cestodos (filo Platyhelminthes, clase Cestoda).

40 En el contexto de esta descripción “control de plaga de invertebrados” significa inhibición del desarrollo de la plaga de invertebrados (que incluye mortalidad, reducción de alimentación, y/o interrupción del apareamiento), y las expresiones relacionadas se definen de forma análoga.

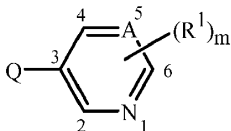
45 El término “agronómico” se refiere a la producción de cultivos extensivos tales como para alimento y fibra e incluyen el crecimiento de maíz, sojas y otras legumbres, arroz, cereal (p.ej., trigo, avenas, cebada, centeno y arroz), hortalizas de hoja (p.ej. lechuga, col, y otros cultivos de col), hortalizas de fruto (p.ej., tomates, pimiento, berenjena, crucíferas y cucurbitáceas), patatas, batatas, uvas, algodón, frutas de árbol (p.ej., pomos, con hueso y cítricos), frutos pequeños (p.ej. bayas y cerezas) y otros cultivos especiales (p.ej., colza, girasol y olivas).

50 El término “no agronómico” se refiere a cultivos distintos de cultivos extensivos, tales como cultivos hortícolas (p.ej., invernadero, cultivos de cobertura o plantas ornamentales que no crecen en un campo), estructuras residenciales, agrícolas, comerciales e industriales, césped (p.ej., granjas de césped, pasto, campo de golf, césped, campo deportivo, etc.), productos de madera, productos almacenados, gestión agroforestal y de vegetación, aplicaciones de salud pública (es decir, humanos) y salud animal (p.ej., animales domésticos tales como mascotas, ganado y volatería, animales no domesticados tales como animales salvajes).

55 El término “vigor del cultivo” se refiere a la velocidad de crecimiento o acumulación de biomasa de una planta cultivada. Un “aumento en el vigor” se refiere a un aumento en el crecimiento o acumulación de biomasa en una planta cultivada respecto a una planta cultivada de control no tratada. El término “rendimiento del cultivo” se refiere al rendimiento del material de cultivo, en términos tanto de cantidad como de calidad, obtenido después de la cosecha de una planta cultivada. Un “aumento en el rendimiento del cultivo” se refiere a un aumento en el rendimiento del cultivo respecto a una planta cultivada de control no tratada.

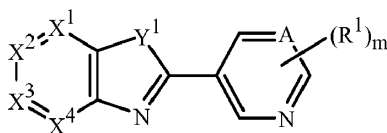
El término “cantidad biológicamente efectiva” se refiere a la cantidad de un compuesto biológicamente activo (p.ej., un compuesto de Fórmula 1) suficiente para producir el efecto biológico deseado cuando se aplica a (es decir, se pone en contacto con) una plaga de invertebrados a controlar o su medio, o a una planta, la semilla de la que crece la planta, o la ubicación de la planta (p.ej., medio de crecimiento) para proteger la planta del daño de la plaga de invertebrados o para otro efecto deseado (p.ej., aumento del vigor de la planta).

La posición de la variable R¹ en la estructura de Fórmula 1 se describe en el sistema de numeración mostrado a continuación.



1

Una línea ondulada en un fragmento de la estructura indica el punto de unión del fragmento al resto de la molécula. Por ejemplo, cuando la variable Q en la Fórmula 1 se define como Q-1 (no reivindicado), la línea ondulada que cruza el enlace en Q-1 significa que Q-1 está unido al resto de la estructura de Fórmula 1 en dicha posición, como se muestra a continuación.



En la estructura Q-2, las variables X¹, X², X³ y X⁴ se definen como se muestra en la tabla posterior.

Combinación	X ¹	X ²	X ³	X ⁴
1	CR ²	CR ³	CR ³	CR ³
5	CR ³	CR ²	CR ³	CR ³

En las enumeraciones anteriores, el término “alquilo”, usado o bien solo o en palabras compuestas tales como “alquiltio” o “haloalquilo” incluye alquilo de cadena lineal o ramificada, tal como metilo, etilo, *n*-propilo, *i*-propilo, o los diferentes isómeros de butilo, pentilo o hexilo. “Alquenilo” incluye alquenos de cadena lineal o ramificada tales como etenilo, 1-propenilo, 2-propenilo, y los diferentes isómeros de butenilo, pentenilo y hexenilo. “Alquinilo” también incluye polienos tales como 1,2-propadienilo y 2,4-hexadienilo. “Alquino” incluye alquinos de cadena lineal o ramificada tales como etinilo, 1-propinilo, 2-propinilo, y los diferentes isómeros de butinilo, pentinilo y hexinilo. “Alquino” puede incluir también restos comprendido por múltiples enlaces triples tales como 2,5-hexadiinilo.

“Alcoxi” incluye, por ejemplo, metoxi, etoxi, *n*-propiloxi, isopropiloxi y los diferentes isómeros de butoxi, pentoxi y hexiloxi. “Alquiltio” incluye restos alquiltio de cadena lineal o ramificada tales como metiltio, etiltio y los diferentes isómeros de propiltio, butiltio, pentiltio y hexiltio.

“Cicloalquilo” incluye, por ejemplo, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo y ciclohexilo.

El término “halógeno”, o bien solo o en palabras compuestas tal como “haloalquilo”, o cuando se usa en descripciones tales como “alquilo sustituido con halógeno” incluye flúor, cloro, bromo o yodo. Además, cuando se usa en palabras compuestas tales como “haloalquilo”, o cuando se usa en descripciones tales como “alquilo sustituido con halógeno” dicho alquilo puede estar parcialmente o totalmente sustituido con átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes. Ejemplos de “haloalquilo” o “alquilo sustituido con halógeno” incluyen F₃C-, C₁CH₂-, CF₃CH₂- y CF₃CCl₂-. Los términos “halocicloalquilo”, “haloalcoxi”, “haloalquiltio”, “haloalquenilo”, “haloalquinilo”, y similares, se definen de forma análoga al término “haloalquilo”. Ejemplos de “haloalcoxi” incluyen CF₃O-, CCl₃CH₂O-, HCF₂CH₂CH₂O- y CF₃CH₂O-. Ejemplos de “haloalquiltio” incluyen CCl₃S-, CF₃S-, CCl₃CH₂S- y ClCH₂CH₂CH₂S-.

Las abreviaturas químicas S(O) y S(=O) como se usan en la presente memoria representan un resto sulfínico. Las abreviaturas químicas SO₂, S(O)₂ y S(=O)₂ como se usan en la presente memoria representan un resto sulfónico. Las abreviaturas químicas C(O) y C(=O) como se usan en la presente memoria representan un resto carbonilo. Las abreviaturas químicas CO₂, C(O)O y C(=O)O como se usan en la presente memoria representan un resto oxicarbonilo. “CHO” significa formilo.

El número total de átomos de carbono en un grupo sustituyente se indica por el prefijo “C_i-C_j” donde i y j son números de 1 a 6. Por ejemplo, alquil C₁-C₄ sulfonilo designa metilsulfonilo a butilsulfonilo; alcoialquilo C₂ designa CH₃OCH₂-; alcoialquilo C₃ designa, por ejemplo, CH₃CH(OCH₃)-, CH₃OCH₂CH₂- o CH₃CH₂OCH₂-; y alcoialquilo C₄ designa los diversos isómeros de un grupo alquilo sustituido con un grupo alcoxi que contiene un total de cuatro

átomos de carbono, incluyendo los ejemplos $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2^-$ y $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2^-$.

5 Cuando un compuesto se sustituye con un sustituyente que porta un subíndice que indica que el número de dichos sustituyentes puede exceder 1, dichos sustituyentes (cuando exceden 1) se seleccionan independientemente del grupo de sustituyentes definidos, p.ej., $(\text{R}^1)_m$, m es 0, 1, 2 o 3. Además, cuando el subíndice indica un intervalo, p.ej. $(\text{R})_{i,j}$, entonces el número de sustituyentes puede seleccionarse de los números enteros entre i y j inclusive. Cuando un grupo contiene un sustituyente que puede ser hidrógeno, por ejemplo R^3 o R^4 , entonces cuando este sustituyente se toma como hidrógeno, se reconoce que este es equivalente a dicho grupo que no se sustituye. Cuando se muestra que un grupo variable está opcionalmente unido a una posición, por ejemplo $(\text{R}^1)_m$ en el que m puede ser 0, el hidrógeno puede estar en la posición incluso si no se enumera en la definición del grupo variable. Cuando una o más posiciones en un grupo se dice que "no están sustituidas" o son "no sustituidas", entonces los átomos de hidrógeno se unen para ocupar cualquier valencia libre.

10 A menos que se indique otra cosa, un "anillo" o "sistema anular" como un componente de Fórmula 1 (p.ej., sustituyente Q^a) es carbocíclico o heterocíclico. El término "sistema anular" indica dos o más anillos condensados. Los términos "sistema anular bicíclico" y "sistema anular bicíclico condensado" indican un sistema anular que consiste en dos anillos condensados, que pueden ser "orto-condensados", "bicíclicos con puente" o "espirobicíclicos". Un "sistema anular bicíclico orto-condensado" indica un sistema anular en el que los dos anillos constituyentes tienen dos átomos adyacentes en común. Un "sistema anular bicíclico con puente" se forma uniendo un segmento de uno o más átomos a miembros anulares no adyacentes de un anillo. Un "sistema anular espirobicíclico" está formado uniendo un segmento de dos o más átomos al mismo miembro anular de un anillo. El término "sistema anular heterobicíclico condensado" indica un sistema anular bicíclico condensado en que al menos un átomo anular no es carbono. El término "miembro anular" se refiere a un átomo u otro resto (p.ej., $\text{C}(\text{=O})$, $\text{C}(\text{=S})$, $\text{S}(\text{O})$ o $\text{S}(\text{O})_2$) que forma el esqueleto de un anillo o sistema anular.

15 Los términos "anillo carbocíclico", "carbociclo" o "sistema anular carbocíclico" indican un anillo o sistema anular en el que los átomos que forman el esqueleto anular se seleccionan solo de carbono. Los términos "anillo heterocíclico", "heterociclo" o "sistema anular heterocíclico" indican un anillo o sistema anular en que al menos un átomo que forma el esqueleto anular no es carbono, p.ej., nitrógeno, oxígeno o azufre. Típicamente un anillo heterocíclico contiene no más de 4 nitrógenos, no más de 2 oxígenos y no más de 2 azufres. A menos que se indique otra cosa, un anillo carbocíclico o anillo heterocíclico puede ser un anillo saturado o insaturado. "Saturado" se refiere a un anillo que tiene un esqueleto que consiste en átomos unidos los unos a los otros por enlaces sencillos; a menos que se especifique otra cosa, las valencias de los átomos restantes están ocupadas por átomos de hidrógeno. A menos que se afirme otra cosa, un "anillo insaturado" puede estar parcialmente insaturado o totalmente insaturado. La expresión "anillo totalmente insaturado" significa un anillo de átomos en que los enlaces entre átomos en el anillo son enlaces sencillos o dobles según la teoría de enlaces de valencia y además los enlaces entre átomos en el anillo incluyen tantos dobles enlaces como sea posible sin ser dobles enlaces acumulativos (es decir, no $\text{C}=\text{C}=\text{C}$ o $\text{C}=\text{C}=\text{N}$). El término "anillo parcialmente insaturado" indica un anillo que comprende al menos un miembro anular unido a un miembro anular adyacente a través de un doble enlace y que conceptualmente acomoda potencialmente un número de dobles enlaces no acumulados entre miembros anulares adyacentes (es decir, en su forma complementaria totalmente insaturada) mayor que el número de dobles enlaces presentes (es decir en su forma parcialmente insaturada).

20 A menos que se indique otra cosa, los anillos y sistemas anulares heterocíclicos pueden unirse a través de un carbono o nitrógeno disponible por sustitución de un hidrógeno en dicho carbono o nitrógeno.

25 "Aromático" indica que cada uno de los átomos anulares está esencialmente en el mismo plano y tiene un orbital p perpendicular al plano del anillo, y en que $(4n+2)\pi$ electrones, donde n es un número entero positivo, están asociados con el anillo para cumplir la regla de Hückel. El término "sistema anular aromático" indica un sistema anular carbocíclico o heterocíclico en que al menos un anillo del sistema anular es aromático. Cuando un anillo carbocíclico totalmente insaturado satisface la regla de Hückel, entonces dicho anillo se denomina también un "anillo aromático" o "anillo carbocíclico aromático". El término "sistema anular carbocíclico aromático" indica un sistema anular carbocíclico en que al menos un anillo del sistema anular es aromático. Cuando un anillo heterocíclico totalmente insaturado satisface la regla Hückel, entonces dicho anillo también se denomina un "anillo heteroaromático", "anillo heterocíclico aromático" o "anillo aromático heterocíclico". El término "sistema anular heterocíclico aromático" indica un sistema anular heterocíclico en que al menos un anillo del sistema anular es aromático. El término "sistema anular no aromático" indica un sistema anular carbocíclico o heterocíclico que puede estar totalmente saturado, además de parcialmente o totalmente insaturado, con tal que ninguno de los anillos en el sistema anular sea aromático. El término "sistema anular carbocíclico no aromático" indica un anillo carbocíclico en que ningún anillo en el sistema anular es aromático. El término "sistema anular heterocíclico no aromático" indica un sistema anular heterocíclico en que ningún anillo en el sistema anular es aromático.

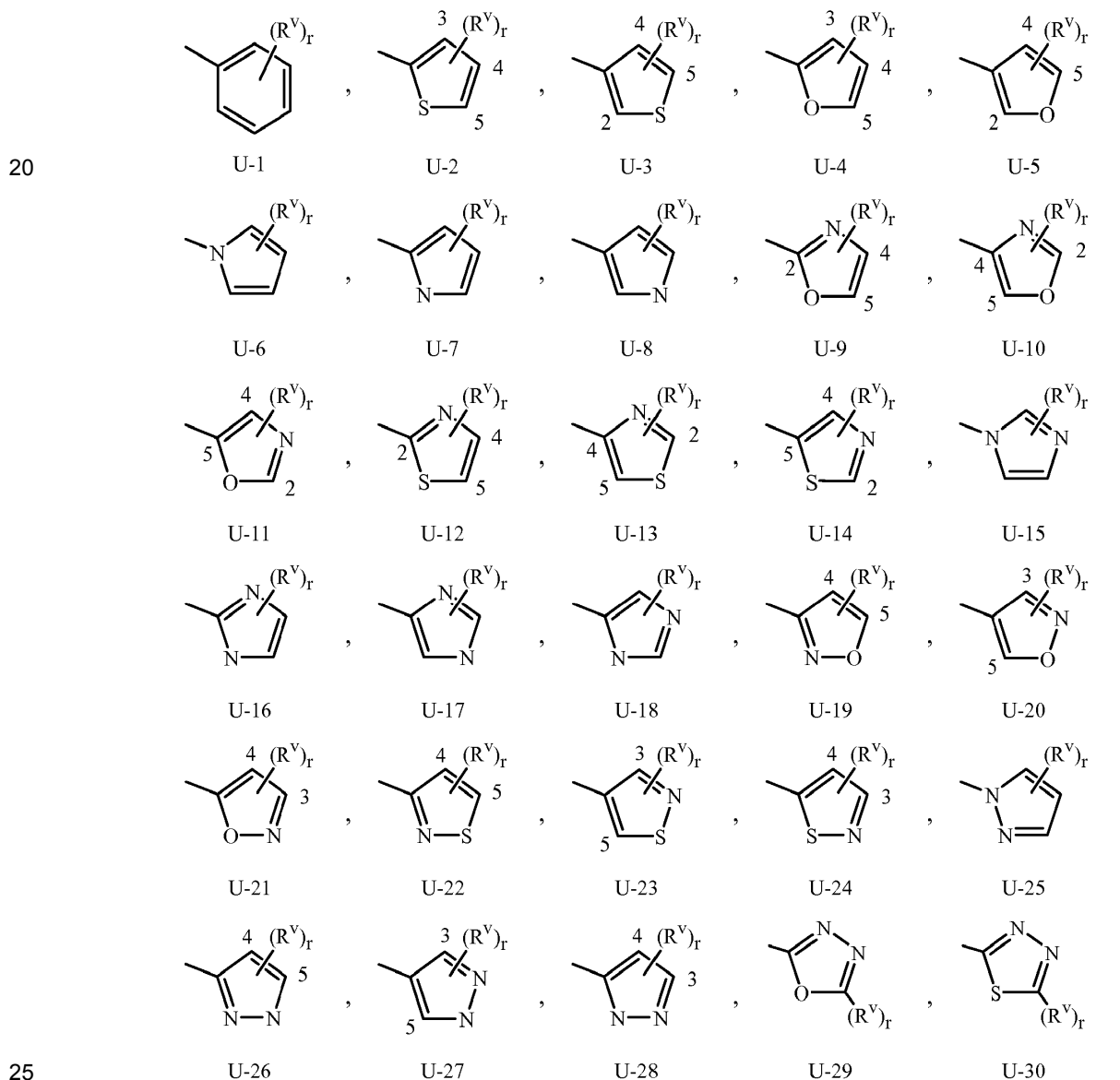
30 El término "opcionalmente sustituido" en conexión con los anillos heterocíclicos se refiere a grupos que no están sustituidos o tienen al menos un sustituyente que no es hidrógeno que no extingue la actividad biológica poseída por el análogo no sustituido. Como se usa en la presente memoria, las siguientes definiciones se aplicarán a menos que se indique otra cosa. El término "opcionalmente sustituido" se usa de forma intercambiable con la frase "sustituido o no sustituido" o con el término "(no) sustituido". A menos que se indique otra cosa, un grupo opcionalmente

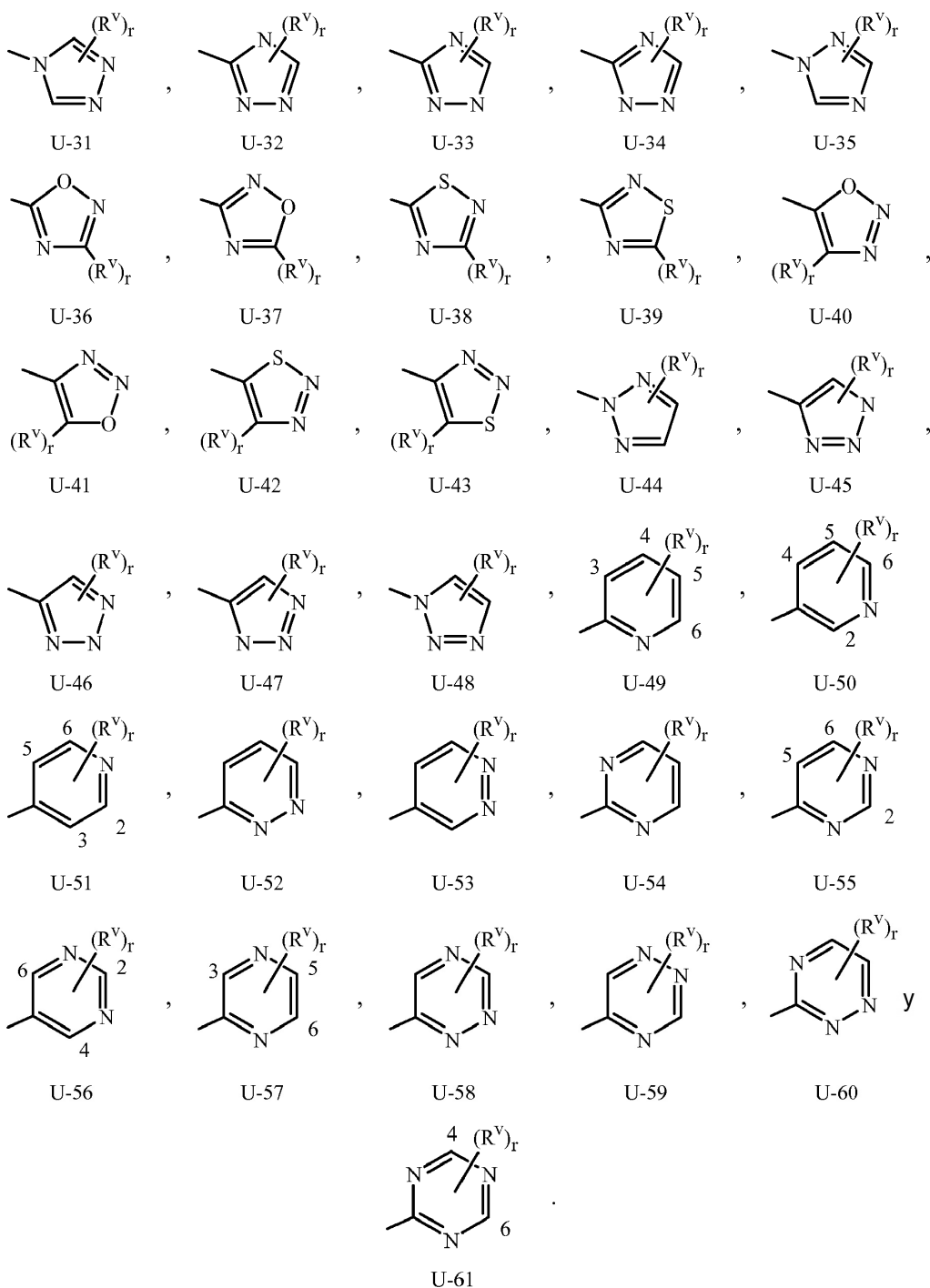
sustituido puede tener un sustituyente en cada posición sustituible del grupo, y cada sustitución es independiente de la otra.

5 Cuando un sustituyente es un anillo heterocíclico que contiene nitrógeno de 5 o 6 miembros, puede estar unido al resto de la Fórmula 1 a través de cualquier átomo anular de carbono o nitrógeno disponible, a menos que se describa otra cosa. Como se anota anteriormente, Q^a puede ser (entre otros) fenilo opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de un grupo de sustituyentes como se define en el Compendio de la invención. Un ejemplo de fenilo opcionalmente sustituido con uno a cinco sustituyentes es el anillo ilustrado como U-1 en la Exhibición 1, en el que R^v es R^x como se define en el Compendio de la invención para Q^a y r es un número entero de 0 a 5.

10 Como se anota anteriormente, Q^b puede ser (entre otros) un anillo aromático heterocíclico de 5 o 6 miembros, opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de un grupo de sustituyentes como se define en el Compendio de la invención. Ejemplos de un anillo heterocíclico aromático insaturado de 5 o 6 miembros opcionalmente sustituidos con de uno o más sustituyentes incluyen los anillos U-2 a U-61 ilustrados en la Exhibición 1 en los que R^v es cualquier sustituyente como se define en el Compendio de la invención para Q^b y r es un número entero de 0 a 4, limitado por el número de posiciones disponibles en cada grupo U. Como U-29, U-30, U-36, U-37, U-38, U-39, U-40, U-41, U-42 y U-43 tienen solo una posición disponible, para estos grupos U r está limitado a los números enteros 0 o 1, y r que es 0 significa que el grupo U no está sustituido y un hidrógeno está presente en la posición indicada por $(R^v)_r$.

Exhibición 1



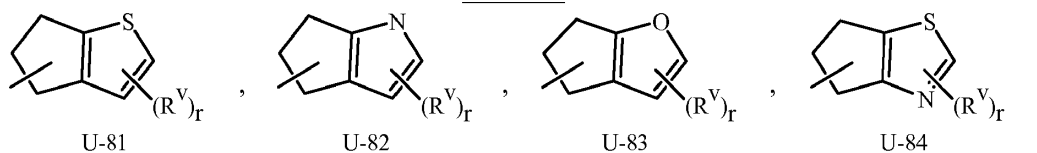


5

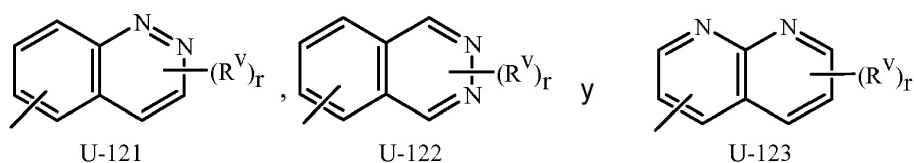
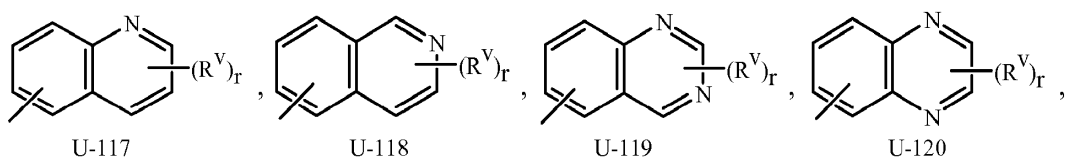
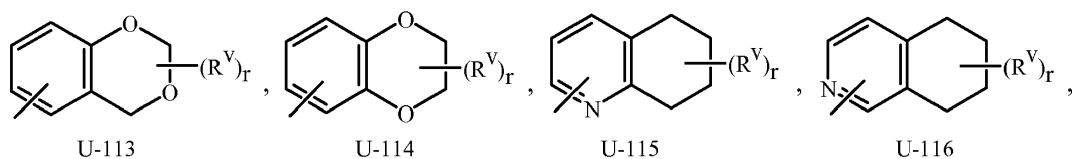
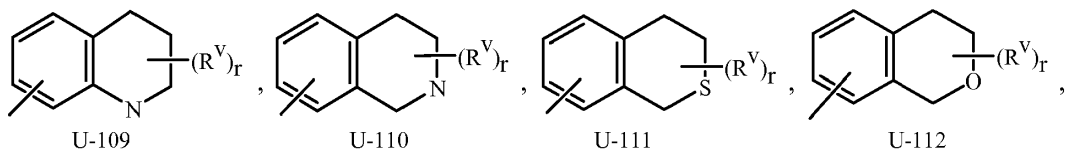
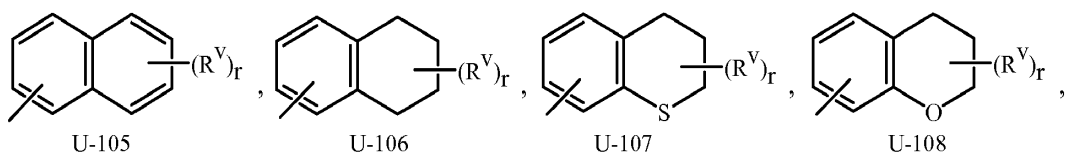
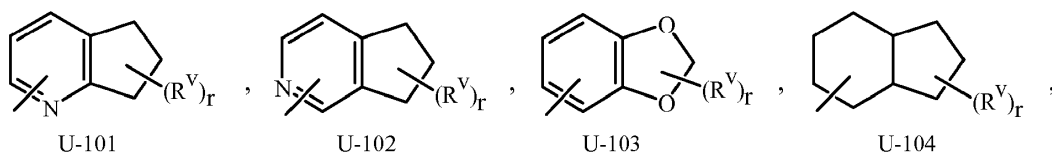
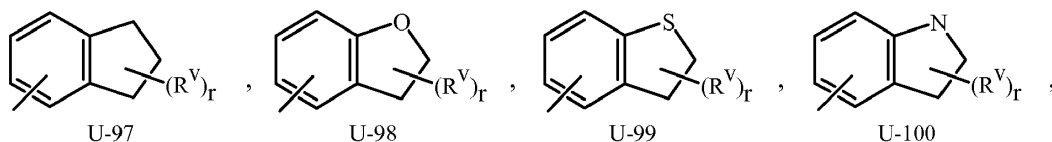
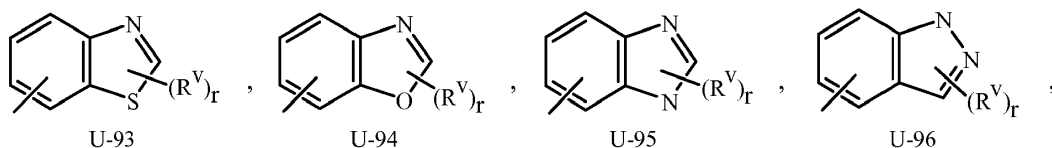
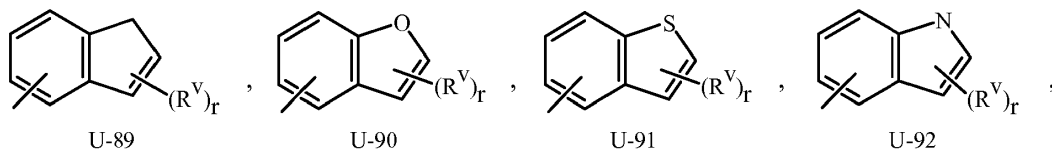
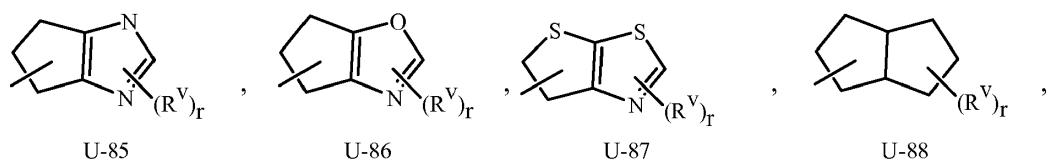
10

Como se anota anteriormente, Q^a puede ser (entre otros) un sistema anular bicíclico orto-condensado de 8, 9 o 10 miembros opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de un grupo de sustituyentes como se define en el Compendio de la invención. Ejemplos del sistema anular bicíclico orto-condensado de 8, 9 o 10 miembros opcionalmente sustituido con de uno o más sustituyentes incluyen los anillos U-81 a U-123 ilustrados en la Exhibición 3 en los que R^v es cualquier sustituyente como se define en el Compendio de la invención para Q^a, y r es típicamente un número entero de 0 a 4.

Exhibición 3



15



Aunque los grupos R^v se muestran en las estructuras U-1 a U-123, se nota que no necesitan estar presentes ya que son sustituyentes opcionales. Notar que cuando R^v es H cuando se une a un átomo, éste es el mismo que si dicho átomo está no sustituido. Los átomos de nitrógeno que necesitan sustitución para llenar su valencia están sustituidos con H o R^v . Notar que cuando el punto de unión entre $(R^v)_r$ y el grupo U se ilustra como flotante, $(R^v)_r$ puede estar unido a cualquier átomo de carbono o átomo de nitrógeno disponible del grupo U. Notar que cuando el punto de

unión en el grupo U se ilustra como flotante, el grupo U puede estar unido al resto de Fórmula 1 a través de cualquier carbono o nitrógeno disponible del grupo U por sustitución de un átomo de hidrógeno. Notar que algunos grupos U pueden sustituirse solo con menos de 4 grupos R' (p.ej., U-2 a U-5, U-7 a U-48, y U-52 a U-61).

5 Una amplia variedad de métodos sintéticos se conocen en la técnica que permiten la preparación de anillos y sistemas anulares heterocíclicos aromáticos y no aromáticos; para revisiones extensas véase el conjunto de ocho volúmenes de Comprehensive Heterocyclic Chemistry, A.R. Katritzky y C.W. Rees editores jefe, Pergamon Press, Oxford, 1984 y el conjunto de doce volúmenes de Comprehensive Heterocyclic Chemistry II, A.R. Katritzky, C.W. Rees y E.F.V. Scriven editores jefe, Pergamon Press, Oxford, 1996.

10 Los compuestos de esta invención pueden existir como uno o más estereoisómeros. Los estereoisómeros son isómeros de idéntica constitución pero que difieren en la disposición de sus átomos en el espacio e incluyen enantiómeros, diastereómeros, isómeros cis-trans (también conocidos como isómeros geométricos) y atropisómeros. Los atropisómeros resultan de la rotación restringida alrededor de enlaces sencillos donde la barrera rotacional es suficientemente alta para permitir el aislamiento de las especies isoméricas. Un experto en la técnica apreciará que un estereoisómero puede ser más activo y/o puede mostrar efectos beneficiosos cuando está enriquecido respecto al (a los) otro(s) estereoisómero(s) o cuando se separa del (de los) otro(s) estereoisómero(s). Adicionalmente, el experto sabe cómo separar, enriquecer y/o preparar selectivamente dichos estereoisómeros. Para una amplia discusión de todos los aspectos de la estereoisomería, véase Ernest L. Eliel y Samuel H. Wilen, Stereochemistry of Organic Compounds, John Wiley & Sons, 1994.

20 Esta invención comprende todos los estereoisómeros, isómeros conformacionales y mezclas de los mismos en todas las proporciones además de formas isotópicas tales como compuestos deuterados.

25 Un experto en la técnica apreciará que no todos los heterociclos que contienen nitrógeno pueden formar *N*-óxidos ya que el nitrógeno necesita un único par disponible para la oxidación al óxido; un experto en la técnica reconocerá los heterociclos que contienen nitrógeno que pueden formar *N*-óxidos. Un experto en la técnica reconocerá también que las aminas terciarias pueden formar *N*-óxidos. Los métodos sintéticos para la preparación de *N*-óxidos de heterociclos y aminas terciarias se conocen muy bien por un experto en la técnica incluyendo la oxidación de heterociclos y aminas terciarias con peroxiácidos tales como ácido peracético y 3-cloroperbenzoico (MCPBA), peróxido de hidrógeno, alquilhidroperóxidos tales como *t*-butil-hidroperóxido, perborato sódico y dioxiranos tales como dimetildioxirano. Estos métodos para la preparación de *N*-óxidos se han descrito y revisado de forma extensa en la bibliografía, véase por ejemplo: T.L. Gilchrist en Comprehensive Organic Synthesis, vol. 7, págs. 748-750, S.V. Ley, Ed., Pergamon Press; M. Tisler y B. Stanovnik en Comprehensive Heterocyclic Chemistry, vol. 3, págs. 18-20, A.J. Boulton y A. McKillop, Eds., Pergamon Press, M.R. Grimmett y B.R.T. Keene en Advances in Heterocyclic Chemistry, vol. 43, págs. 149-161, A.R. Katritzky, Ed., Academic Press; M. Tisler y B. Stanovnik en Advances in Heterocyclic Chemistry, vol. 9, págs. 285-291, A.R. Katritzky y A.J. Boulton, Eds., Academic Press; y G.W.H. Cheeseman y E.S.G. Werstiuk en Advances in Heterocyclic Chemistry, vol. 22, págs. 390-392, A.R. Katritzky y A.J. Boulton, Eds., Academic Press.

40 Un experto en la técnica reconoce que debido a que en el medio y bajo condiciones fisiológicas las sales de compuestos químicos están en equilibrio con sus formas no salinas correspondientes, las sales comparten la utilidad biológica de las formas no salinas. Por consiguiente una amplia variedad de sales de los compuestos de Fórmula 1 son útiles para controlar las plagas de invertebrados. Las sales de los compuestos de Fórmula 1 incluyen sales de adición de ácidos con ácidos inorgánicos u orgánicos tales como ácidos bromhídrico, clorhídrico, nítrico, fosfórico, sulfúrico, acético, butírico, fumárico, láctico, maleico, malónico, oxálico, propiónico, salicílico, tartárico, 4-toluensulfónico o valérico. Cuando un compuesto de Fórmula 1 contiene un resto ácido tal como un ácido carboxílico o fenol, las sales también incluyen las formadas con bases orgánicas o inorgánicas tales como piridina, trietilamina o amoniaco, o amidas, hidruros, hidróxidos o carbonatos de sodio, potasio, litio, calcio, magnesio o bario. Por consiguiente, la presente invención comprende compuestos seleccionados de Fórmula 1, *N*-óxidos y sales adecuadas de los mismos.

50 Los compuestos seleccionados de la Fórmula 1, estereoisómeros, tautómeros, *N*-óxidos, y sales de los mismos, existen típicamente en más de una forma, y la Fórmula 1 incluye por consiguiente todas las formas cristalinas y no cristalinas de los compuestos que representa la Fórmula 1. Las formas no cristalinas incluyen realizaciones que son sólidas tales como ceras y gomas además de realizaciones que son líquidas tales como disoluciones y fundidos. Las formas cristalinas incluyen realizaciones que representan esencialmente un único tipo de cristal y las realizaciones que representan una mezcla de polimorfos (es decir, diferentes tipos cristalinos). El término "polimorfo" se refiere a una forma cristalina particular de un compuesto químico que puede cristalizar en diferentes formas cristalinas, teniendo estas formas diferentes disposiciones y/o conformaciones de las moléculas en el entramado cristalino. Aunque los polimorfos pueden tener la misma composición química, pueden diferir también en la composición debido a la presencia o ausencia de agua co-cristalizada u otras moléculas, que pueden estar unidas de forma débil o fuerte en el entramado. Los polimorfos pueden diferir en dichas propiedades químicas, físicas y biológicas como la forma cristalina, densidad, dureza, color, estabilidad química, punto de fusión, higroscopicidad, suspensibilidad, velocidad de disolución y disponibilidad biológica. Un experto en la técnica apreciará que un polimorfo de un compuesto representado por la Fórmula 1 puede mostrar efectos beneficiosos (p.ej., idoneidad para la preparación de formulaciones útiles, rendimiento biológico mejorado) respecto a otro polimorfo o una mezcla de polimorfos del

- mismo compuesto representado por la Fórmula 1. La preparación y aislamiento de un polimorfo particular de un compuesto representado por la Fórmula 1 puede conseguirse por métodos conocidos por los expertos en la técnica, que incluyen, por ejemplo, cristalización usando disolventes y temperaturas seleccionadas. Los compuestos de esta invención pueden existir como uno o más polimorfos cristalinos. Esta invención comprende tanto polimorfos individuales como mezclas de polimorfos, que incluyen mezclas enriquecidas en un polimorfo respecto a los otros. Para una amplia discusión de polimorfismo, véase R. Hilfiker, Ed., Polymorphism in the Pharmaceutical Industry, Wiley-VCH, Weinheim, 2006.
- Las realizaciones de la presente invención como se describen en el Compendio de la invención incluyen las descritas a continuación. En las siguientes realizaciones, la referencia a "un compuesto de Fórmula 1" incluye las definiciones de sustituyentes especificados en el Compendio de la invención a menos que se definan más en las realizaciones.
- Realización 10. Un compuesto de Fórmula 1 en el que A es CH, CR¹ o N, y R¹ es halógeno.
- Realización 11. Un compuesto de la realización 10 en el que A es CH, CF o N.
- Realización 11a. Un compuesto de la realización 10 en el que A es CF o N.
- Realización 12. Un compuesto de la realización 10 en el que A es CH o CF.
- Realización 13. Un compuesto de la realización 10 en el que A es CH.
- Realización 14. Un compuesto de la realización 10 en el que A es N.
- Realización 15. Un compuesto de Fórmula 1 en el que m es 1, y R¹ es alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ o halógeno.
- Realización 16. Un compuesto de la realización 15 en el que R¹ es CF₃, OMe, Me o F.
- Realización 17. Un compuesto de la realización 16 en el que R¹ es CF₃, OMe, Me o F, y está en la posición 4.
- Realización 18. Un compuesto de la realización 17 en el que R¹ es CF₃, y está en la posición 4.
- Realización 19. Un compuesto de Fórmula 1 en el que m es 0.
- Realización 21. Un compuesto de Fórmula 1 o cualquiera de las realizaciones 10-19 en el que X¹ es CR², y X², X³ y X⁴ son cada uno independientemente CR³.
- Realización 22. Un compuesto de Fórmula 1 o cualquiera de las realizaciones 10-19 en el que X² es CR², y X¹, X³ y X⁴ son cada uno independientemente CR³.
- Realización 23. Un compuesto de Fórmula 1 o cualquiera de las realizaciones 10-22 en el que cada R³ es independientemente H o halógeno.
- Realización 24. Un compuesto de la realización 23 en el que cada R³ es independientemente H o F.
- Realización 25. Un compuesto de la realización 24 en el que cada R³ es H.
- Realización 26. Un compuesto de Fórmula 1 o cualquiera de las realizaciones 10-25 en el que R² es C(=Z)NR⁶R⁷, C(=NR¹⁰)R¹¹ o Q^a.
- Realización 27. Un compuesto de Fórmula 1 o cualquiera de las realizaciones 10-25 en el que R² es C(=NR¹⁰)R¹¹.
- Realización 28. Un compuesto de Fórmula 1 o cualquiera de las realizaciones 10-25 en el que R² es C(=NR¹⁰)R¹¹; R¹⁰ es alcoxi C₁-C₄; y R¹¹ es alquilo C₁-C₄ sustituido con S(O)_nR²³.
- Realización 29. Un compuesto de Fórmula 1 o cualquiera de las realizaciones 10-25 en el que R² es C(=Z)NR⁶R⁷ o Q^a.
- Realización 30. Un compuesto de Fórmula 1 o cualquiera de las realizaciones 10-25 en el que R² es C(=Z)NR⁶R⁷.
- Realización 31. Un compuesto de Fórmula 1 o cualquiera de las realizaciones 10-25 en el que R² es C(=O)NR⁶R⁷.
- Realización 32. Un compuesto de Fórmula 1 o cualquiera de las realizaciones 10-25 en el que R² es C(=S)NR⁶R⁷.
- Realización 33. Un compuesto de Fórmula 1 o cualquiera de las realizaciones 10-25 en el que R² es C(=O)NR⁶R⁷; y R⁶ es H, C(O)OR²¹, C(O)R²² o alquilo C₁-C₆.
- Realización 35. Un compuesto de Fórmula 1 o cualquiera de las realizaciones 10-25 en el que R² es C(=O)NR⁶R⁷; y R⁶ es H, C(O)OMe, C(O)Me o metilo.

Realización 36. Un compuesto de Fórmula 1 o cualquiera de las realizaciones 10-25 en el que R^2 es $C(=O)NR^6R^7$; y R^6 es H.

Realización 36a. Un compuesto de Fórmula 1 o cualquiera de las realizaciones 10-25 en el que R^2 es $C(=O)NR^6R^7$; y R^6 es $C(O)OMe$.

- 5 Realización 36b. Un compuesto de Fórmula 1 o cualquiera de las realizaciones 10-25 en el que R^2 es $C(=O)NR^6R^7$; y R^6 es $C(O)Me$.

Realización 36c. Un compuesto de Fórmula 1 o cualquiera de las realizaciones 10-25 en el que R^2 es $C(=O)NR^6R^7$; y R^6 es metilo.

Realización 37. Un compuesto de Fórmula 1 o cualquiera de las realizaciones 10-25 en el que R^2 es Q^a .

- 10 Realización 38. Un compuesto de Fórmula 1 o cualquiera de las realizaciones 10-25 en el que R^2 es Q^a ; y Q^a es un anillo aromático de 5 o 6 miembros, conteniendo cada anillo miembros anulares seleccionados de átomos de carbono y hasta 3 heteroátomos seleccionados independientemente de un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y hasta 3 átomos de nitrógeno, estando cada anillo no sustituido o sustituido con al menos un R^x .

- 15 Realización 39. Un compuesto de Fórmula 1 o cualquiera de las realizaciones 10-25 en el que R^2 es Q^a ; y Q^a es un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, conteniendo cada anillo miembros anulares seleccionados de átomos de carbono y hasta 3 heteroátomos independientemente seleccionados de un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y hasta 3 átomos de nitrógeno, estando cada anillo no sustituido o sustituido con al menos un R^x .

Realización 40. Un compuesto de la realización 39 en el que el anillo heteroaromático es un anillo heteroaromático de 5 miembros.

- 20 Realización 41. Un compuesto de la realización 40 en el que el anillo heteroaromático es un anillo heteroaromático de 5 miembros que tiene un átomo de nitrógeno en la posición 2.

Realización 42. Un compuesto de la realización 39 en el que el anillo heteroaromático es un anillo heteroaromático de 6 miembros.

- 25 Realización 43. Un compuesto de la realización 42 en el que el anillo heteroaromático es un anillo heteroaromático de 6 miembros que tiene un átomo de nitrógeno en la posición 2.

Realización 44. Un compuesto de la realización 43 en el que el anillo heteroaromático es un anillo heteroaromático de 6 miembros que tiene un átomo de nitrógeno en la posición 2 y sustituido con haloalquilo C_1-C_4 .

Realización 45. Un compuesto de la realización 44 en el que el anillo heteroaromático es un anillo heteroaromático de 6 miembros que tienen un átomo de nitrógeno en la posición 2 y sustituido con CF_3 .

- 30 Las realizaciones de esta invención, incluyendo las realizaciones 10-45 anteriores además de cualquier otra realización descrita en la presente memoria, pueden combinarse de cualquier manera, y las descripciones de variables en las realizaciones pertenecen no solo a los compuestos de Fórmula 1 sino también a los compuestos de partida y compuestos intermedios útiles para preparar los compuestos de Fórmula 1. Además, las realizaciones de esta invención, que incluyen las realizaciones 10-45 anteriores además de cualquier otra realización descrita en la presente memoria, y cualquier combinación de las mismas, pertenecen a las composiciones y métodos de la presente invención.
- 35

Las combinaciones de las realizaciones 1-45 se ilustran mediante:

Realización A. Un compuesto de Fórmula 1 en el que

A es CH o CF; y

- 40 m es 0.

Realización B. Un compuesto de Fórmula 1 en el que

A es CH o CF;

m es 0;

Q es Q-2;

- 45 Y^2 es CR^{5a} ;

X^1 es CR^2 y X^2 , X^3 y X^4 son cada uno CH; o X^2 es CR^2 y X^1 , X^3 y X^4 son CH;

R^2 es $C(=Z)NR^6R^7$ o Q^a .

Realización C. Un compuesto de Fórmula 1 en el que

A es CH o CF;

m es 0;

5 Q es Q-2;

Y^2 es CR^{5a} ;

X^1 es CR^2 y X^2 , X^3 y X^4 son cada uno CH;

R^2 es $C(=Z)NR^6R^7$ o Q^a .

Realización D. Un compuesto de Fórmula 1 en el que

10 A es CH o CF;

m es 0;

Q es Q-2;

Y^2 es CR^{5a} ;

X^2 es CR^2 y X^1 , X^3 y X^4 son CH;

15 R^2 es $C(=Z)NR^6R^7$ o Q^a .

Realización E. Un compuesto de Fórmula 1 en el que

A es CH;

m es 0;

Q es Q-2;

20 Y^2 es CR^{5a} ;

R^{5a} es H;

X^1 es CR^2 y X^2 , X^3 y X^4 son cada uno CH; o X^2 es CR^2 y X^1 , X^3 y X^4 son CH;

R^2 es $C(O)NR^6R^7$; y

R^6 es H.

25 Realización F. Un compuesto de Fórmula 1 en el que

A es CH;

m es 0;

Q es Q-2;

Y^2 es CR^{5a} ;

30 R^{5a} es H;

X^1 es CR^2 y X^2 , X^3 y X^4 son cada uno CH;

R^2 es $C(O)NR^6R^7$; y

R^6 es H.

Realización G. Un compuesto de Fórmula 1 en el que

35 A es CH;

m es 0;

Q es Q-2;

Y² es CR^{5a};

R^{5a} es H;

X² es CR² y X¹, X³ y X⁴ son CH;

R² es C(O)NR^{6R7}; y

5 R⁶ es H.

Las realizaciones específicas incluyen compuestos de Fórmula 1 seleccionados del grupo que consiste en (los números de compuesto se refieren a las Tablas de índice A-N):

N-(1-metiletil)-2-(3-piridinil)-2*H*-indazol-4-carboxamida (compuesto 8);

N-ciclopropil-2-(3-piridinil)-2*H*-indazol-4-carboxamida (compuesto 14);

10 *N*-ciclohexil-2-(3-piridinil)-2*H*-indazol-4-carboxamida (compuesto 16);

2-(3-piridinil)-*N*-(2,2,2-trifluoroetil)-2*H*-indazol-4-carboxamida (compuesto 19);

2-(3-piridinil)-*N*-[(tetrahydro-2-furanil)metil]-2*H*-indazol-5-carboxamida (compuesto 41);

2-[[2-(3-piridinil)-2*H*-indazol-5-il]carbonil]hidrazinacarboxilato de metilo (compuesto 42);

N-(2,2-difluoropropil)-2-(3-piridinil)-2*H*-indazol-5-carboxamida (compuesto 54);

15 2-(3-piridinil)-*N*-(2-pirimidinilmetil)-2*H*-indazol-5-carboxamida (compuesto 55); y

N-[(5-metil-2-pirazinil)metil]-2-(3-piridinil)-2*H*-indazol-5-carboxamida (compuesto 76).

Es digno de mención que los compuestos de esta invención se caracterizan por patrones metabólicos y/o residuales en el suelo favorables y muestran actividad que controla un espectro de plagas de invertebrados agronómicos y no agronómicos.

20 Digno de mención particular, por razones del espectro de control de plagas de invertebrados e importancia económica, la protección de cultivos agronómicos del daño o lesión provocados por las plagas de invertebrados mediante el control de plagas de invertebrados son realizaciones de la invención. Los compuestos de esta invención debido a sus propiedades de translocación favorables o sistemicidad en las plantas también protegen las partes de las hojas u otras partes de la planta que no están directamente en contacto con un compuesto de Fórmula 1 o una
25 composición que comprende el compuesto.

También dignas de mención como realizaciones de la presente invención son las composiciones que comprenden un compuesto de cualquiera de las realizaciones anteriores, además de cualquier realización descrita en la presente memoria, y cualquier combinación de las mismas, y al menos un componente adicional seleccionado del grupo que consiste en un tensioactivo, un diluyente sólido y un diluyente líquido, comprendiendo además dichas composiciones
30 opcionalmente al menos un compuesto o agente biológicamente activo adicional.

Además dignas de mención como realizaciones de la presente invención son las composiciones para controlar una plaga de invertebrados que comprenden un compuesto de cualquiera de las realizaciones anteriores, además de cualquier otra realización descrita en la presente memoria, y cualquier combinación de los mismos, y al menos un componente adicional seleccionado del grupo que consiste en un tensioactivo, un diluyente sólido y un diluyente
35 líquido, comprendiendo además opcionalmente dichas composiciones al menos un compuesto o agente biológicamente activo adicional. Las realizaciones de la invención incluyen además métodos para controlar una plaga de invertebrados que comprende poner en contacto la plaga de invertebrados o su medio con una cantidad biológicamente efectiva de un compuesto de cualquiera de las realizaciones anteriores (p.ej., como una composición descrita en la presente memoria).

40 Las realizaciones de la invención incluyen además una composición que comprende un compuesto de cualquiera de las realizaciones anteriores, en forma de una formulación líquida de empape del suelo. Las realizaciones de la invención incluyen además métodos para controlar una plaga de invertebrados que comprende poner en contacto el suelo con una composición líquida como un líquido de empapado del suelo que comprende una cantidad biológicamente efectiva de un compuesto de cualquiera de las realizaciones anteriores.

45 Las realizaciones de la invención también incluyen una composición de pulverización para controlar una plaga de invertebrados que comprende una cantidad biológicamente efectiva de un compuesto de cualquiera de las anteriores realizaciones y un propelente. Las realizaciones de la invención incluyen además una composición cebo para controlar una plaga de invertebrados que comprende una cantidad biológicamente efectiva de un compuesto de cualquiera de las realizaciones anteriores, uno o más materiales alimenticios, opcionalmente un atrayente, y
50 opcionalmente un humectante. Las realizaciones de la invención incluyen además un dispositivo para controlar una

plaga de invertebrados que comprende dicha composición cebo y un alojamiento adaptado para recibir dicha composición cebo, en el que el alojamiento tiene al menos una abertura dimensionada para permitir que la plaga de invertebrados pase a través de la abertura de manera que la plaga de invertebrados pueda acceder a dicha composición cebo desde una posición externa al alojamiento, y en el que el alojamiento se adapta adicionalmente para colocarse en o cerca de una ubicación de actividad potencial o conocida para la plaga de invertebrados.

Las realizaciones de la invención también incluyen métodos para proteger una semilla de una plaga de invertebrados que comprende poner en contacto la semilla con una cantidad biológicamente efectiva de un compuesto de cualquiera de las realizaciones precedentes.

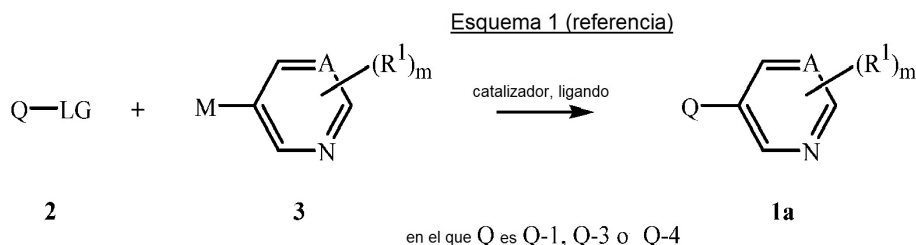
Las realizaciones de la invención también incluyen métodos para proteger un animal de una plaga parasitaria de invertebrados que comprende administrar al animal una cantidad parasitariamente efectiva de un compuesto de cualquiera de las realizaciones precedentes.

Las realizaciones de la invención también incluyen métodos para controlar una plaga de invertebrados que comprende poner en contacto la plaga de invertebrados o su medio con una cantidad biológicamente efectiva de un compuesto de Fórmula 1, un *N*-óxido o una sal del mismo, (p. ej., como una composición descrita en la presente memoria), con tal que los métodos no sean métodos de tratamiento médico de un cuerpo humano o animal para terapia.

Esta invención también se refiere a dichos métodos en los que la plaga de invertebrados o su medio se ponen en contacto con una composición que comprende una cantidad biológicamente efectiva de un compuesto de Fórmula 1, un *N*-óxido o una sal del mismo, y al menos un componente adicional seleccionado del grupo que consiste en tensioactivos, diluyentes sólidos y diluyentes líquidos, comprendiendo además opcionalmente dicha composición una cantidad biológicamente efectiva de al menos un compuesto o agente biológicamente activo adicional, con tal que los métodos no sean métodos de tratamiento médico de un cuerpo humano o animal para terapia.

Uno o más de los siguientes métodos y variaciones como se describen en los Esquemas 1-13 pueden usarse para preparar los compuestos de Fórmula 1. Las definiciones de sustituyentes en los compuestos de las Fórmulas 1-23 posteriores son como se definen anteriormente en el Compendio de la invención a menos que se anote otra cosa. Los compuestos de Fórmulas 1a-1g son varios subconjuntos de los compuestos de Fórmula 1, y todos los sustituyentes para las Fórmulas 1a-1g son como se definen anteriormente para la Fórmula 1. Se usan las siguientes abreviaturas: THF es tetrahidrofurano, DMF es *N,N*-dimetilformamida, NMP es *N*-metilpirrolidinona, Ac es acetato, MS es mesilato, Tf es triflato y Nf es nonaflato.

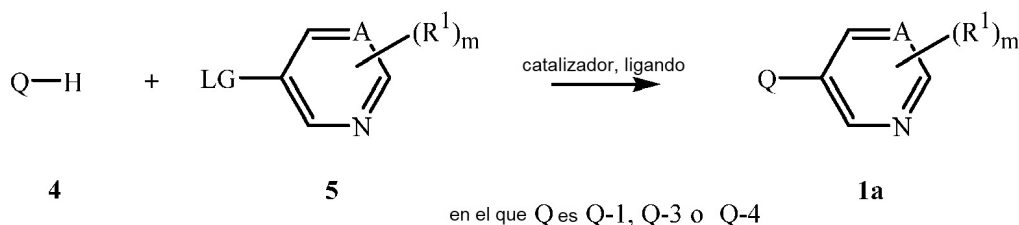
Los compuestos de Fórmula 1a (Fórmula 1 en la que Q es Q-1, Q-3 o Q-4, no reivindicados) pueden prepararse como se muestra en el Esquema 1 mediante el acoplamiento de un compuesto heterocíclico de Fórmula 2 (en el que LG es un grupo saliente adecuado tal como Cl, Br, I, Tf o Nf) con un compuesto heterocíclico de Fórmula 3 (en el que M es un metal o metaloide adecuado tal como una especie de Mg, Zn o B) en presencia de un catalizador y ligando apropiado. Los catalizadores pueden generarse a partir de metales de transición tales como Pd (por ejemplo Pd(OAc)₂ o Pd₂(dba)₃) y ligandos mono o bidentados tales como PPh₃, PCy₃, Pt-Bu₃, x-phos, xantphos, s-phos y dppf. Las bases típicas usadas incluyen carbonatos tales como carbonato sódico o carbonato de cesio, fosfatos tales como trifosfato de potasio, aminas tales como etilidipropilamina, o alcóxidos tales como terc-butóxido sódico. Los disolventes típicos incluyen THF, dioxano, tolueno, etanol, DMF, agua y mezclas de los mismos. Las temperaturas de reacción típicas oscilan de temperatura ambiente al punto de ebullición del disolvente.



Los compuestos de Fórmula 1a (Fórmula 1 en la que Q es Q-1, Q-3 o Q-4, no reivindicada) puede prepararse también como se muestra en el Esquema 2 mediante el acoplamiento de un compuesto de Fórmula 4 con un compuesto de Fórmula 5 (en el que LG es un grupo saliente adecuado tal como Cl, Br, I, Tf o Nf) en presencia de un catalizador y un ligando apropiado. Una variedad de catalizadores puede usarse en el método del Esquema 2, y estos pueden generarse a partir de una especie de metal de transición tal como cobre o Pd (por ejemplo complejos tales como Pd(OAc)₂ o Pd₂(dba)₃) y un ligando. Los ligandos típicos pueden ser mono o bidentados, e incluyen PPh₃, PCy₃, Pt-Bu₃, x-phos, xantphos, s-phos y dppf. Las bases típicas usadas incluyen carbonatos tales como carbonato sódico o carbonato de cesio, fosfatos tales como trifosfato de potasio, aminas tales como etilidipropilamina o alcóxidos tales como terc-butóxido sódico. Los aditivos tales como cribas moleculares, Bu₄N⁺Br o sales de cobre o plata (p.ej., AgOAc) pueden ser beneficiosos. Los disolventes de reacción típicos incluyen THF, dioxano, tolueno, etanol, DMF, agua o mezclas de los mismos. Las temperaturas de reacción típicas

oscilan de temperatura ambiente al punto de ebullición del disolvente. Por ejemplo, véase Chemical Communications 2011, 47(17), páginas 5043-5045; Journal of the American Chemical Society 2010, 132(11), páginas 3674-3675; Heterocycles 2011, 83(6), páginas 1371-1376; Publicación de Solicitud de Patente de EE.UU. 20090076266; Bulletin of the Chemical Society of Japan 1998, 71(2), páginas 467-473; Tetrahedron Letters 2008, 49(10), páginas 1598-1600; y Tetrahedron Letters 2010, 51(42), páginas 5624-5627.

Esquema 2 (Referencia)



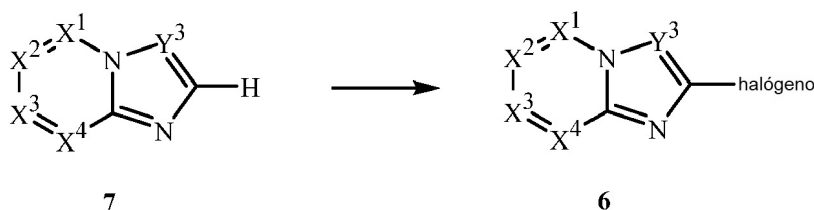
Los compuestos de Fórmula 2 en los que LG es halógeno pueden prepararse a partir de las aminas correspondientes por tratamiento con una fuente de ON⁺ tal como nitrito de isoamilo o nitrito de t-butilo o ácido nitroso en presencia de una fuente de halógeno tal como CuBr₂ o BnNEt₃⁺Br. Las condiciones de reacción preferidas incluyen disolventes acuosos u orgánicos tales como THF o acetonitrilo, y temperaturas de reacción que oscilan de 0°C al punto de ebullición del disolvente.

Los compuestos de Fórmula 2 en los que LG es Cl o Br pueden prepararse también a partir de los correspondientes compuestos hidroxí mediante tratamiento con un agente de halogenado tal como POCl₃, PCl₅, PBr₃ o SOCl₂. Los compuestos de Fórmula 2 en los que LG es OMS o OTf pueden prepararse también a partir de los compuestos hidroxí correspondientes por tratamiento con MsCl o Tf₂O.

Los compuestos de Fórmula 4 pueden prepararse a partir de los compuestos amina correspondientes por tratamiento con una fuente de ON⁺ tal como nitrito de isoamilo o nitrito de t-butilo. Las condiciones de reacción preferidas incluyen disolventes etéreos tales como THF a temperaturas que oscilan de temperatura ambiente al punto de ebullición del disolvente.

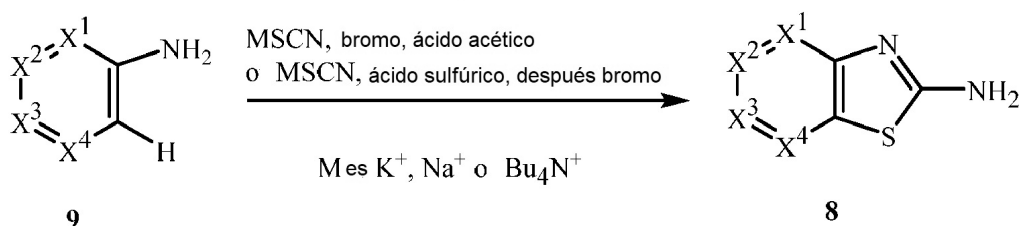
Los compuestos de Fórmula 6 pueden prepararse por halogenación electrófila de los correspondientes compuestos de Fórmula 7 por tratamiento con un agente de halogenado tal como *N*-bromosuccinimida en un disolvente adecuado tal como DMF, NMP o ácido acético a temperaturas que oscilan de temperatura ambiente hasta el punto de ebullición del disolvente (Esquema 3).

Esquema 3 (referencia)



Los 2-aminobenzotiazoles de Fórmula 8 pueden prepararse a partir de anilinas orto-no sustituidas de Fórmula 9 y un anión tiocianato (en el que M es K⁺, Na⁺ o Bu₄N⁺) como se muestra en el Esquema 4. La reacción puede realizarse en una única etapa en ácido acético por ejemplo, o a través de la intermediación de una tiourea seguido por oxidación. Los oxidantes adecuados incluyen bromo.

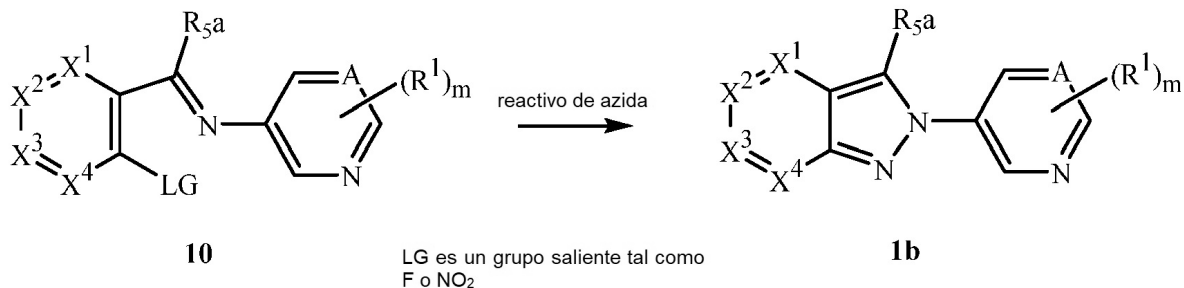
Esquema 4 (referencia)



Los compuestos de Fórmula 1b pueden prepararse a partir de compuestos de Fórmula 10 mediante el método mostrado en el Esquema 5, en que un compuesto de Fórmula 10 se trata con un reactivo azida (por ejemplo, azida

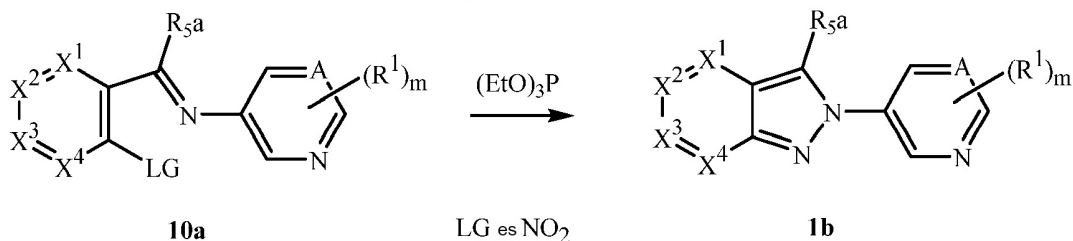
sódica o azida de tetrabutilamonio). Las condiciones de reacción típicas incluyen DMF o NMP como disolvente, y las temperaturas de reacción oscilan de 80°C al punto de ebullición del disolvente.

Esquema 5



5 Los compuestos de Fórmula 1b pueden prepararse también a partir de compuestos de Fórmula 10a mediante el método mostrado en el Esquema 5a, en que un compuesto de Fórmula 10a se trata con fosfito de trietilo.

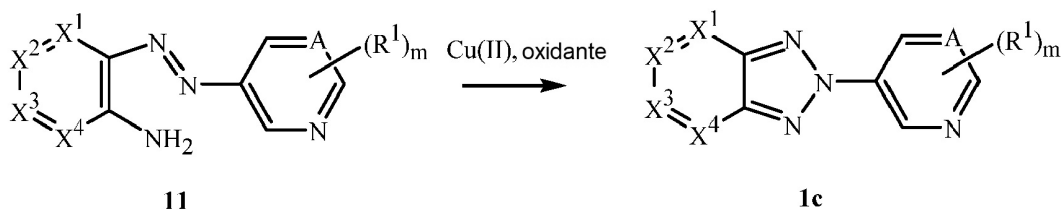
Esquema 5a



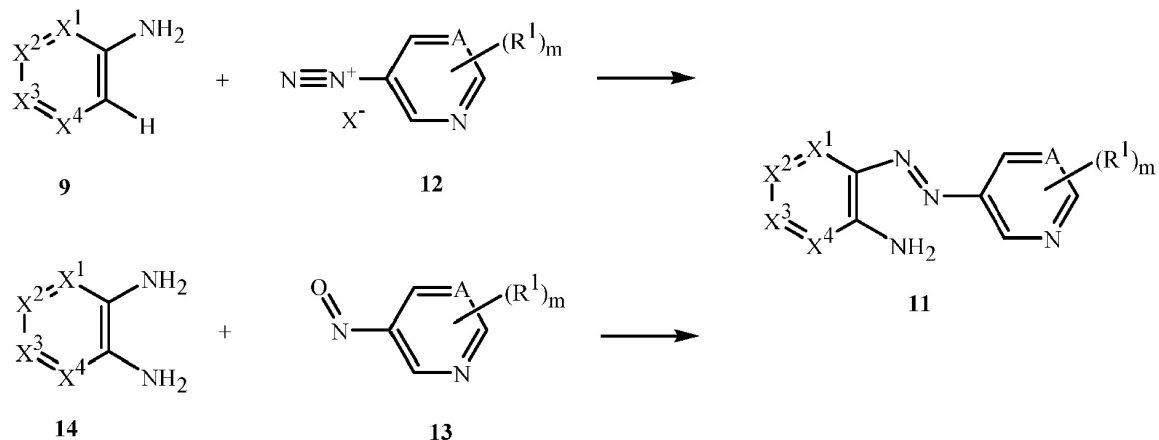
Los compuestos de Fórmulas 10 y 10a son bases de Schiff y pueden prepararse por métodos conocidos en la técnica (véase, por ejemplo, March, J., *Advanced Organic Chemistry*, Wiley, 1992, páginas 896-898).

10 Los compuestos de Fórmula 1c pueden prepararse a partir de compuestos de Fórmula 11 mediante el método mostrado en el Esquema 6 por medio de oxidación de un compuesto de Fórmula 11 con oxígeno molecular o un peróxido tal como hidroperóxido de t-butilo en presencia de un catalizador de cobre (II) tal como Cu(OAc)₂ o CuBr₂. Las condiciones de reacción típicas incluían disolventes alcohólicos tales como alcohol de t-amilo, DMF, NMP o amoníaco acuoso, y temperaturas de reacción de 60°C al punto de ebullición del disolvente.

Esquema 6 (referencia)

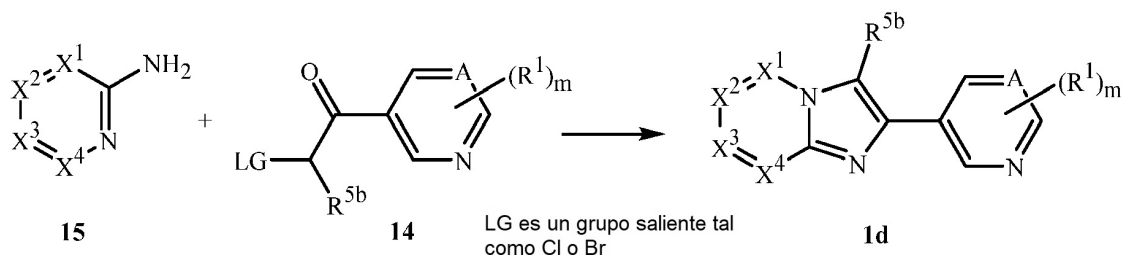


15 Los compuestos 2-aminoazo de Fórmula 11 pueden prepararse por reacción de una anilina de Fórmula 9 con una sal de diazonio de Fórmula 12 por métodos conocidos en la técnica (véase, por ejemplo, March, J., *Advanced Organic Chemistry*, Wiley, 1992, páginas 525-526). Los compuestos de Fórmula 11 pueden prepararse también por reacción de un compuesto arilnitroso de Fórmula 13 con una diamina de Fórmula 14 en un disolvente tal como ácido acético. Estos dos métodos se muestran en el Esquema 7.

Esquema 7 (referencia)

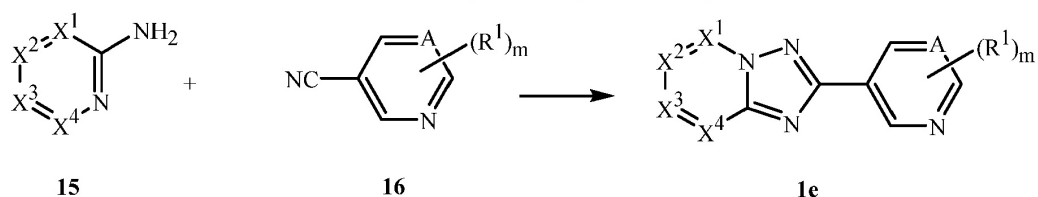
Los compuestos de Fórmula 1d pueden prepararse por condensación de un compuesto de Fórmula 14 (en el que LG es un grupo saliente adecuado tal como Cl o Br) con una aminopiridina o aminodiazina de Fórmula 15 como se muestra en el Esquema 8. Las condiciones de reacción típicas incluyen un disolvente alcohólico tal como etanol o tolueno, y un intervalo de temperatura de reacción de temperatura ambiente al punto de ebullición del disolvente. El nitrógeno de piridina puede protegerse opcionalmente como un aducto de BH_3 , un N-óxido o un derivado de 2- o 6-halopiridina.

5

Esquema 8 (referencia)

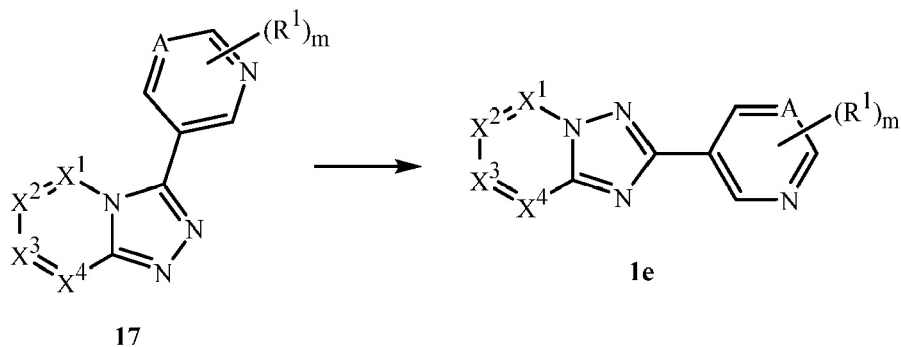
Los compuestos de Fórmula 1e pueden prepararse como se muestra en el Esquema 9 por la cicloadición de 2-aminopiridinas de Fórmula 15 con arilnitrilos de Fórmula 16 (véase, por ejemplo, Journal of the American Chemical Society 2009, 131(42), páginas 15080-15081, y el documento WO 2013041472).

10

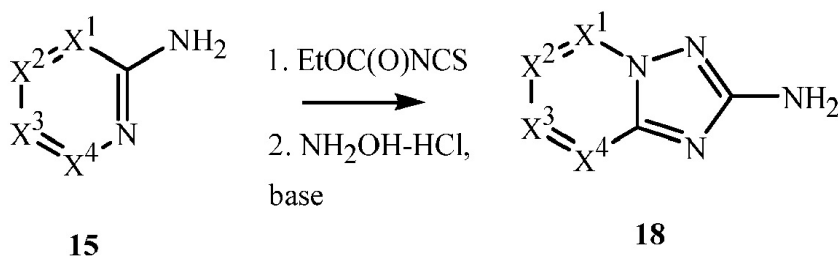
Esquema 9 (referencia)

Los compuestos de Fórmula 1e pueden prepararse también mediante reorganización de compuestos de Fórmula 17 mediante tratamiento con base como se muestra en el Esquema 10 (véase, por ejemplo, J. Het Chem 1970, 7 página 1019). Los compuestos de Fórmula 17 pueden prepararse por los métodos descritos en el documento WO 2008006540 y J. Org. Chem., 1966, página 251.

15

Esquema 10 (referencia)

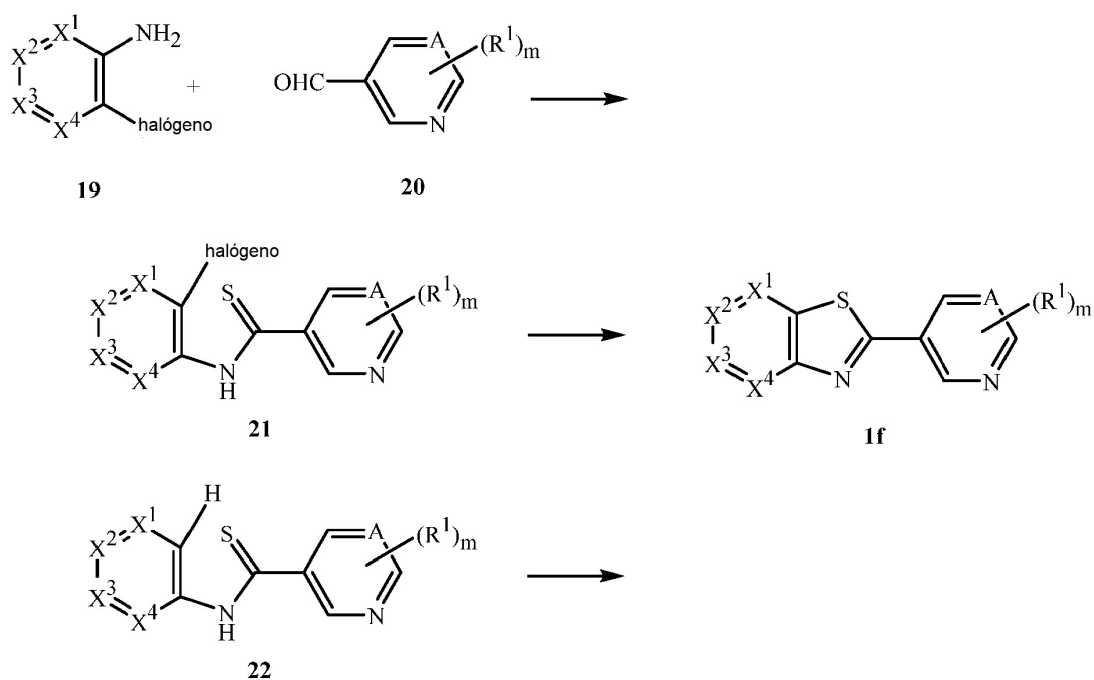
Los intermedios de Fórmula 18 pueden prepararse por el método mostrado en el Esquema 11 por tratamiento de una 2-aminopiridina de Fórmula 15 con un isocianato seguido por hidroxilamina y una base adecuada tal como trietilamina.

Esquema 11 (referencia)

5

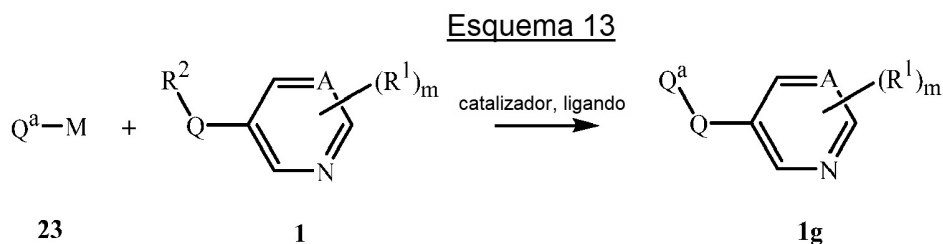
Los compuestos de Fórmula 1f pueden prepararse como se muestra en el Esquema 12 por ciclación oxidativa de un aldehído de arilo de Fórmula 20 con una anilina de Fórmula 19 que porta un orto-halógeno, preferiblemente yodo, en presencia de azufre que actúa tanto como una fuente de azufre como un agente oxidante. La reacción se lleva a cabo en presencia de una base tal como K_2CO_3 en un disolvente adecuado tal como agua o DMF, y se cataliza mediante la adición de sales de cobre (por ejemplo, CuI o $CuCl_2$) y preferiblemente un ligando adecuado tal como 1,10-fenantrolina. Las temperaturas de reacción típicas oscilan de $70^\circ C$ al punto de ebullición del disolvente.

10

Esquema 12 (referencia)

Los compuestos de Fórmula 1f pueden prepararse también por ciclación de 2-halotioamidas de Fórmula 21 como se

- muestra en la segunda reacción del Esquema 12 con una base tal como KOtBu, NaH, DBU o Cs₂CO₃ en un disolvente adecuado tal como tolueno o DMF, opcionalmente con la adición de sales de cobre tales como CuI, y preferiblemente un ligando adecuado tal como 1,10-fenantrolina. Esta reacción pueden catalizarse también mediante especies de Pd tales como las preparadas a partir de Pd₂(dba)₃ y (t-Bu)₂P-*o*-bifenilo, una base tal como Cs₂CO₃ en un disolvente adecuado, tal como 1,2-dimetoxietano o dioxano. Las temperaturas de reacción típicas oscilan de 80°C al punto de ebullición del disolvente. Para las reacciones catalizadas por cobre y Pd, el sustituyente halógeno del compuesto de Fórmula 21 es preferiblemente Br o I. Por ejemplo, véase Journal of Organic Chemistry 2006, 71(5), páginas 1802-1808; Tetrahedron Letters 2003, 44(32), páginas 6073-6077; Synthetic Communications 1991, 21(5), páginas 625-33; y Sol. Pat. Eur. Núm. 450420.
- Los compuestos de Fórmula 1f pueden prepararse también mediante la ciclación oxidativa de tioamidas de Fórmula 22 como se muestra en la tercera reacción del Esquema 12. Los oxidantes típicamente usados en este método incluyen bromo o yodo, DDQ y K₃Fe(CN)₆. Por ejemplo, véase Journal of Organic Chemistry 2007, 63(41), páginas 10276-10281; Synthesis 2007, (6); 819-823; y la Publ. de Sol. de Pat. de EE.UU., 20120215154.
- Los tres métodos descritos en el Esquema 12 pueden usarse para preparar compuestos en los que X¹-X⁴ son átomos de carbono, o en los que uno de X¹-X⁴ es un nitrógeno (por ejemplo, véase J. Heterocyclic Chem. 2009, 46, página 1125 y las referencias citadas en él).
- Los compuestos de Fórmula 1, e intermedios usados en la preparación de compuestos de Fórmula 1, en los que Z es S pueden prepararse por tionación de los correspondientes compuestos en los que Z es O con, por ejemplo, reactivo de Lawesson (CAS núm. 19172-47-5), reactivo de Belleau (CAS núm. 88816-02-8) o P₂S₅. Las reacciones de tionación se realizan típicamente en disolventes tales como tolueno, xilenos o dioxano, y a elevada temperatura de 80°C al punto de ebullición del disolvente.
- Los compuestos de Fórmula 1 en los que R² es C(O)NR⁶R⁷ pueden prepararse por carbonilación de los correspondientes compuestos en los que R² es halógeno (preferiblemente Br o I), o en los que R² es un sulfonato (por ejemplo, triflato o nonaflato). Esta reacción se realiza en presencia de una fuente de monóxido de carbono tal como gas monóxido de carbono o Mo(CO)₆ a presiones entre presión atmosférica y 25 bar, opcionalmente con calentamiento por microondas, y generalmente a temperaturas elevadas en el intervalo de 80 a 160°C. Los disolventes de reacción típicos incluyen DMF, NMP, tolueno o disolventes etéreos tales como THF o dioxano.
- Los compuestos de Fórmula 1 en los que R² es Q^a pueden prepararse como se muestra en el Esquema 13. El método del Esquema 13 es similar al método descrito en el Esquema 1; M es un metal o metaloide adecuado tal como una especie de Mg, Zn o B, y R² corresponde a LG en el Esquema 1 y es un grupo saliente adecuado tal como Cl, Br, I, Tf o Nf.



- Los compuestos de Fórmula 1 en los que R² es Q^a y Q^a está unido a Q por medio de un átomo de nitrógeno en Q^a pueden prepararse por un método similar al del Esquema 13. En este método, M en el compuesto de Fórmula 23 es hidrógeno. Los reactivos de acoplamiento incluyen sales de cobre (I) tal como CuI, y un ligando adecuado tal como *trans*-bis(*N,N*-dimetil-1,2-ciclohexanodiamina). Las condiciones de reacción típicas incluyen un disolvente tal como tolueno o dioxano, y una elevada temperatura de reacción que oscila de 80°C al punto de ebullición del disolvente.
- Ejemplos de intermedios útiles en la preparación de compuestos de esta invención se muestran en las Tablas I-1 a I-16. Las siguientes abreviaturas se usan en las Tablas que siguen: Me significa metilo, Et significa etilo, Ph significa fenilo, C(O) significa carbonilo y CHO significa formilo.

Tabla I-1

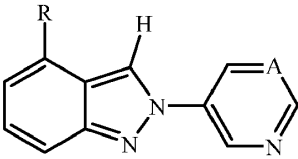
	
A es CH	
R	R
-COOH	-C(O)OMe
-C(O)OEt	ciano
-C(O)Cl	-C(O)OPh
-C(O)O(4-nitrofenilo)	-C(O)Me
-CHO	Cl
Br	I
-OS(O) ₂ CF ₃	NH ₂
nitro	
A es CF	
R	R
-COOH	-C(O)OMe
-C(O)OEt	ciano
-C(O)Cl	-C(O)OPh
-C(O)O(4-nitrofenilo)	-C(O)Me
-CHO	Cl
Br	I
-OS(O) ₂ CF ₃	NH ₂
nitro	
A es N	
R	R
-COOH	-C(O)OMe
-C(O)OEt	ciano
-C(O)Cl	-C(O)OPh
-C(O)O(4-nitrofenilo)	-C(O)Me
-CHO	Cl
Br	I
-OS(O) ₂ CF ₃	NH ₂
nitro	

Tabla I-2

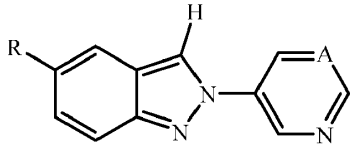
	
A es CH	
R	R
-COOH	-C(O)OMe
-C(O)OEt	ciano
-C(O)Cl	-C(O)OPh
-C(O)O(4-nitrofenilo)	-C(O)Me
-CHO	Cl
Br	I
-OS(O) ₂ CF ₃	NH ₂
nitro	
A es CF	
R	R
-COOH	-C(O)OMe
-C(O)OEt	Ciano
-C(O)Cl	-C(O)OPh
-C(O)O(4-nitrofenilo)	-C(O)Me
-CHO	Cl
Br	I
-OS(O) ₂ CF ₃	NH ₂
nitro	
A es N	
R	R
-COOH	-C(O)OMe
-C(O)OEt	ciano
-C(O)Cl	-C(O)OPh
-C(O)O(4-nitrofenilo)	-C(O)Me
-CHO	Cl
Br	I
-OS(O) ₂ CF ₃	NH ₂
nitro	

Tabla I-3

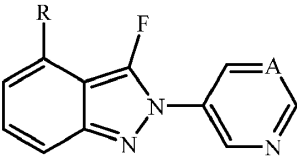
	
A es CH	
R	R
-COOH	-C(O)OMe
-C(O)OEt	ciano
-C(O)Cl	-C(O)OPh
-C(O)O(4-nitrofenilo)	-C(O)Me
-CHO	Cl
Br	I
-OS(O) ₂ CF ₃	NH ₂
Nitro	
A es CF	
R	R
-COOH	-C(O)OMe
-C(O)OEt	ciano
-C(O)Cl	-C(O)OPh
-C(O)O(4-nitrofenilo)	-C(O)Me
-CHO	Cl
Br	I
-OS(O) ₂ CF ₃	NH ₂
Nitro	
A es N	
R	R
-COOH	-C(O)OMe
-C(O)OEt	ciano
-C(O)Cl	-C(O)OPh
-C(O)O(4-nitrofenilo)	-C(O)Me
-CHO	Cl
Br	I
-OS(O) ₂ CF ₃	NH ₂
Nitro	

Tabla I-4

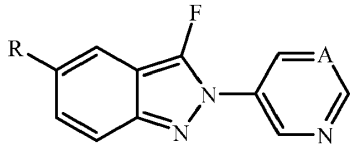
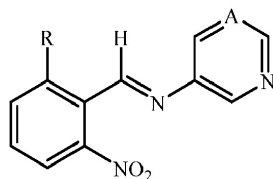
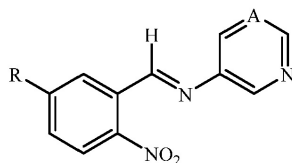
	
A es CH	
R	R
-COOH	-C(O)OMe
-C(O)OEt	ciano
-C(O)Cl	-C(O)OPh
-C(O)O(4-nitrofenilo)	-C(O)Me
-CHO	Cl
Br	I
-OS(O) ₂ CF ₃	NH ₂
nitro	
A es CF	
R	R
-COOH	-C(O)OMe
-C(O)OEt	ciano
-C(O)Cl	-C(O)OPh
-C(O)O(4-nitrofenilo)	-C(O)Me
-CHO	Cl
Br	I
-OS(O) ₂ CF ₃	NH ₂
nitro	
A es N	
R	R
-COOH	-C(O)OMe
-C(O)OEt	ciano
-C(O)Cl	-C(O)OPh
-C(O)O(4-nitrofenilo)	-C(O)Me
-CHO	Cl
Br	I
-OS(O) ₂ CF ₃	NH ₂
nitro	

TABLA I-13



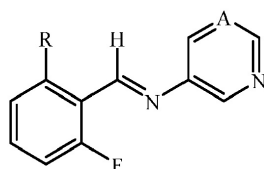
La tabla I-13 es idéntica a la Tabla I-1, excepto que la estructura mostrada bajo el encabezado "Tabla 1-1" se sustituye por la estructura mostrada encima.

TABLA I-14



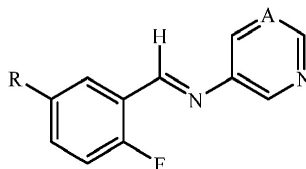
- 5 La tabla I-14 es idéntica a la Tabla I-1, excepto que la estructura mostrada bajo el encabezado "Tabla 1-1" se sustituye por la estructura mostrada encima.

TABLA I-15



La tabla I-15 es idéntica a la Tabla I-1, excepto que la estructura mostrada bajo el encabezado "Tabla 1-1" se sustituye por la estructura mostrada encima.

TABLA I-16



- 10 La tabla I-16 es idéntica a la Tabla I-1, excepto que la estructura mostrada bajo el encabezado "Tabla 1-1" se sustituye por la estructura mostrada encima.

Se reconoce que algunos reactivos y condiciones de reacción descritas anteriormente para preparar compuestos de Fórmula 1 pueden no ser compatibles con ciertas funcionalidades presentes en los intermedios. En estos ejemplos, la incorporación de secuencias de protección/desprotección o interconversiones de grupo funcional en la síntesis ayudará en la obtención de los productos deseados. El uso y la elección de los grupos protectores será evidente para un experto en síntesis química (véase, por ejemplo, Greene, T.W.; Wuts, P.G.M. *Protective Groups in Organic Synthesis*, 2ª ed.; Wiley: Nueva York, 1991). Un experto en la técnica reconocerá que, en algunos casos, después de la introducción de los reactivos representados en los esquemas individuales, pueden necesitarse etapas sintéticas rutinarias adicionales no descritas en detalle para completar la síntesis de compuestos de Fórmula 1. Un experto en la técnica también reconocerá que puede ser necesario realizar una combinación de las etapas ilustradas en los esquemas anteriores en un orden distinto del implicado por la secuencia particular presentada para preparar los compuestos de Fórmula 1.

Un experto en la técnica también reconocerá que los compuestos de Fórmula 1 y los intermedios descritos en la presente memoria pueden estar sujetos a varias reacciones electrófila, nucleófila, radical, organometálico, oxidación y reducción para añadir sustituyentes o modificar sustituyentes existentes.

Sin elaboración adicional, se cree que un experto en la técnica que usa la descripción precedente puede utilizar la presente invención en toda su extensión. Los siguientes Ejemplos de síntesis, por lo tanto, se van a construir como meramente ilustrativos, y no limitantes de la descripción de ninguna forma en absoluto. Las etapas en los siguientes Ejemplos de síntesis ilustran un procedimiento para cada etapa en una transformación sintética total, y el material de partida para cada etapa puede no haberse preparado necesariamente mediante una marcha preparativa particular

cuyo procedimiento se describe en otros Ejemplos o Etapas. Los porcentajes son en peso excepto para mezclas de disolventes cromatográficos o donde se indique otra cosa. Las partes y porcentajes para mezclas de disolventes cromatográficos son en volumen a menos que se indique otra cosa. Los espectros ^1H RMN se presentan en ppm hacia abajo del tetrametilsilano, "s" significa singlete, "d" significa duplete, "t" significa triplete, "q" significa cuartete, "m" significa multiplete, "dd" significa duplete de dupletes, "dt" significa duplete de tripletes, "br s" significa singlete ancho. DMF significa *N,N*-dimetilformamida. Los números del compuesto se refieren a las Tablas de índice A-N.

Ejemplo de síntesis 1 (referencia, no reivindicado)

Preparación de *N*-[2-(metiltio)etil]-2-(3-piridinil)-7-benzotiazolcarboxamida (compuesto 84)

Etapas A: Preparación del etiléster de ácido 3-[(aminotioxometil)amino]benzoico

- 10 Se disolvió 3-aminobenzoato de etilo (35,25 g, 213,6 mmoles) en clorobenceno (250 mL) y se enfrió a -10°C . Se añadió ácido sulfúrico concentrado (5,93 mL) seguido de KSCN (21,76 g) y 18-corona-6 (600 mg), y la mezcla de reacción se calentó a 100°C durante 14 horas. Se añadieron hexanos a la mezcla enfriada, y el sólido precipitado se aisló por filtración. El sólido se suspendió en una mezcla de agua y hexanos, y la lechada se agitó durante 1 hora. El sólido se aisló por filtración y se secó al vacío toda la noche para dar el compuesto del título como un sólido gris (40,7 g). ^1H RMN (DMSO- d_6) δ : 10,10 + 9,87 (dos s, 1H), 8,08 + 8,05 (dos s, 1H), 7,66-7,80 (m, 2H), 7,43-7,51 (m, 1H), 8,0-7,0 (br s, 2H), 4,28-4,35 (m, 2H), 1,29-1,35 (m, 3H).

Etapas B: Preparación de etiléster de ácido 2-amino-7-benzotiazolcarboxílico

- 20 El producto de la Etapa A se absorbe en cloroformo (300 mL) y ácido acético (200 mL) y bromo (21 mL) en cloroformo (100 mL) se añadió en gotas durante 1,5 horas. La mezcla de reacción se calentó entonces a 70°C durante 4 horas, se enfrió, se filtró y el sólido aislado se lavó con 50 mL de 1:1 acetona/cloroformo. El sólido se añadió a una disolución de Na_2CO_3 (25 g) en agua (400 mL) y se agitó durante 20 minutos. La suspensión se filtró, y el sólido aislado se lavó con agua, y se secó *al vacío* toda la noche para dar el compuesto del título (6,73 g) como un sólido blanco. El filtrado orgánico se concentró y se suspendió de nuevo en 100 mL de 1:1 cloroformo/acetona, y se procesó como se describe anteriormente para dar unos 8,1 g adicionales de sólido blanco (90% de pureza, siendo el 10% restante el benzotiazol regioisomérico). ^1H RMN (DMSO- d_6) δ : 7,66 (dd, $J=7,7$, 0,9 Hz, 1H), 7,60 (s, 1H), 7,57 (dd, 1H), 7,35 (t, $J=7,8$ Hz, 1H), 4,37 (q, $J=7,1$ Hz, 2H), 1,36 (t, $J=7,1$ Hz, 3H).

Etapas C: Preparación de etiléster de ácido 2-cloro-7-benzotiazolcarboxílico

- 30 El producto de la etapa B (7,97 g, mezcla 9:1 de regioisómeros, 35,9 mmoles) se añadió en porciones durante 45 minutos a una mezcla de *tert*-butilnitrito (7,1 mL) y CuCl_2 (5,31 g) en acetonitrilo (360 mL) a 65°C . Después de agitar durante unos 15 minutos adicionales, la mezcla enfriada se extrajo 6 veces con hexanos. Los extractos combinados se concentraron para dar el compuesto del título (5,85 g) como un sólido amarillo. La fase de acetonitrilo se diluyó con agua (200 mL), se extrajo con hexanos, y la fracción de hexanos se filtró a través de una almohadilla de gel de sílice eluyendo con cloruro de butilo para dar unos 0,55 g adicionales de producto tras la concentración. ^1H RMN (CDCl_3) δ : 8,14 (d, 2H), 7,58 (t, 1H), 4,49 (q, $J=7,1$ Hz, 2H), 1,47 (t, $J=7,2$ Hz, 3H).

- 35 Etapas D: Preparación de ácido 2-(3-piridinil)-7-benzotiazolcarboxílico

- 40 El producto de la etapa C (6,2 g, 9:1 mezcla de regioisómeros) se combinó con ácido 3-piridinilborónico (3,79 g), PPh_3 (1,35 g) y Na_2CO_3 (5,44 g) en tolueno (100 mL), agua (25 mL) y etanol (15 mL), y la mezcla de reacción se roció con nitrógeno durante 5 minutos. Se añadió Pd_2dba_3 (588 mg), y la mezcla de reacción se calentó a reflujo durante 4 horas. La mezcla de reacción enfriada se diluyó con agua, se extrajo dos veces con diclorometano, y los extractos orgánicos combinados se secaron sobre MgSO_4 y se concentraron. El residuo se purificó por cromatografía de columna (gel de sílice eluido con acetato de etilo al 10% a 50% en hexanos) para dar un sólido naranja (6,7 g). La recristalización desde etanol (25 mL) dio el éster de etilo del compuesto del título (5,65 g) como el regioisómero deseado sencillo. ^1H RMN (CDCl_3) δ : 9,38 (br s, 1H), 8,75 (br s, 1H), 8,44 (dt, $J=8,0$, 1,9 Hz, 1H), 8,30 (dd, $J=8,2$, 1,1 Hz, 1H), 8,19 (dd, $J=7,6$, 1,1 Hz, 1H), 7,62 (t, 1H), 7,47 (dd, $J=8,4$, 4,4 Hz, 1H), 4,53 (q, $J=7,2$ Hz, 2H), 1,50 (t, $J=7,2$ Hz, 3H).

El producto obtenido arriba se disolvió en etanol (100 mL) y se trató con una disolución 1N de NaOH (24,8 mL). La mezcla de reacción se calentó a reflujo durante 1,5 horas antes de enfriarse, neutralizarse con HCl concentrado (2,0 mL) y concentrarse. El residuo se secó al vacío para dar una mezcla del compuesto del título y NaCl, que se usó sin purificación adicional en la siguiente etapa.

- 50 Etapas E: Preparación de *N*-[2-(metiltio)etil]-2-(3-piridinil)-7-benzotiazolcarboxamida

Se añadió cloruro de tionilo (40 mL) al producto de la etapa D (0,55 g), y la mezcla de reacción se calentó a reflujo durante 3 horas. La mezcla de reacción se enfrió después y se concentró. El residuo resultante se suspendió en tolueno y se concentró para dar el cloruro de ácido en bruto, que se usó sin purificación adicional.

El cloruro de ácido en bruto (que contenía 120% en moles de NaCl, 114 mg, 0,3 mmoles) se trató con diclorometano

(5 mL), MeSCH₂CH₂NH₂ (33 µL) y trietilamina (125 µL), y la mezcla de reacción se agitó entonces a temperatura ambiente durante 14 horas. La mezcla de reacción se diluyó con una disolución acuosa saturada de NaHCO₃, se extrajo dos veces con diclorometano, y se secó sobre MgSO₄. Las fases orgánicas combinadas se concentraron, y el residuo se purificó por cromatografía en columna (gel de sílice eluido con acetato de etilo al 30% en hexanos a acetato de etilo al 100%) para dar 65 mg del compuesto del título, un compuesto de esta invención. ¹H RMN (CDCl₃) δ: 9,39 (d, J=1,7 Hz, 1H), 8,74 (d, J=3,3 Hz, 1H), 8,40-8,47 (dt, 1H), 8,26 (dd, J=8,0, 0,9 Hz, 1H), 7,71 (dd, J=7,6, 0,9 Hz, 1H), 7,58-7,64 (t, 1H), 7,47 (dd, J=7,2, 5,0 Hz, 1H), 6,94 (br t, 1H), 3,75-3,82 (q, 2H), 2,80-2,88 (t, 2H), 2,18 (s, 3H).

Ejemplo de síntesis 2 (referencia, no reivindicado)

10 Preparación de 2-(5-fluoro-3-piridinil)-N-(2,2,2-trifluoroetil)-6-benzotiazolcarboxamida (compuesto 127)

Etapa A: Preparación de ácido 2-(5-fluoro-3-piridinil)-6-benzotiazolcarboxílico

Se combinó 4-amino-3-yodobenzoato de metilo (1,93 g, 6,96 mmoles) con K₂CO₃ (1,92 g), S₈ (668 mg), CuCl₂·2H₂O (119 mg), 1,10-fenantrolina (125 mg) y 5-fluoro-3-piridinacarboxaldehído (957 mg) en H₂O (30 mL), y la mezcla de reacción se calentó a reflujo 16 horas. La mezcla de reacción enfriada se filtró, y el filtrado se trató con NH₄Cl (1,49 g). La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 10 minutos, se filtró, y el sólido se secó *al vacío* para dar un sólido gris. El sólido se suspendió en dioxano, la suspensión se calentó a reflujo, se enfrió, y se filtró para aislar un sólido. El sólido se enjuagó con etiléter para dar el compuesto del título (0,66 g). ¹H RMN (DMSO-d₆) δ: 9,15 (s, 1H), 8,80 (d, J=2,7 Hz, 1H), 8,65 (s, 1H), 8,39 (dt, J=9,5, 2,2 Hz, 1H), 8,10 (d, 1H), 8,05 (d, 1H), 8,0-6,5 (br s).

20 Etapa B: Preparación de 2-(5-fluoro-3-piridinil)-N-(2,2,2-trifluoroetil)-6-benzotiazolcarboxamida

Se añadió cloruro de tionilo (5 mL) al producto de la etapa A (0,66 g), y la mezcla se calentó a reflujo durante 16 horas. La mezcla de reacción se enfrió después y se concentró. El residuo resultante se suspendió en tolueno y se concentró para proporcionar el cloruro de ácido en bruto, que se usó sin purificación adicional.

El cloruro de ácido en bruto (103 mg, 0,31 mmoles) se trató con diclorometano (5 mL), trietilamina (131 µL) y CF₃CH₂NH₂ (29 µL), y la mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 3 días. La mezcla de reacción se diluyó con una disolución acuosa saturada de NaHCO₃, se extrajo dos veces con diclorometano, y se secó sobre MgSO₄. Las fases orgánicas combinadas se concentraron, y el residuo se purificó por cromatografía en columna (gel de sílice eluido con acetato de etilo de 20% a 40% en hexanos) para dar el compuesto del título, un compuesto de esta invención, como un sólido blanco (52 mg). ¹H RMN (CDCl₃) δ: 9,32 (br s, 1H), 8,77 (d, J=4,3 Hz, 1H), 8,48 (d, J=1,4 Hz, 1H), 8,40 (dt, J=7,9, 2,0 Hz, 1H), 8,16 (d, J=8,5 Hz, 1H), 7,90 (dd, J=8,5, 1,7 Hz, 1H), 7,48 (dd, J=7,8, 4,7 Hz, 1H), 6,48 (br t, 1H), 4,20 (qd, J=9,0 Hz, 1H).

Ejemplo de síntesis 3

Preparación de N-(1-metiletil)-2-(3-piridinil)-2H-indazol-4-carboxamida (compuesto 8)

Etapa A: Preparación de N-[(2-bromo-6-fluorofenil)metileno]-3-piridinamina

35 Una disolución de 2-bromo-6-fluorobenzaldehído (5 g, 24,6 mmoles) y 3-aminopiridina (2,7 g, 29,5 mmoles) en EtOH (4 mL) se calentó a reflujo toda la noche. La mezcla de reacción se concentró y el sólido resultante se purificó por cromatografía en columna (gel de sílice eluido con acetato de etilo al 0-40% en hexanos) para proporcionar el compuesto del título (4,5 g) como un sólido naranja. ¹H RMN (CDCl₃) δ: 8,66-8,70 (s, 1H), 8,48-8,53 (m, 2H), 7,52-7,58 (m, 1H), 7,41-7,48 (m, 1H), 7,31-7,37 (m, 1H), 6,95-7,06 (m, 2H).

40 Etapa B: Preparación de 4-bromo-2-(3-piridinil)-2H-indazol

Una disolución del producto de la etapa A (4,5 g, 16,1 mmoles) y NaN₃ (1,2 g, 19,3 mmoles) en DMF (20 mL) se calentó a 90°C durante 24 horas. La mezcla enfriada se diluyó con agua y se extrajo 3 veces con diclorometano. Las fases orgánicas combinadas se secaron (MgSO₄), se filtraron, se concentraron, y el residuo se purificó por cromatografía en columna (gel de sílice eluido con acetato de etilo al 0-30% en hexanos) para dar el compuesto del título (4,0 g) como un sólido amarillo. ¹H RMN (CDCl₃) δ: 9,21 (d, J=2,4 Hz, 1H), 8,69 (dd, J=4,8, 1,3 Hz, 1H), 8,46-8,49 (d, 1H), 8,28 (ddd, J=8,3, 2,7, 1,5 Hz, 1H), 7,73 (d, J=8,7 Hz, 1H), 7,50 (ddd, J=8,2, 4,8, 0,7 Hz, 1H), 7,31 (d, 1H), 7,21 (dd, J=8,7, 7,3 Hz, 1H).

Etapa C: Preparación de N-(1-metiletil)-2-(3-piridinil)-2H-indazol-4-carboxamida

50 El producto de la etapa B (200 mg, 0,727 mmoles), isopropilamina (183 µL, 2,18 mmoles), *trans*-bis(acetato)bis[*o*-(di-*o*-tolilfosfino)encil]dipaladio (II) (17 mg, 0,018 mmoles), tetrafluoroborato de *tri-terc*-butilfosfonio (10,5 mg, 0,036 mmoles), hexacarbonilo molibdeno (192 mg, 0,727 mmoles), 1,8-diazabicycloundec-7-eno (473 µL, 2,18 mmoles) y DMF (5 mL) se pusieron en un vial de microondas y se radiaron a 160°C durante 40 minutos. La mezcla de reacción se enfrió después a temperatura ambiente y se filtró a través de una almohadilla de Celite®. El filtrado se diluyó con una disolución saturada de NaHCO₃ y se extrajo con diclorometano. La fase orgánica se secó (MgSO₄), se filtró, se

concentró y el residuo se purificó por cromatografía en columna (gel de sílice eluido con acetona al 0-10% en cloroformo). La trituración del sólido resultante con etiléter proporcionó el compuesto del título, un compuesto de esta invención, como un sólido blanco (45 mg). ¹H RMN (CDCl₃) δ: 9,26 (d, J=2,2 Hz, 1H), 9,09 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,67 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,29 (ddd, J=8,3, 2,6, 1,4 Hz, 1H), 7,92 (dt, J=8,5, 0,9 Hz, 1H), 7,48 (m, 1H), 7,31-7,41 (m, 2H), 6,15 (s, 1H), 4,31-4,41 (m, 1H), 1,33 (d, J=6,6 Hz, 6H).

Ejemplo de síntesis 4 (referencia, no reivindicado)

Preparación de 2-(3-piridinil)-N-[1-(2,2,2-trifluoroetil)]imidazo[1,2-a]piridina-6-carboxamida (compuesto 457)

Etapas A: Preparación de metiléster de ácido 2-(3-piridinil)imidazo[1,2-a]piridina-6-carboxílico

Después del procedimiento descrito en la Publicación de Solicitud de Patente de EE.UU. núm. 20110189794, a una mezcla de 6-aminonicotinato de metilo (5,0 g, 33 mmoles) en etanol (140 mL) a 60°C se añadió bicarbonato sódico sólido (5,52 g, 65,7 mmoles), seguido por sal de bromuro de hidrógeno de 3-(bromoacetil)piridina (10,16 g, 36,2 mmoles). La mezcla resultante se calentó a reflujo durante 9 horas. La mezcla de reacción se enfrió entonces, se concentró, y se añadieron disolución de bicarbonato sódico acuoso saturado (50 mL) y diclorometano (50 mL) al residuo resultante. La fase acuosa se extrajo con diclorometano (5x30 mL). Las fases orgánicas combinadas se concentraron y se purificaron por cromatografía en columna (gel de sílice eluido con acetato de etilo) para dar el compuesto del título.

Etapas B: Preparación de 2-(3-piridinil)-N-[1-(2,2,2-trifluoroetil)]imidazo[1,2-a]piridina-6-carboxamida

Una mezcla del éster preparado en la etapa A (0,4 g, 2,4 mmoles) y NaOH acuoso (1N, 7,1 mL, 7,1 mmoles) se agitó en metanol (10 mL) durante 2 horas. La mezcla de reacción se concentró entonces a presión reducida para eliminar metanol, y la disolución acuosa resultante se neutralizó con HCl 1N a pH 5 para precipitar el ácido carboxílico. El ácido carboxílico sólido se aisló por filtración, se secó y se usó directamente en la siguiente etapa sin purificación adicional.

Una mezcla del ácido carboxílico preparado anteriormente (0,31 g, 1,30 mmoles), EDC-HCl (0,27 g, 1,43 mmoles), HOBt-H₂O (0,22 g, 1,43 mmoles), y trietilamina (0,72 mL, 5,2 mmoles) en DMF (10 mL) se agitó a 40°C durante 30 minutos. Un cuarto del volumen de la mezcla de reacción se eliminó entonces, se trató con CF₃CH₂NH₂ (0,13 g, 1,3 mmoles), y se agitó a 40°C toda la noche. La mezcla de reacción se concentró entonces al vacío para eliminar DMF, y el residuo se purificó por cromatografía en columna (gel de sílice eluido con acetato de etilo:metanol:trietilamina, 8:1:1) para obtener 43,8 mg del compuesto del título, un compuesto de esta invención.

Ejemplo de síntesis 5

Preparación de 2-[[2-(3-piridinil)-2H-indazol-5-il]carbonil]hidrazinacarboxilato de metilo (compuesto 42)

Etapas A: Preparación de metiléster de ácido 4-nitro[(3-piridinilimino)metil]benzoico

Una disolución de 3-formil-4-nitrobenzoato de metilo (5 g, 25 mmoles) y 3-aminopiridina (2,7 g, 30 mmoles) en etanol (4 mL) se calentó a reflujo toda la noche. La mezcla de reacción se enfrió entonces, se concentró a presión reducida, y el sólido en bruto resultante se purificó por cromatografía en gel de sílice (eluyendo con acetato de etilo al 0-40%/hexanos) para proporcionar 4,5 g del producto del título como un sólido naranja.

Etapas B: Preparación de metiléster de ácido 2-(3-piridinil)-2H-indazol-5-carboxílico

Una disolución del producto de la etapa a (4,5 g, 16 mmoles) y azida sódica (1,2 g, 19 mmoles) en DMF (20 mL) se calentó a 90°C durante 16 horas. La mezcla de reacción se enfrió entonces a temperatura ambiente y se diluyó con agua. Las dos fases resultantes se separaron, y la fase acuosa se extrajo tres veces con diclorometano. Las fases orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de magnesio, se filtraron y se concentraron a presión reducida. El sólido en bruto resultante se purificó por cromatografía en gel de sílice (acetato de etilo al 0-30%/hexanos) para proporcionar 4,0 g del producto del título como un sólido amarillo.

Etapas C: Preparación de cloruro de 2-(3-piridinil)-2H-indazol-5-carbonilo

El metiléster preparado en la etapa B (4,1 g, 16 mmoles) se disolvió en metanol (150 mL), se añadió hidróxido sódico al 50% en agua (7,1 mL), y la mezcla de reacción se calentó a reflujo durante 4 horas. La mezcla de reacción se enfrió entonces a temperatura ambiente, y el disolvente se eliminó a presión reducida. El producto en bruto se aciduló con HCl 1N acuoso, y el precipitado resultante se aisló por filtración, se lavó con dietiléter, y se secó a presión reducida a 60°C toda la noche. El ácido carboxílico en bruto se disolvió entonces de nuevo en cloruro de tionilo (60 mL), y la mezcla de reacción se calentó a 75°C. La mezcla de reacción se enfrió entonces a temperatura ambiente y el disolvente se eliminó a presión reducida. El cloruro de carbonilo en bruto se usó en la siguiente etapa sin purificación adicional.

Etapa D: Preparación de 2-[[2-(3-piridinil)-2H-indazol-5-il]carbonil]hidrazinacarboxilato de metilo

El cloruro de acilo preparado en la etapa C (200 mg, 0,836 mmoles) se combinó con hidrazinocarboxilato de metilo (82 mg, 0,91 mmoles) en diclorometano (5 mL). La mezcla de reacción se enfrió a 0°C, y se añadió trietilamina (360 µl, 2,51 mmoles) en gotas. La reacción se calentó a temperatura ambiente y se dejó agitar toda la noche. La mezcla de reacción se enfrió entonces y se desactivó con disolución de bicarbonato sódico acuoso saturado. Las dos fases se separaron, y la fase acuosa se extrajo tres veces con diclorometano. Las fases orgánicas combinadas se secaron sobres sulfato de magnesio, se filtraron, y se concentraron a presión reducida. El sólido en bruto resultante se purificó por cromatografía en gel de sílice (acetato de etilo al 20-80%/hexanos) para proporcionar el compuesto del título, un compuesto de esta invención, como un sólido blanco.

10 Ejemplo de síntesis 6 (referencia, no reivindicado)

Preparación de 2-(3-piridinil)-N-[(tetrahidro-2-furanil)metil]pirazolo[1,5-a]piridina-5-carboxamida (compuesto 467)

Etapa A: Preparación de 3-(dimetoximetil)-5-(3-piridinil)-1H-pirazol

Se añadió hexametildisilano de litio (55 mL de una disolución 1,0M en tetrahidrofurano, 55 mmoles) a una disolución de 3-acetilpiridina (5,5 mL, 50 mmoles), dimetoxiacetato de metilo (6,7 mL, 55 mmoles) y tetrahidrofurano anhidro (100 mL) con enfriamiento a -45°C. La mezcla de reacción resultante se dejó calentar a 25°C durante 1 hora, y se agitó a esta temperatura durante 3 horas. La mezcla de reacción se concentró entonces a presión reducida, y el residuo se suspendió en metanol (50 mL) y se concentró a presión reducida. El residuo resultante se suspendió en metanol (150 mL) y se trató con monohidrato de hidracina (2,62 mL, 55 mmoles) y ácido acético glacial (6,29 mL, 110 mmoles), y la mezcla de reacción se calentó a reflujo durante 14 horas. La mezcla de reacción resultante se enfrió a 25°C y se concentró a presión reducida. El residuo se repartió entre acetato de etilo (200 mL) y disolución de hidróxido sódico acuoso 1N (100 mL). Las fases se separaron, y la fase orgánica se lavó sucesivamente con disolución de hidróxido sódico acuoso 1N (50 mL) y salmuera (50 mL), se secó sobre sulfato de magnesio anhidro, y se concentró a presión reducida para proporcionar 8,83 g del compuesto del título como un sólido beis.

¹H RMN (CDCl₃): δ 10,5 (br s, 1H), 9,03 (d, 1H), 8,57 (dd, 1H), 8,09 (dt, 1H), 7,34 (dd, 1H), 6,65 (s, 1H), 5,63 (s, 1H), 3,39 (s, 6H).

Etapa B: Preparación de 5-(3-piridinil)-1H-pirazol-3-carboxaldehído

A una disolución del producto de la etapa A (715 mg, 3,3 mmoles) y cloroformo (5 mL) se añadió una disolución de ácido trifluoroacético (2,5 mL) y agua (2,5 mL); la temperatura de la mezcla de reacción se mantuvo por debajo de 5°C con un baño de agua helada. La mezcla de reacción se agitó después a 0-5°C durante 2 horas, se trató con trietilamina (5 mL) a 0°C, se agitó durante 15 minutos, se trató con agua (10 mL), y se filtró para aislar un sólido marrón. Este sólido se lavó con cloroformo (20 mL) y agua (20 mL) y se secó al aire para dar 605 mg del compuesto del título como un sólido beis claro que se usó en la siguiente etapa sin purificación adicional.

Etapa C: Preparación de etiléster de ácido 2-(3-piridinil)pirazolo[1,5-a]piridina-5-carboxílico

Una mezcla del producto de la etapa B (596 mg, 3,4 mmoles), etil-4-bromocrotonato (75%, 0,95 mL, 5,2 mmoles), carbonato de potasio anhidro (1,42 g, 10,3 mmoles) y N,N-dimetilformamida anhidra (17 mL) se agitó a 25°C durante 14 horas. La mezcla de reacción se repartió entonces entre acetato de etilo y disolución de cloruro de amonio acuoso saturado, y la fase orgánica se separó, se lavó con agua (3X), salmuera, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro, y se concentró a presión reducida para dar un producto en bruto. Este producto resultante se purificó por MPLC en una columna de sílice 24 g eluyendo con acetato de etilo de 0 a 100% en hexanos para dar el compuesto del título como un sólido beis claro (105 mg).

¹H RMN (CDCl₃): δ 9,20 (d, 1H), 8,63 (dd, 1H), 8,50 (d, 1H), 8,33 (d, 1H), 8,27 (dt, 1H), 7,43-7,35 (m, 2H), 7,05 (s, 1H), 4,43 (q, 2H), 1,44 (t, 3H).

Etapa D: Preparación de 2-(3-piridinil)-N-[(tetrahidro-2-furanil)metil]pirazolo[1,5-a]piridina-5-carboxamida

A una disolución del producto de la etapa C (31 mg, 0,11 mmoles), tetrahidrofurfurilamina (0,12 mL, 1,2 mmoles) y tolueno anhidro (2,3 mL) se añadió trimetilaluminio (0,6 mL de una disolución 2,0M en tolueno, 1,2 mmoles). La disolución resultante se agitó durante 2 horas a 25°C, durante 2 horas a 80°C, y después se enfrió a 0°C y se trató cuidadosamente con agua (3 mL). La mezcla de reacción resultante se agitó a 25°C durante 15 minutos, se trató con una disolución acuosa saturada de tartrato de sodio y potasio (2 mL), se agitó durante 30 minutos, y después se repartió entre diclorometano y agua. La fase orgánica se separó, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro, y se concentró a presión reducida para aislar un residuo marrón que se trituró con dietiléter para proporcionar el compuesto del título, un compuesto de esta invención, como un sólido beis (15 mg).

¹H RMN (CDCl₃): δ 9,19 (d, 1H), 8,63 (dd, 1H), 8,51 (d, 1H), 8,26 (dt, 1H), 8,03 (s, 1H), 7,39 (dd, 1H), 7,16 (dd, 1H), 7,00 (s, 1H), 6,60 (br s, 1H), 4,10 (qd, 1H), 3,93 (dt, 1H), 3,89-3,76 (m, 2H), 3,38-3,29 (m, 1H), 2,11-2,02 (m, 1H), 2,00-1,83 (m, 3H).

Mediante los procedimientos descritos en la presente memoria junto con métodos conocidos en la técnica, los siguientes compuestos de las Tablas 1 a 24d pueden prepararse. Las siguientes abreviaturas se usan en las Tablas que siguen: t significa terciario, s significa secundario, i significa iso, c significa ciclo, Me significa metilo, Et significa etilo, Pr significa propilo, Bu significa butilo, Ph significa fenilo, OMe significa metoxi, OEt significa etoxi, SME significa metiltio, Set significa etiltio, -CN significa ciano, Ph significa fenilo, Py significa piridinilo, -NO₂ significa nitro, S(O)Me significa metilsulfinilo, y S(O)₂Me significa metilsulfonilo.

5

Un “-“ al comienzo de una definición de fragmento indica el punto de unión de dicho fragmento al resto de la molécula; por ejemplo, “-CH₂CH₂OMe” indica el fragmento 2-metoxietilo. Los fragmentos cíclicos se representan por el uso de dos “-“ entre paréntesis; por ejemplo, el fragmento 1-pirrolidinilo se representa por “N(-CH₂CH₂CH₂CH₂-)”, en el que un átomo de nitrógeno está unido a ambos átomos de carbono terminales de la cadena de cuatro carbonos, como se ilustra a continuación.

10

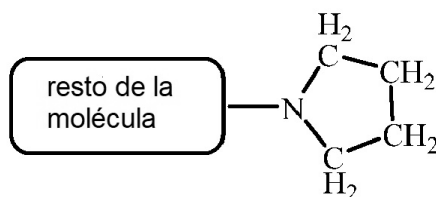
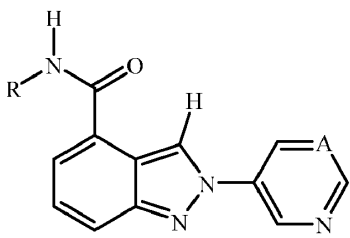
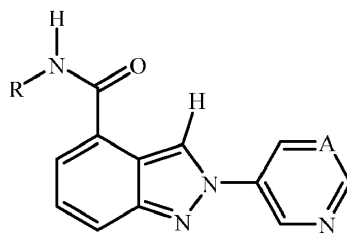


Tabla 1a

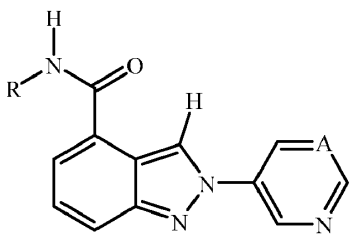
A es CH		
R	R	R
Me	Et	Pr
i-Pr	-CH ₂ (c-Pr)	-CH(Me)(c-Pr)
Bu	s-Bu	i-Bu
t-Bu	-CH ₂ Ph	-CH ₂ CH=CH ₂
-CH ₂ C≡CH	-C(Me) ₂ C≡CH	-CH ₂ CH ₂ F
-CH ₂ CHF ₂	-CH ₂ CF ₃	-CH(Me)CF ₃
-CH ₂ CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CF ₂ CF ₃	-CH ₂ CF ₂ CH ₃
-CH ₂ CH ₂ CF ₂ CF ₃	-CH(i-Pr)CF ₃	-CH ₂ CH ₂ OMe
-CH ₂ OEt	-CH ₂ CH ₂ O(i-Pr)	-CH ₂ CH ₂ OEt
-CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	-CH ₂ CH(Me)OMe	-CH(Et)CH ₂ OMe
-CH(Me)CH ₂ OMe	-CH ₂ CH ₂ S(O)Me	-CH ₂ CH ₂ SMe
-CH ₂ CH ₂ SEt	-CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	-CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et
-CH ₂ CH ₂ S(O)Et	-CH ₂ CH ₂ S(O)(t-Bu)	-CH ₂ CH ₂ S(t-Bu)
-CH(Me)CH ₂ SMe	-CH ₂ CH ₂ SO ₂ (t-Bu)	-CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me
-CH(Me)CH ₂ S(O)Me	-CH ₂ CH ₂ S(O)CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CF ₃
-CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₂ CF ₃
-CH ₂ CH ₂ S(O)CH ₂ CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CN	-CH ₂ CH ₂ CN

		
-C(Me) ₂ CN	-CH ₂ CH ₂ N(i-Pr) ₂	-CH ₂ CH ₂ N(Me) ₂
-CH ₂ CH(OMe) ₂	c-Pr	c-Bu
1-metilciclopropilo	3-metoxiciclobutilo	-CH(Ph)(c-Pr)
-CH(Me)(c-Pr)	3-tietanilo	3,3-difluorociclobutilo
3-oxetanilo	-CH ₂ (oxiranilo)	3-tietanil-1,1-dióxido
3-tietanil-1-óxido	-CH ₂ (CH(-OC(Me) ₂ OCH ₂ -))	-CH ₂ (tetrahidro-2-furanilo)
-CH ₂ (2-furanilo)	tetrahidro-2-furanilo	-CH ₂ (2-tienilo)
-CH ₂ (CH(-OCH ₂ CH ₂ O-))	-CH ₂ CO ₂ Me	-CH ₂ (2,2-difluorociclopropilo)
-C(-CH ₂ CH ₂ -)CO ₂ Me	-CH(Me)CO ₂ Et	-CH(i-Pr)CO ₂ Me
-CH ₂ C(O)NHMe	-CH ₂ C(O)NMe ₂	-CH(Me)C(O)NHMe
-CH(Me)C(O)NH(t-Bu)	-OCH ₂ (c-Pr)	-CH(Me)C(O)NMe ₂
-OCH ₂ CH=CH ₂	-NHC(O)(i-Pr)	-NHC(O)Me
-NHCO ₂ Me	-NHC(O)(3-piridinilo)	-NHC(O)(t-Bu)
-NHC(O)Ph	-NH(c-hexilo)	-NHC(O)NH(i-Pr)
-NH(c-Pr)	-NHC(O)(2-tienilo)	-NH(CH ₂ CF ₃)
-NHC(O)CF ₃	-NHCO ₂ Et	-NHC(O)(2-furanilo)
-C(O)C(O)Me	-NHCO ₂ CH ₂ CF ₃	-C(O)CO ₂ Me
-C(O)(2-piridinilo)	-NHC(O)NMe ₂	-NHC(O)NHMe
-NHC(O)NHCH ₂ CF ₃	-NHC(O)CH ₂ CH ₂ CF ₃	-NHC(O)Et
-NHC(O)CH ₂ CF ₃	-NHCO ₂ CF ₃	-NHCO ₂ CH ₂ CF ₃
-NHCO ₂ CH ₂ CH ₂ CF ₃	-NH(2-piridinilo)	-NH(3-piridinilo)
-NH(4-piridinilo)	-NH(2-pirimidinilo)	-NH(4-pirimidinilo)
-NH(5-pirimidinilo)	-NH(6-CF ₃ -2-pirimidinilo)	-NH(4-CF ₃ -2-piridinilo)
-NH(3-CF ₃ -2-piridinilo)	-NH(5-CF ₃ -2-pirimidinilo)	-NH(5-CF ₃ -2-piridinilo)
-NH(4-CF ₃ -2-pirimidinilo)	-NH(6-metil-2-piridinilo)	-NH(4-metil-2-piridinilo)
-NH(3-metil-2-piridinilo)	-NH(5-metil-2-pirimidinilo)	-NH(5-metil-2-piridinilo)
-NH(4-metil-2-pirimidinilo)	-NH(6-metoxi-2-piridinilo)	-NH(4-metoxi-2-piridinilo)
-NH(3-metoxi-2-piridinilo)	-NH(5-metoxi-2-pirimidinilo)	-NH(5-metoxi-2-piridinilo)
-NH(4-metoxi-2-pirimidinilo)	-CH ₂ (6-CF ₃ -2-piridinilo)	-CH ₂ (4-CF ₃ -2-piridinilo)
-CH ₂ (3-CF ₃ -2-piridinilo)	-CH ₂ (5-CF ₃ -2-pirimidinilo)	-CH ₂ (5-CF ₃ -2-piridinilo)
-CH ₂ (4-CF ₃ -2-pirimidinilo)	-CH ₂ (6-metil-2-piridinilo)	-CH ₂ (4-metil-2-piridinilo)
-CH ₂ (3-metil-2-piridinilo)	-CH ₂ (5-metil-2-pirimidinilo)	-CH ₂ (5-metil-2-piridinilo)

		
-CH ₂ (4-metil-2-pirimidinilo)	-CH ₂ (6-metoxi-2-piridinilo)	-CH ₂ (4-metoxi-2-piridinilo)
-CH ₂ (3-metoxi-2-piridinilo)	-CH ₂ (5-metoxi-2-pirimidinilo)	-CH ₂ (5-metoxi- 2-piridinilo)
-CH ₂ (4-metoxi-2 –pirimidinilo)	-CH ₂ (5-pirimidinilo)	-CH ₂ (6-bromo-2-piridinilo)
-CH ₂ (2-pirimidinilo)	-CH ₂ (3-(OCF ₃)fenilo)	-CH ₂ (2-tiazolilo)
-CH ₂ (5-metil-2-pirazinilo)	-CH ₂ (4-piridinilo)	-CH ₂ (2-piridinilo)
Ph	3-piridinilo	-CH ₂ (3-piridinilo)
2-piridinilo	2-pirazinilo	-CH ₂ CH ₂ (2-piridinilo)
4-piridinilo	4-CF ₃ -2-piridinilo	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ (2-piridinilo)
3-CF ₃ -2-piridinilo	4-CF ₃ -2-pirimidinilo	6-CF ₃ -2-piridinilo
5-CF ₃ -2-piridinilo	5-CF ₃ -2-pirazinilo	5-CF ₃ -2-pirimidinilo
-CH ₂ CH ₂ N-(C(O)CH ₂ CH ₂ C(O)-)	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ (1-imidazolilo)	-CH-(C(O)OCH ₂ CH ₂ -)
-CH ₂ (4-pirimidinilo)	Piridazinilo	6-CF ₃ -3-pirazinilo
A es CF		
R	R	R
Me	Et	Pr
i-Pr	-CH ₂ (c-Pr)	-CH(Me)(c-Pr)
Bu	s-Bu	i-Bu
t-Bu	-CH ₂ Ph	-CH ₂ CH=CH ₂
-CH ₂ C≡CH	-C(Me) ₂ C≡CH	-CH ₂ CH ₂ F
-CH ₂ CHF ₂	-CH ₂ CF ₃	-CH(Me)CF ₃
-CH ₂ CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CF ₂ CF ₃	-CH ₂ CF ₂ CH ₃
-CH ₂ CH ₂ CF ₂ CF ₃	-CH(i-Pr)CF ₃	-CH ₂ CH ₂ OMe
-CH ₂ OEt	-CH ₂ CH ₂ O(i-Pr)	-CH ₂ CH ₂ OEt
-CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	-CH ₂ CH(Me)OMe	-CH(Et)CH ₂ OMe
-CH(Me)CH ₂ OMe	-CH ₂ CH ₂ S(O)Me	-CH ₂ CH ₂ SMe
-CH ₂ CH ₂ SEt	-CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	-CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et
-CH ₂ CH ₂ S(O)Et	-CH ₂ CH ₂ S(O)(t-Bu)	-CH ₂ CH ₂ S(t-Bu)
-CH(Me)CH ₂ SMe	-CH ₂ CH ₂ SO ₂ (t-Bu)	-CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me
-CH(Me)CH ₂ S(O)Me	-CH ₂ CH ₂ S(O)CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CF ₃
-CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₂ CF ₃
-CH ₂ CH ₂ S(O)CH ₂ CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CN	-CH ₂ CH ₂ CN
-C(Me) ₂ CN	-CH ₂ CH ₂ N(i-Pr) ₂	-CH ₂ CH ₂ N(Me) ₂



-CH ₂ CH(OMe) ₂	c-Pr	c-Bu
1 -metilciclopropilo	3-metoxiciclobutilo	-CH(Ph)(c-Pr)
-CH(Me)(c-Pr)	3-tietanilo	3,3-difluorociclobutilo
3-oxetanilo	-CH ₂ (oxiranilo)	3-tietanilo-1,1-dióxido
3-tietanilo-1-óxido	-CH ₂ (CH(-OC(Me) ₂ OCH ₂ -))	-CH ₂ (tetrahidro-2-furanilo)
-CH ₂ (2-furanilo)	tetrahidro-2-furanilo	-CH ₂ (2-tienilo)
-CH ₂ (CH(-OCH ₂ CH ₂ O-))	-CH ₂ CO ₂ Me	-CH ₂ (2,2-difluorociclopropilo)
-C(-CH ₂ CH ₂ -)CO ₂ Me	-CH(Me)CO ₂ Et	-CH(i-Pr)CO ₂ Me
-CH ₂ C(O)NHMe	-CH ₂ C(O)NMe ₂	-CH(Me)C(O)NHMe
-CH(Me)C(O)NH(t-Bu)	-OCH ₂ (c-Pr)	-CH(Me)C(O)NMe ₂
-OCH ₂ CH=CH ₂	-NHC(O)(i-Pr)	-NHC(O)Me
-NHCO ₂ Me	-NHC(O)(3-piridinilo)	-NHC(O)(t-Bu)
-NHC(O)Ph	-NH(c-hexilo)	-NHC(O)NH(i-Pr)
-NH(c-Pr)	-NHC(O)(2-tienilo)	-NH(CH ₂ CF ₃)
-NHC(O)CF ₃	-NHCO ₂ Et	-NHC(O)(2-furanilo)
-C(O)C(O)Me	-NHCO ₂ CH ₂ CF ₃	-C(O)CO ₂ Me
-C(O)(2-piridinilo)	-NHC(O)NMe ₂	-NHC(O)NHMe
-NHC(O)NHCH ₂ CF ₃	-NHC(O)CH ₂ CH ₂ CF ₃	-NHC(O)Et
-NHC(O)CH ₂ CF ₃	-NHCO ₂ CF ₃	-NHCO ₂ CH ₂ CF ₃
-NHCO ₂ CH ₂ CH ₂ CF ₃	-NH(2-piridinilo)	-NH(3-piridinilo)
-NH(4-piridinilo)	-NH(2-pirimidinilo)	-NH(4-pirimidinilo)
-NH(5-pirimidinilo)	-NH(6-CF ₃ -2-piridinilo)	-NH(4-CF ₃ -2-piridinilo)
-NH(3-CF ₃ -2-piridinilo)	-NH(5-CF ₃ -2-pirimidinilo)	-NH(5-CF ₃ -2-piridinilo)
-NH(4-CF ₃ -2-pirimidinilo)	-NH(6-metil-2-piridinilo)	-NH(4-metil-2-piridinilo)
-NH(3-metil-2-piridinilo)	-NH(5-metil-2-pirimidinilo)	-NH(5-metil-2-piridinilo)
-NH(4-metil-2-pirimidinilo)	-NH(6-metoxi-2-piridinilo)	-NH(4-metoxi-2-piridinilo)
-NH(3-metoxi-2-piridinilo)	-NH(5-metoxi-2-pirimidinilo)	-NH(5-metoxi-2-piridinilo)
-NH(4-metoxi-2-pirimidinilo)	-CH ₂ (6-CF ₃ -2-piridinilo)	-CH ₂ (4-CF ₃ -2-piridinilo)
-CH ₂ (3-CF ₃ -2-piridinilo)	-CH ₂ (5-CF ₃ -2-pirimidinilo)	-CH ₂ (5-CF ₃ -2-piridinilo)
-CH ₂ (4-CF ₃ -2-pirimidinilo)	-CH ₂ (6-metil-2-piridinilo)	-CH ₂ (4-metil-2-piridinilo)
-CH ₂ (3-metil-2-piridinilo)	-CH ₂ (5-metil-2-pirimidinilo)	-CH ₂ (5-metil-2-piridinilo)
-CH ₂ (4-metil-2-pirimidinilo)	-CH ₂ (6-metoxi-2-piridinilo)	-CH ₂ (4-metoxi-2-piridinilo)

		
-CH ₂ (3-metoxi-2-piridinilo)	-CH ₂ (5-metoxi- 2-pirimidinilo)	-CH ₂ (5-metoxi- 2-piridinilo)
-CH ₂ (4-metoxi-2-pirimidinilo)	-CH ₂ (5-pirimidinilo)	-CH ₂ (6-bromo-2-piridinilo)
-CH ₂ (2-pirimidinilo)	-CH ₂ (3-(OCF ₃)fenilo)	-CH ₂ (2-tiazolilo)
-CH ₂ (5-metil-2-pirazinilo)	-CH ₂ (4-piridinilo)	-CH ₂ (2-piridinilo)
Ph	3-piridinilo	-CH ₂ (3-piridinilo)
2-piridinilo	2-pirazinilo	-CH ₂ CH ₂ (2-piridinilo)
4-piridinilo	4-CF ₃ -2-piridinilo	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ (2-piridinilo)
3-CF ₃ -2-piridinilo	4-CF ₃ -2-pirimidinilo	6-CF ₃ -2-piridinilo
5-CF ₃ -2-piridinilo	5-CF ₃ -2-pirazinilo	5-CF ₃ -2-pirimidinilo
-CH ₂ CH ₂ N-(C(O)CH ₂ CH ₂ C(O)-)	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ (1-imidazolilo)	-CH-(C(O)OCH ₂ CH ₂ -)
-CH ₂ (4 -pirimidinilo)	piridazinilo	6-CF ₃ -3-pirazinilo
A es N		
R	R	R
Me	Et	Pr
i-Pr	-CH ₂ (c-Pr)	-CH(Me)(c-Pr)
Bu	s-Bu	i-Bu
t-Bu	-CH ₂ Ph	-CH ₂ CH=CH ₂
-CH ₂ C≡CH	-C(Me) ₂ C≡CH	-CH ₂ CH ₂ F
-CH ₂ CHF ₂	-CH ₂ CF ₃	-CH(Me)CF ₃
-CH ₂ CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CF ₂ CF ₃	-CH ₂ CF ₂ CH ₃
-CH ₂ CH ₂ CF ₂ CF ₃	-CH(i-Pr)CF ₃	-CH ₂ CH ₂ OMe
-CH ₂ OEt	-CH ₂ CH ₂ O(i-Pr)	-CH ₂ CH ₂ OEt
-CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	-CH ₂ CH(Me)OMe	-CH(Et)CH ₂ OMe
-CH(Me)CH ₂ OMe	-CH ₂ CH ₂ S(O)Me	-CH ₂ CH ₂ SMe
-CH ₂ CH ₂ SEt	-CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	-CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et
-CH ₂ CH ₂ S(O)Et	-CH ₂ CH ₂ S(O)(t-Bu)	-CH ₂ CH ₂ S(t-Bu)
-CH(Me)CH ₂ SMe	-CH ₂ CH ₂ SO ₂ (t-Bu)	-CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me
-CH(Me)CH ₂ S(O)Me	-CH ₂ CH ₂ S(O)CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CF ₃
-CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₂ CF ₃
-CH ₂ CH ₂ S(O)CH ₂ CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CN	-CH ₂ CH ₂ CN
-C(Me) ₂ CN	-CH ₂ CH ₂ N(i-Pr) ₂	-CH ₂ CH ₂ N(Me) ₂
-CH ₂ CH(OMe) ₂	c-Pr	c-Bu

		
1 -metilciclopropilo	3-metoxiciclobutilo	-CH(Ph)(c-Pr)
-CH(Me)(c-Pr)	3-tietanilo	3,3-difluorociclobutilo
3-oxetanilo	-CH ₂ (oxiranilo)	3-tietanil-1,1-dióxido
3-tietanil-1-óxido	-CH ₂ (CH(-OC(Me) ₂ OCH ₂ -))	-CH ₂ (tetrahidro-2-furanilo)
-CH ₂ (2-furanilo)	tetrahidro-2-furanilo	-CH ₂ (2-tienilo)
-CH ₂ (CH(-OCH ₂ CH ₂ O-))	-CH ₂ CO ₂ Me	-CH ₂ (2,2-difluorociclopropilo)
-C(-CH ₂ CH ₂ -)CO ₂ Me	-CH(Me)CO ₂ Et	-CH(i-Pr)CO ₂ Me
-CH ₂ C(O)NHMe	-CH ₂ C(O)NMe ₂	-CH(Me)C(O)NHMe
-CH(Me)C(O)NH(t-Bu)	-OCH ₂ (c-Pr)	-CH(Me)C(O)NMe ₂
-OCH ₂ CH=CH ₂	-NHC(O)(i-Pr)	-NHC(O)Me
-NHCO ₂ Me	-NHC(O)(3-piridinilo)	-NHC(O)(t-Bu)
-NHC(O)Ph	-NH(c-hexilo)	-NHC(O)NH(i-Pr)
-NH(c-Pr)	-NHC(O)(2-tienilo)	-NH(CH ₂ CF ₃)
-NHC(O)CF ₃	-NHCO ₂ Et	-NHC(O)(2-furanilo)
-C(O)C(O)Me	-NHCO ₂ CH ₂ CF ₃	-C(O)CO ₂ Me
-C(O)(2-piridinilo)	-NHC(O)NMe ₂	-NHC(O)NHMe
-NHC(O)NHCH ₂ CF ₃	-NHC(O)CH ₂ CH ₂ CF ₃	-NHC(O)Et
-NHC(O)CH ₂ CF ₃	-NHSO ₂ CF ₃	-NHSO ₂ CH ₂ CF ₃
-NHSO ₂ CH ₂ CH ₂ CF ₃	-NH(2-piridinilo)	-NH(3-piridinilo)
-NH(4-piridinilo)	-NH(2-pirimidinilo)	-NH(4-pirimidinilo)
-NH(5-pirimidinilo)	-NH(6-CF ₃ -2-piridinilo)	-NH(4-CF ₃ -2-piridinilo)
-NH(3-CF ₃ -2-piridinilo)	-NH(5-CF ₃ -2-pirimidinilo)	-NH(5-CF ₃ -2-piridinilo)
-NH(4-CF ₃ -2-pirimidinilo)	-NH(6-metil-2-piridinilo)	-NH(4-metil-2-piridinilo)
-NH(3-metil-2-piridinilo)	-NH(5-metil-2-pirimidinilo)	-NH(5-metil-2-piridinilo)
-NH(4-metil-2-pirimidinilo)	-NH(6-metoxi-2-piridinilo)	-NH(4-metoxi-2-piridinilo)
-NH(3-metoxi-2-piridinilo)	-NH(5-metoxi-2-pirimidinilo)	-NH(5-metoxi-2-piridinilo)
-NH(4-metoxi-2-pirimidinilo)	-CH ₂ (6-CF ₃ -2-piridinilo)	-CH ₂ (4-CF ₃ -2-piridinilo)
-CH ₂ (3-CF ₃ -2-piridinilo)	-CH ₂ (5-CF ₃ -2-pirimidinilo)	-CH ₂ (5-CF ₃ -2-piridinilo)
-CH ₂ (4-CF ₃ -2-pirimidinilo)	-CH ₂ (6-metil-2-piridinilo)	-CH ₂ (4-metil-2-piridinilo)
-CH ₂ (3-metil-2-piridinilo)	-CH ₂ (5-metil-2-pirimidinilo)	-CH ₂ (5-metil-2-piridinilo)
-CH ₂ (4-metil-2-pirimidinilo)	-CH ₂ (6-metoxi-2-piridinilo)	-CH ₂ (4-metoxi-2-piridinilo)
-CH ₂ (3-metoxi-2-piridinilo)	-CH ₂ (5-metoxi-2-pirimidinilo)	-CH ₂ (5-metoxi-2-piridinilo)

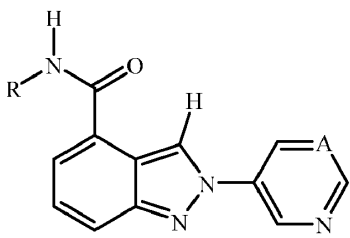
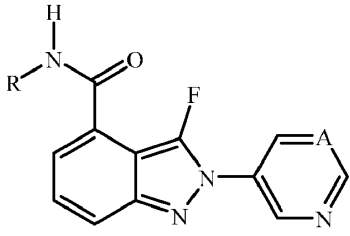
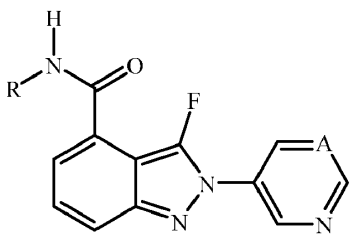
		
-CH ₂ (4-metoxi-2-pirimidinilo)	-CH ₂ (5-pirimidinilo)	-CH ₂ (6-bromo-2-piridinilo)
-CH ₂ (2-piridinilo)	-CH ₂ (3-(OCF ₃)fenilo)	-CH ₂ (2-tiazolilo)
-CH ₂ (5-metil-2-pirazinilo)	-CH ₂ (4-piridinilo)	-CH ₂ (2-piridinilo)
Ph	3-piridinilo	-CH ₂ (3-piridinilo)
2-piridinilo	2-pirazinilo	-CH ₂ CH ₂ (2-piridinilo)
4-piridinilo	4-CF ₃ -2-piridinilo	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ (2-piridinilo)
3-CF ₃ -2-piridinilo	4-CF ₃ -2-pirimidinilo	6-CF ₃ -2-piridinilo
5-CF ₃ -2-piridinilo	5-CF ₃ -2-pirazinilo	5-CF ₃ -2-pirimidinilo
-CH ₂ CH ₂ N-(C(O)CH ₂ CH ₂ C(O)-)	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ (1-imidazolilo)	-CH-(C(O)OCH ₂ CH ₂ -)
-CH ₂ (4-pirimidinilo)	piridazinilo	6-CF ₃ -3-pirazinilo

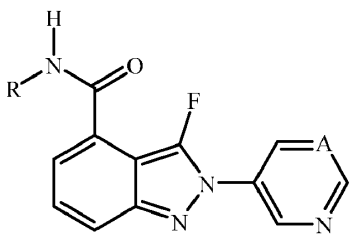
Tabla 1b

		
A es CH		
R	R	R
Me	Et	Pr
i-Pr	-CH ₂ (c-Pr)	-CH(Me)(c-Pr)
Bu	s-Bu	i-Bu
t-Bu	-CH ₂ Ph	-CH ₂ CH=CH ₂
-CH ₂ C≡CH	-C(Me) ₂ C≡CH	-CH ₂ CH ₂ F
-CH ₂ CHF ₂	-CH ₂ CF ₃	-CH(Me)CF ₃
-CH ₂ CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CF ₂ CF ₃	-CH ₂ CF ₂ CH ₃
-CH ₂ CH ₂ CF ₂ CF ₃	-CH(i-Pr)CF ₃	-CH ₂ CH ₂ OMe
-CH ₂ OEt	-CH ₂ CH ₂ O(i-Pr)	-CH ₂ CH ₂ OEt
-CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	-CH ₂ CH(Me)OMe	-CH(Et)CH ₂ OMe
-CH(Me)CH ₂ OMe	-CH ₂ CH ₂ S(O)Me	-CH ₂ CH ₂ SMe
-CH ₂ CH ₂ SEt	-CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	-CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et
-CH ₂ CH ₂ S(O)Et	-CH ₂ CH ₂ S(O)(t-Bu)	-CH ₂ CH ₂ S(t-Bu)

		
-CH(Me)CH ₂ SMe	-CH ₂ CH ₂ SO ₂ (t-Bu)	-CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me
-CH(Me)CH ₂ S(O)Me	-CH ₂ CH ₂ S(O)CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CF ₃
-CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₂ CF ₃
-CH ₂ CH ₂ S(O)CH ₂ CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CN	-CH ₂ CH ₂ CN
-C(Me) ₂ CN	-CH ₂ CH ₂ N(i-Pr) ₂	-CH ₂ CH ₂ N(Me) ₂
-CH ₂ CH(OMe) ₂	c-Pr	c-Bu
1 -metilciclopropilo	3-metoxiciclobutilo	-CH(Ph)(c-Pr)
-CH(Me)(c-Pr)	3-tietanilo	3,3-difluorociclobutilo
3-oxetanilo	-CH ₂ (oxiranilo)	3-tietanil-1,1-dióxido
3-tietanil-1-óxido	-CH ₂ (CH(-OC(Me) ₂ OCH ₂ -))	-CH ₂ (tetrahidro-2-furanilo)
-CH ₂ (2-furanilo)	tetrahidro-2-furanilo	-CH ₂ (2-tienilo)
-CH ₂ (CH(-OCH ₂ CH ₂ O-))	-CH ₂ CO ₂ Me	-CH ₂ (2,2-difluorociclopropilo)
-C(-CH ₂ CH ₂ -)CO ₂ Me	-CH(Me)CO ₂ Et	-CH(i-Pr)CO ₂ Me
-CH ₂ C(O)NHMe	-CH ₂ C(O)NMe ₂	-CH(Me)C(O)NHMe
-CH(Me)C(O)NH(t-Bu)	-OCH ₂ (c-Pr)	-CH(Me)C(O)NMe ₂
-OCH ₂ CH=CH ₂	-NHC(O)(i-Pr)	-NHC(O)Me
-NHCO ₂ Me	-NHC(O)(3-piridinilo)	-NHC(O)(t-Bu)
-NHC(O)Ph	-NH(c-hexilo)	-NHC(O)NH(i-Pr)
-NH(c-Pr)	-NHC(O)(2-tienilo)	-NH(CH ₂ CF ₃)
-NHC(O)CF ₃	-NHCO ₂ Et	-NHC(O)(2-furanilo)
-C(O)C(O)Me	-NHCO ₂ CH ₂ CF ₃	-C(O)CO ₂ Me
-C(O)(2-piridinilo)	-NHC(O)NMe ₂	-NHC(O)NHMe
-NHC(O)NHCH ₂ CF ₃	-NHC(O)CH ₂ CH ₂ CF ₃	-NHC(O)Et
-NHC(O)CH ₂ CF ₃	-NHSO ₂ CF ₃	-NHSO ₂ CH ₂ CF ₃
-NHSO ₂ CH ₂ CH ₂ CF ₃	-NH(2-piridinilo)	-NH(3-piridinilo)
-NH(4-piridinilo)	-NH(2-pirimidinilo)	-NH(4-pirimidinilo)
-NH(5-pirimidinilo)	-NH(6-CF ₃ -2-piridinilo)	-NH(4-CF ₃ -2-piridinilo)
-NH(3-CF ₃ -2-piridinilo)	-NH(5-CF ₃ -2-pirimidinilo)	-NH(5-CF ₃ -2-piridinilo)
-NH(4-CF ₃ -2-pirimidinilo)	-NH(6-metil-2-piridinilo)	-NH(4-metil-2-piridinilo)
-NH(3-metil- 2-piridinilo)	-NH(5-metil-2-pirimidinilo)	-NH(5-metil-2-piridinilo)
-NH(4-metil-2-pirimidinilo)	-NH(6-metoxi-2-piridinilo)	-NH(4-metoxi-2-piridinilo)

		
-NH(3 -metoxi-2-piridinilo)	-NH(5-metoxi-2-pirimidinilo)	-NH(5-metoxi-2-piridinilo)
-NH(4-metoxi-2-pirimidinilo)	-CH ₂ (6-CF ₃ -2-piridinilo)	-CH ₂ (4-CF ₃ -2-piridinilo)
-CH ₂ (3-CF ₃ -2-piridinilo)	-CH ₂ (5-CF ₃ -2-pirimidinilo)	-CH ₂ (5-CF ₃ -2-piridinilo)
-CH ₂ (4-CF ₃ -2-pirimidinilo)	-CH ₂ (6-metil-2-piridinilo)	-CH ₂ (4-metil-2-piridinilo)
-CH ₂ (3-metil-2-piridinilo)	-CH ₂ (5-metil-2-pirimidinilo)	-CH ₂ (5-metil-2-piridinilo)
-CH ₂ (4-metil-2-pirimidinilo)	-CH ₂ (6-metoxi-2-piridinilo)	-CH ₂ (4-metoxi-2-piridinilo)
-CH ₂ (3-metoxi-2-piridinilo)	-CH ₂ (5-metoxi-2-pirimidinilo)	-CH ₂ (5-metoxi-2-piridinilo)
-CH ₂ (4-metoxi-2-pirimidinilo)	-CH ₂ (5-pirimidinilo)	-CH ₂ (6-bromo-2-piridinilo)
-CH ₂ (2-pirimidinilo)	-CH ₂ (3-(OCF ₃)fenilo)	-CH ₂ (2-tiazolilo)
-CH ₂ (5-metil-2-pirazinilo)	-CH ₂ (4-piridinilo)	-CH ₂ (2-piridinilo)
Ph	3-piridinilo	-CH ₂ (3-piridinilo)
2-piridinilo	2-pirazinilo	-CH ₂ CH ₂ (2-piridinilo)
4-piridinilo	4-CF ₃ -2-piridinilo	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ (2-piridinilo)
3-CF ₃ -2-piridinilo	4-CF ₃ -2-pirimidinilo	6-CF ₃ -2-piridinilo
5-CF ₃ -2-piridinilo	5-CF ₃ -2-pirazinilo	5-CF ₃ -2-pirimidinilo
-CH ₂ CH ₂ N(-C(O)CH ₂ CH ₂ C(O)-)	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ (1-imidazolilo)	-CH(-C(O)OCH ₂ CH ₂ -)
-CH ₂ (4-pirimidinilo)	piridazinilo	6-CF ₃ -3-pirazinilo
A es CF		
R	R	R
Me	Et	Pr
i-Pr	-CH ₂ (c-Pr)	-CH(Me)(c-Pr)
Bu	s-Bu	i-Bu
t-Bu	-CH ₂ Ph	-CH ₂ CH=CH ₂
-CH ₂ C=CH	-C(Me) ₂ C≡CH	-CH ₂ CH ₂ F
-CH ₂ CHF ₂	-CH ₂ CF ₃	-CH(Me)CF ₃
-CH ₂ CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CF ₂ CF ₃	-CH ₂ CF ₂ CH ₃
-CH ₂ CH ₂ CF ₂ CF ₃	-CH(i-Pr)CF ₃	-CH ₂ CH ₂ OMe
-CH ₂ OEt	-CH ₂ CH ₂ O(i-Pr)	-CH ₂ CH ₂ OEt
-CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	-CH ₂ CH(Me)OMe	-CH(Et)CH ₂ OMe
-CH(Me)CH ₂ OMe	-CH ₂ CH ₂ S(O)Me	-CH ₂ CH ₂ SMe
-CH ₂ CH ₂ SEt	-CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	-CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et

		
-CH ₂ CH ₂ S(O)Et	-CH ₂ CH ₂ S(O)(t-Bu)	-CH ₂ CH ₂ S(t-Bu)
-CH(Me)CH ₂ SMe	-CH ₂ CH ₂ SO ₂ (t-Bu)	-CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me
-CH(Me)CH ₂ S(O)Me	-CH ₂ CH ₂ S(O)CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CF ₃
-CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₂ CF ₃
-CH ₂ CH ₂ S(O)CH ₂ CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CN	-CH ₂ CH ₂ CN
-C(Me) ₂ CN	-CH ₂ CH ₂ N(i-Pr) ₂	-CH ₂ CH ₂ N(Me) ₂
-CH ₂ CH(OMe) ₂	c-Pr	c-Bu
1 -metilciclopropilo	3-metoxiciclobutilo	-CH(Ph)(c-Pr)
-CH(Me)(c-Pr)	3-tietanilo	3,3-difluorociclobutilo
3-oxetanilo	-CH ₂ (oxiranilo)	3-tietanil-1,1-dióxido
3-tietanil-1-óxido	-CH ₂ (CH(-OC(Me) ₂ OCH ₂ -))	-CH ₂ (tetrahidro-2-furanilo)
-CH ₂ (2-furanilo)	tetrahidro-2-furanilo	-CH ₂ (2-tienilo)
-CH ₂ (CH(-OCH ₂ CH ₂ O-))	-CH ₂ CO ₂ Me	-CH ₂ (2,2-difluorociclopropilo)
-C(-CH ₂ CH ₂ -)CO ₂ Me	-CH(Me)CO ₂ Et	-CH(i-Pr)CO ₂ Me
-CH ₂ C(O)NHMe	-CH ₂ C(O)NMe ₂	-CH(Me)C(O)NHMe
-CH(Me)C(O)NH(t-Bu)	-OCH ₂ (c-Pr)	-CH(Me)C(O)NMe ₂
-OCH ₂ CH=CH ₂	-NHC(O)(i-Pr)	-NHC(O)Me
-NHCO ₂ Me	-NHC(O)(3-piridinilo)	-NHC(O)(t-Bu)
-NHC(O)Ph	-NH(c-hexilo)	-NHC(O)NH(i-Pr)
-NH(c-Pr)	-NHC(O)(2-tienilo)	-NH(CH ₂ CF ₃)
-NHC(O)CF ₃	-NHCO ₂ Et	-NHC(O)(2-furanilo)
-C(O)C(O)Me	-NHCO ₂ CH ₂ CF ₃	-C(O)CO ₂ Me
-C(O)(2-piridinilo)	-NHC(O)NMe ₂	-NHC(O)NHMe
-NHC(O)NHCH ₂ CF ₃	-NHC(O)CH ₂ CH ₂ CF ₃	-NHC(O)Et
-NHC(O)CH ₂ CF ₃	-NHSO ₂ CF ₃	-NHSO ₂ CH ₂ CF ₃
-NHSO ₂ CH ₂ CH ₂ CF ₃	-NH(2-piridinilo)	-NH(3-piridinilo)
-NH(4-piridinilo)	-NH(2-pirimidinilo)	-NH(4-pirimidinilo)
-NH(5-pirimidinilo)	-NH(6-CF ₃ -2-piridinilo)	-NH(4-CF ₃ -2-piridinilo)
-NH(3-CF ₃ -2-piridinilo)	-NH(5-CF ₃ -2-pirimidinilo)	-NH(5-CF ₃ -2-piridinilo)
-NH(4-CF ₃ -2-pirimidinilo)	-NH(6-metil-2-piridinilo)	-NH(4-metil-2-piridinilo)
-NH(3-metil-2-piridinilo)	-NH(5-metil-2-pirimidinilo)	-NH(5-metil-2-piridinilo)

		
-NH(4-metil-2-pirimidinilo)	-NH(6-metoxi-2-piridinilo)	-NH(4-metoxi-2-piridinilo)
-NH(3 -metoxi-2-piridinilo)	-NH(5-metoxi-2-pirimidinilo)	-NH(5-metoxi-2-piridinilo)
-NH(4-metoxi-2-pirimidinilo)	-CH ₂ (6-CF ₃ -2-piridinilo)	-CH ₂ (4-CF ₃ -2-piridinilo)
-CH ₂ (3-CF ₃ -2-piridinilo)	-CH ₂ (5-CF ₃ -2-pirimidinilo)	-CH ₂ (5-CF ₃ -2-piridinilo)
-CH ₂ (4-CF ₃ -2-pirimidinilo)	-CH ₂ (6-metil-2-piridinilo)	-CH ₂ (4-metil-2-piridinilo)
-CH ₂ (3-metil-2-piridinilo)	-CH ₂ (5-metil-2-pirimidinilo)	-CH ₂ (5-metil-2-piridinilo)
-CH ₂ (4-metil-2-pirimidinilo)	-CH ₂ (6-metoxi-2-piridinilo)	-CH ₂ (4-metoxi-2-piridinilo)
-CH ₂ (3-metoxi-2-piridinilo)	-CH ₂ (5-metoxi- 2-pirimidinilo)	-CH ₂ (5-metoxi- 2-piridinilo)
-CH ₂ (4-metoxi-2-pirimidinilo)	-CH ₂ (5-pirimidinilo)	-CH ₂ (6-bromo-2-piridinilo)
-CH ₂ (2-pirimidinilo)	-CH ₂ (3-(OCF ₃)fenilo)	-CH ₂ (2-tiazolilo)
-CH ₂ (5-metil-2-pirazinilo)	-CH ₂ (4-piridinilo)	-CH ₂ (2-piridinilo)
Ph	3-piridinilo	-CH ₂ (3-piridinilo)
2-piridinilo	2-pirazinilo	-CH ₂ CH ₂ (2-piridinilo)
4-piridinilo	4-CF ₃ -2-piridinilo	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ (2-piridinilo)
3-CF ₃ -2-piridinilo	4-CF ₃ -2-pirimidinilo	6-CF ₃ -2-piridinilo
5-CF ₃ -2-piridinilo	5-CF ₃ -2-pirazinilo	5-CF ₃ -2-pirimidinilo
-CH ₂ CH ₂ N(-C(O)CH ₂ CH ₂ C(O)-)	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ (1-imidazolilo)	-CH(-C(O)OCH ₂ CH ₂ -)
-CH ₂ (4-pirimidinilo)	piridazinilo	6-CF ₃ -3-pirazinilo
A es N		
R	R	R
Me	Et	Pr
i-Pr	-CH ₂ (c-Pr)	-CH(Me)(c-Pr)
Bu	s-Bu	i-Bu
t-Bu	-CH ₂ Ph	-CH ₂ CH=CH ₂
-CH ₂ C≡CH	-C(Me) ₂ C≡CH	-CH ₂ CH ₂ F
-CH ₂ CHF ₂	-CH ₂ CF ₃	-CH(Me)CF ₃
-CH ₂ CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CF ₂ CF ₃	-CH ₂ CF ₂ CH ₃
-CH ₂ CH ₂ CF ₂ CF ₃	-CH(i-Pr)CF ₃	-CH ₂ CH ₂ OMe
-CH ₂ OEt	-CH ₂ CH ₂ O(i-Pr)	-CH ₂ CH ₂ OEt
-CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	-CH ₂ CH(Me)OMe	-CH(Et)CH ₂ OMe
-CH(Me)CH ₂ OMe	-CH ₂ CH ₂ S(O)Me	-CH ₂ CH ₂ SMe

		
-CH ₂ CH ₂ SEt	-CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	-CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et
-CH ₂ CH ₂ S(O)Et	-CH ₂ CH ₂ S(O)(t-Bu)	-CH ₂ CH ₂ S(t-Bu)
-CH(Me)CH ₂ SMe	-CH ₂ CH ₂ SO ₂ (t-Bu)	-CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me
-CH(Me)CH ₂ S(O)Me	-CH ₂ CH ₂ S(O)CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CF ₃
-CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₂ CF ₃
-CH ₂ CH ₂ S(O)CH ₂ CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CN	-CH ₂ CH ₂ CN
-C(Me) ₂ CN	-CH ₂ CH ₂ N(i-Pr) ₂	-CH ₂ CH ₂ N(Me) ₂
-CH ₂ CH(OMe) ₂	c-Pr	c-Bu
1 -metilciclopropilo	3-metoxiciclobutilo	-CH(Ph)(c-Pr)
-CH(Me)(c-Pr)	3-tietanilo	3,3-difluorociclobutilo
3-oxetanilo	-CH ₂ (oxiranilo)	3-tietanil-1,1-dióxido
3-tietanil-1-óxido	-CH ₂ (CH(-OC(Me) ₂ OCH ₂ -))	-CH ₂ (tetrahidro-2-furanilo)
-CH ₂ (2-furanilo)	tetrahidro-2-furanilo	-CH ₂ (2-tienilo)
-CH ₂ (CH(-OCH ₂ CH ₂ O-))	-CH ₂ CO ₂ Me	-CH ₂ (2,2-difluorociclopropilo)
-C(-CH ₂ CH ₂ -)CO ₂ Me	-CH(Me)CO ₂ Et	-CH(i-Pr)CO ₂ Me
-CH ₂ C(O)NHMe	-CH ₂ C(O)NMe ₂	-CH(Me)C(O)NHMe
-CH(Me)C(O)NH(t-Bu)	-OCH ₂ (c-Pr)	-CH(Me)C(O)NMe ₂
-OCH ₂ CH=CH ₂	-NHC(O)(i-Pr)	-NHC(O)Me
-NHCO ₂ Me	-NHC(O)(3-piridinilo)	-NHC(O)(t-Bu)
-NHC(O)Ph	-NH(c-hexilo)	-NHC(O)NH(i-Pr)
-NH(c-Pr)	-NHC(O)(2-tienilo)	-NH(CH ₂ CF ₃)
-NHC(O)CF ₃	-NHCO ₂ Et	-NHC(O)(2-furanilo)
-C(O)C(O)Me	-NHCO ₂ CH ₂ CF ₃	-C(O)CO ₂ Me
-C(O)(2-piridinilo)	-NHC(O)NMe ₂	-NHC(O)NHMe
-NHC(O)NHCH ₂ CF ₃	-NHC(O)CH ₂ CH ₂ CF ₃	-NHC(O)Et
-NHC(O)CH ₂ CF ₃	-NHCO ₂ CF ₃	-NHCO ₂ CH ₂ CF ₃
-NHCO ₂ CH ₂ CH ₂ CF ₃	-NH(2-piridinilo)	-NH(3-piridinilo)
-NH(4-piridinilo)	-NH(2-pirimidinilo)	-NH(4-pirimidinilo)
-NH(5-pirimidinilo)	-NH(6-CF ₃ -2-piridinilo)	-NH(4-CF ₃ -2-piridinilo)
-NH(3-CF ₃ -2-piridinilo)	-NH(5-CF ₃ -2-pirimidinilo)	-NH(5-CF ₃ -2-piridinilo)
-NH(4-CF ₃ -2-pirimidinilo)	-NH(6-metil-2-piridinilo)	-NH(4-metil-2-piridinilo)

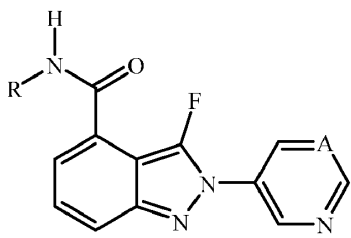
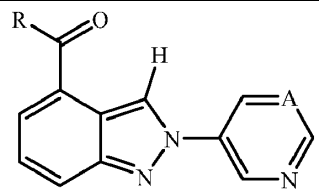
		
-NH(3-metil-2-piridinilo)	-NH(5-metil-2-pirimidinilo)	-NH(5-metil-2-piridinilo)
-NH(4-metil-2-pirimidinilo)	-NH(6-metoksi-2-piridinilo)	-NH(4-metoksi-2-piridinilo)
-NH(3-metoksi-2-piridinilo)	-NH(5-metoksi-2-pirimidinilo)	-NH(5-metoksi-2-piridinilo)
-NH(4-metoksi-2-pirimidinilo)	-CH ₂ (6-CF ₃ -2-piridinilo)	-CH ₂ (4-CF ₃ -2-piridinilo)
-CH ₂ (3-CF ₃ -2-piridinilo)	-CH ₂ (5-CF ₃ -2-pirimidinilo)	-CH ₂ (5-CF ₃ -2-piridinilo)
-CH ₂ (4-CF ₃ -2-pirimidinilo)	-CH ₂ (6-metil-2-piridinilo)	-CH ₂ (4-metil-2-piridinilo)
-CH ₂ (3-metil-2-piridinilo)	-CH ₂ (5-metil-2-pirimidinilo)	-CH ₂ (5-metil-2-piridinilo)
-CH ₂ (4-metil-2-pirimidinilo)	-CH ₂ (6-metoksi-2-piridinilo)	-CH ₂ (4-metoksi-2-piridinilo)
-CH ₂ (3-metoksi-2-piridinilo)	-CH ₂ (5-metoksi-2-pirimidinilo)	-CH ₂ (5-metoksi-2-piridinilo)
-CH ₂ (4-metoksi-2-pirimidinilo)	-CH ₂ (5-pirimidinilo)	-CH ₂ (6-bromo-2-piridinilo)
-CH ₂ (2-pirimidinilo)	-CH ₂ (3-(OCF ₃)fenilo)	-CH ₂ (2-tiazolilo)
-CH ₂ (5-metil-2-pirazinilo)	-CH ₂ (4-piridinilo)	-CH ₂ (2-piridinilo)
Ph	3-piridinilo	-CH ₂ (3-piridinilo)
2-piridinilo	2-pirazinilo	-CH ₂ CH ₂ (2-piridinilo)
4-piridinilo	4-CF ₃ -2-piridinilo	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ (2-piridinilo)
3-CF ₃ -2-piridinilo	4-CF ₃ -2-pirimidinilo	6-CF ₃ -2-piridinilo
5-CF ₃ -2-piridinilo	5-CF ₃ -2-pirazinilo	5-CF ₃ -2-pirimidinilo
-CH ₂ CH ₂ N(-C(O)CH ₂ CH ₂ C(O)-)	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ (1-imidazolilo)	-CH(-C(O)OCH ₂ CH ₂ -)
-CH ₂ (4-pirimidinilo)	Piridazinilo	6-CF ₃ -3-pirazinilo

Tabla 1c

	
A es CH	
R	R
N(-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -)	N(-CH ₂ CH(OMe)CH ₂ -)
N(-CH ₂ CH ₂ CF ₂ CH ₂ CH ₂ -)	N(-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CF ₂ CH ₂ -)
N(-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -)	N(-CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₂ -)
N(-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -)	N(-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -)

	
N(-CH ₂ CH ₂ N(C(O)(c-Pr))CH ₂ CH ₂ -)	N(-CH ₂ CH ₂ N(Me)CH ₂ CH ₂ -)
N(-CH ₂ C(Me) ₂ N=CH-)	N(-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)CH ₂ -)
N(CH ₂ C≡CH) ₂	N(Et) ₂
N(Pr)CH ₂ (c-Pr)	N(Et)(c-hexilo)
N(-CHC(O)SCH ₂ CH ₂ -)	
A es CF	
R	R
N(-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -)	N(-CH ₂ CH(OMe)CH ₂ -)
N(-CH ₂ CH ₂ CF ₂ CH ₂ CH ₂ -)	N(-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CF ₂ CH ₂ -)
N(-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -)	N(-CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₂ -)
N(-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -)	N(-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -)
N(-CH ₂ CH ₂ N(C(O)(c-Pr))CH ₂ CH ₂ -)	N(-CH ₂ CH ₂ N(Me)CH ₂ CH ₂ -)
N(-CH ₂ C(Me) ₂ N=CH-)	N(-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)CH ₂ -)
N(CH ₂ C≡CH) ₂	N(Et) ₂
N(Pr)CH ₂ (c-Pr)	N(Et)(c-hexilo)
N(-CHC(O)SCH ₂ CH ₂ -)	
A es N	
R	R
N(-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -)	N(-CH ₂ CH(OMe)CH ₂ -)
N(-CH ₂ CH ₂ CF ₂ CH ₂ CH ₂ -)	N(-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CF ₂ CH ₂ -)
N(-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -)	N(-CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₂ -)
N(-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -)	N(-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -)
N(-CH ₂ CH ₂ N(C(O)(c-Pr))CH ₂ CH ₂ -)	N(-CH ₂ CH ₂ N(Me)CH ₂ CH ₂ -)
N(-CH ₂ C(Me) ₂ N=CH-)	N(-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)CH ₂ -)
N(CH ₂ C≡CH) ₂	N(Et) ₂
N(Pr)CH ₂ (c-Pr)	N(Et)(c-hexilo)
N(-CHC(O)SCH ₂ CH ₂ -)	

Tabla 1d

	
A es CH	
R	R
N(-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -)	N(-CH ₂ CH(OMe)CH ₂ -)
N(-CH ₂ CH ₂ CF ₂ CH ₂ CH ₂ -)	N(-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CF ₂ CH ₂ -)
N(-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -)	N(-CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₂ -)
N(-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -)	N(-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -)
N(-CH ₂ CH ₂ N(C(O)(c-Pr))CH ₂ CH ₂ -)	N(-CH ₂ CH ₂ N(Me)CH ₂ CH ₂ -)
N(-CH ₂ C(Me) ₂ N=CH-)	N(-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)CH ₂ -)
N(CH ₂ C≡CH) ₂	N(Et) ₂
N(Pr)CH ₂ (c-Pr)	N(Et)(c-hexilo)
N(-CHC(O)SCH ₂ CH ₂ -)	
A es CF	
R	R
N(-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -)	N(-CH ₂ CH(OMe)CH ₂ -)
N(-CH ₂ CH ₂ CF ₂ CH ₂ CH ₂ -)	N(-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CF ₂ CH ₂ -)
N(-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -)	N(-CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₂ -)
N(-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -)	N(-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -)
N(-CH ₂ CH ₂ N(C(O)(c-Pr))CH ₂ CH ₂ -)	N(-CH ₂ CH ₂ N(Me)CH ₂ CH ₂ -)
N(-CH ₂ C(Me) ₂ N=CH-)	N(-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)CH ₂ -)
N(CH ₂ C≡CH) ₂	N(Et) ₂
N(Pr)CH ₂ (c-Pr)	N(Et)(c-hexilo)
N(-CHC(O)SCH ₂ CH ₂ -)	
A es N	
R	R
N(-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -)	N(-CH ₂ CH(OMe)CH ₂ -)
N(-CH ₂ CH ₂ CF ₂ CH ₂ CH ₂ -)	N(-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CF ₂ CH ₂ -)
N(-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -)	N(-CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₂ -)
N(-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -)	N(-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -)
N(-CH ₂ CH ₂ N(C(O)(c-Pr))CH ₂ CH ₂ -)	N(-CH ₂ CH ₂ N(Me)CH ₂ CH ₂ -)
N(-CH ₂ C(Me) ₂ N=CH-)	N(-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)CH ₂ -)
N(CH ₂ C≡CH) ₂	N(Et) ₂

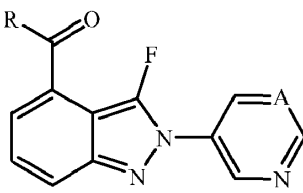
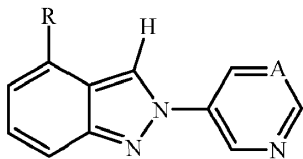
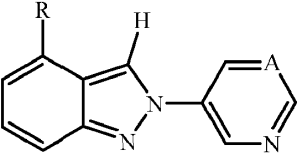
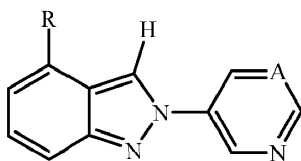
	
N(Pr)CH ₂ (c-Pr)	N(Et)(c-hexilo)
N(-CHC(O)SCH ₂ CH ₂ -)	

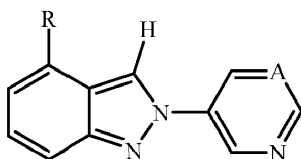
Tabla 1e

	
A es CH	
R	R
3-metil-2-piridinilo	3 -metoxi-2-piridinilo
3-(trifluorometil)-2-piridinilo	3-(CH(=NOMe))-2-piridinilo
4-metil-2-piridinilo	4-metoxi-2-piridinilo
4-(trifluorometil)-2-piridinilo	4-(CH(=NOMe))-2-piridinilo
5-metil-2-piridinilo	5-metoxi-2-piridinilo
5-(trifluorometil)-2-piridinilo	5-(CH(=NOMe))-2-piridinilo
6-metil-2-piridinilo	6-metoxi-2-piridinilo
6-(trifluorometil)-2-piridinilo	6-(CH(=NOMe))-2-piridinilo
2-metil-3-piridinilo	2-metoxi-3-piridinilo
2-(trifluorometil)-3-piridinilo	2-(CH(=NOMe))-3-piridinilo
4-metil-3-piridinilo	4-metoxi-3-piridinilo
4-(trifluorometil)-3-piridinilo	4-(CH(=NOMe))-3-piridinilo
5-metil-3-piridinilo	5-metoxi-3-piridinilo
5-(trifluorometil)-3-piridinilo	5-(CH(=NOMe))-3-piridinilo
6-metil-3-piridinilo	6-metoxi-3-piridinilo
6-(trifluorometil)-3-piridinilo	6-(CH(=NOMe))-3-piridinilo
2-metil-4-piridinilo	2-metoxi-4-piridinilo
2-(trifluorometil)-4-piridinilo	2-(CH(=NOMe))-4-piridinilo
3-metil-4-piridinilo	3-metoxi-4-piridinilo
3-(trifluorometil)-4-piridinilo	3-(CH(=NOMe))-4-piridinilo
3-metil-2-pirazinilo	3-metoxi-2-pirazinilo
3-(trifluorometil)-2-pirazinilo	3-(CH(=NOMe))-2-pirazinilo
5-metil-2-pirazinilo	5-metoxi-2-pirazinilo

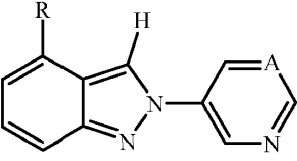
	
5-(trifluorometil)-2-pirazinilo	5-(CH(=NOMe))-2-pirazinilo
6-metil-2-pirazinilo	6-metoksi-2-pirazinilo
6-(trifluorometil)-2-pirazinilo	6-(CH(=NOMe))-2-pirazinilo
4-metil-2-pirimidinilo	4-metoksi-2-pirimidinilo
4-(trifluorometil)-2-pirimidinilo	4-(CH(=NOMe))-2-pirimidinilo
5-metil-2-pirimidinilo	5-metoksi-2-pirimidinilo
5-(trifluorometil)-2-pirimidinilo	5-(CH(=NOMe))-2-pirimidinilo
2-metil-4-pirimidinilo	2-metoksi-4-pirimidinilo
2-(trifluorometil)-4-pirimidinilo	2-(CH(=NOMe))-4-pirimidinilo
5-metil-4-pirimidinilo	5-metoksi-4-pirimidinilo
5-(trifluorometil)-4-pirimidinilo	5-(CH(=NOMe))-4-pirimidinilo
6-metil-4-pirimidinilo	6-metoksi-4-pirimidinilo
6-(trifluorometil)-4-pirimidinilo	6-(CH(=NOMe))-4-pirimidinilo
3-metil-1-pirazolilo	3-metoksi-1-pirazolilo
3-(trifluorometil)-1-pirazolilo	3-(CH(=NOMe))-1-pirazolilo
4-metil-1-pirazolilo	4-metoksi-1-pirazolilo
4-(trifluorometil)-1-pirazolilo	4-(CH(=NOMe))-1-pirazolilo
5-metil-1-pirazolilo	5-metoksi-1-pirazolilo
5-(trifluorometil)-1-pirazolilo	5-(CH(=NOMe))-1-pirazolilo
4-metil-1,2,3-triazin-2-ilo	4-metoksi-1,2,3-triazin-2-ilo
4-(trifluorometil)-1,2,3-triazin-2-ilo	4-(CH(=NOMe))-1,2,3-triazin-2-ilo
6-(2-pirimidinilo)-2-piridinilo	2-(2-piridinilo)-4-tiazolilo
2-(2-tiazolilo)-4-tiazolilo	2-(2-pirimidinilo)etinilo
1,3,4-oxadiazol-2-ilo	tetrahidro-3-furanilo
tetrahidro-2-furanilo	4,5-dihidro-3-isoxazolilo
3-isoxazolilo	Fenilo
2-(trifluorometil)fenilo	3-(trifluorometil)fenilo
4-(trifluorometil)fenilo	6-(trifluorometil)-3-pirazinilo
A es CF	
R	R
3-metil-2-piridinilo	3-metoksi-2-piridinilo
3-(trifluorometil)-2-piridinilo	3-(CH(=NOMe))-2-piridinilo



4-metil-2-piridinilo	4-metoxi-2-piridinilo
4-(trifluorometil)-2-piridinilo	4-(CH(=NOMe))-2-piridinilo
5-metil-2-piridinilo	5-metoxi-2-piridinilo
5-(trifluorometil)-2-piridinilo	5-(CH(=NOMe))-2-piridinilo
6-metil-2-piridinilo	6-metoxi-2-piridinilo
6-(trifluorometil)-2-piridinilo	6-(CH(=NOMe))-2-piridinilo
2-metil-3-piridinilo	2-metoxi-3-piridinilo
2-(trifluorometil)-3-piridinilo	2-(CH(=NOMe))-3-piridinilo
4-metil-3-piridinilo	4-metoxi-3-piridinilo
4-(trifluorometil)-3-piridinilo	4-(CH(=NOMe))-3-piridinilo
5-metil-3-piridinilo	5-metoxi-3-piridinilo
5-(trifluorometil)-3-piridinilo	5-(CH(=NOMe))-3-piridinilo
6-metil-3-piridinilo	6-metoxi-3-piridinilo
6-(trifluorometil)-3-piridinilo	6-(CH(=NOMe))-3-piridinilo
2-metil-4-piridinilo	2-metoxi-4-piridinilo
2-(trifluorometil)-4-piridinilo	2-(CH(=NOMe))-4-piridinilo
3-metil-4-piridinilo	3-metoxi-4-piridinilo
3-(trifluorometil)-4-piridinilo	3-(CH(=NOMe))-4-piridinilo
3-metil-2-pirazinilo	3-metoxi-2-pirazinilo
3-(trifluorometil)-2-pirazinilo	3-(CH(=NOMe))-2-pirazinilo
5-metil-2-pirazinilo	5-metoxi-2-pirazinilo
5-(trifluorometil)-2-pirazinilo	5-(CH(=NOMe))-2-pirazinilo
6-metil-2-pirazinilo	6-metoxi-2-pirazinilo
6-(trifluorometil)-2-pirazinilo	6-(CH(=NOMe))-2-pirazinilo
4-metil-2-pirimidinilo	4-metoxi-2-pirimidinilo
4-(trifluorometil)-2-pirimidinilo	4-(CH(=NOMe))-2-pirimidinilo
5-metil-2-pirimidinilo	5-metoxi-2-pirimidinilo
5-(trifluorometil)-2-pirimidinilo	5-(CH(=NOMe))-2-pirimidinilo
2-metil-4-pirimidinilo	2-metoxi-4-pirimidinilo
2-(trifluorometil)-4-pirimidinilo	2-(CH(=NOMe))-4-pirimidinilo
5-metil-4-pirimidinilo	5-metoxi-4-pirimidinilo
5-(trifluorometil)-4-pirimidinilo	5-(CH(=NOMe))-4-pirimidinilo



6-metil-4-pirimidinilo	6-metoksi-4-pirimidinilo
6-(trifluorometil)-4-pirimidinilo	6-(CH(=NOMe))-4-pirimidinilo
3-metil-1-pirazolilo	3-metoksi-1-pirazolilo
3-(trifluorometil)-1-pirazolilo	3-(CH(=NOMe))-1-pirazolilo
4-metil-1-pirazolilo	4-metoksi-1-pirazolilo
4-(trifluorometil)-1-pirazolilo	4-(CH(=NOMe))-1-pirazolilo
5-metil-1-pirazolilo	5-metoksi-1-pirazolilo
5-(trifluorometil)-1-pirazolilo	5-(CH(=NOMe))-1-pirazolilo
4-metil-1,2,3-triazin-2-ilo	4-metoksi-1,2,3-triazin-2-ilo
4-(trifluorometil)-1,2,3-triazin-2-ilo	4-(CH(=NOMe))-1,2,3-triazin-2-ilo
6-(2-pirimidinil)-2-piridinilo	2-(2-piridinil)-4-tiazolilo
2-(2-tiazolil)-4-tiazolilo	2-(2-pirimidinil)etinilo
1,3,4-oxadiazol-2-ilo	tetrahidro-3-furanilo
tetrahidro-2-furanilo	4,5-dihidro-3-isoxazolilo
3-isoxazolilo	fenilo
2-(trifluorometil)fenilo	3-(trifluorometil)fenilo
4-(trifluorometil)fenilo	6-(trifluorometil)-3-pirazinilo
A es N	
R	R
3-metil-2-piridinilo	3-metoksi-2-piridinilo
3-(trifluorometil)-2-piridinilo	3-(CH(=NOMe))-2-piridinilo
4-metil-2-piridinilo	4-metoksi-2-piridinilo
4-(trifluorometil)-2-piridinilo	4-(CH(=NOMe))-2-piridinilo
5-metil-2-piridinilo	5-metoksi-2-piridinilo
5-(trifluorometil)-2-piridinilo	5-(CH(=NOMe))-2-piridinilo
6-metil-2-piridinilo	6-metoksi-2-piridinilo
6-(trifluorometil)-2-piridinilo	6-(CH(=NOMe))-2-piridinilo
2-metil-3-piridinilo	2-metoksi-3-piridinilo
2-(trifluorometil)-3-piridinilo	2-(CH(=NOMe))-3-piridinilo
4-metil-3-piridinilo	4-metoksi-3-piridinilo
4-(trifluorometil)-3-piridinilo	4-(CH(=NOMe))-3-piridinilo
5-metil-3-piridinilo	5-metoksi-3-piridinilo

	
5-(trifluorometil)-3-piridinilo	5-(CH(=NOMe))-3-piridinilo
6-metil-3-piridinilo	6-metoksi-3-piridinilo
6-(trifluorometil)-3-piridinilo	6-(CH(=NOMe))-3-piridinilo
2-metil-4-piridinilo	2-metoksi-4-piridinilo
2-(trifluorometil)-4-piridinilo	2-(CH(=NOMe))-4-piridinilo
3-metil-4-piridinilo	3-metoksi-4-piridinilo
3-(trifluorometil)-4-piridinilo	3-(CH(=NOMe))-4-piridinilo
3-metil-2-pirazinilo	3-metoksi-2-pirazinilo
3-(trifluorometil)-2-pirazinilo	3-(CH(=NOMe))-2-pirazinilo
5-metil-2-pirazinilo	5-metoksi-2-pirazinilo
5-(trifluorometil)-2-pirazinilo	5-(CH(=NOMe))-2-pirazinilo
6-metil-2-pirazinilo	6-metoksi-2-pirazinilo
6-(trifluorometil)-2-pirazinilo	6-(CH(=NOMe))-2-pirazinilo
4-metil-2-pirimidinilo	4-metoksi-2-pirimidinilo
4-(trifluorometil)-2-pirimidinilo	4-(CH(=NOMe))-2-pirimidinilo
5-metil-2-pirimidinilo	5-metoksi-2-pirimidinilo
5-(trifluorometil)-2-pirimidinilo	5-(CH(=NOMe))-2-pirimidinilo
2-metil-4-pirimidinilo	2-metoksi-4-pirimidinilo
2-(trifluorometil)-4-pirimidinilo	2-(CH(=NOMe))-4-pirimidinilo
5-metil-4-pirimidinilo	5-metoksi-4-pirimidinilo
5-(trifluorometil)-4-pirimidinilo	5-(CH(=NOMe))-4-pirimidinilo
6-metil-4-pirimidinilo	6-metoksi-4-pirimidinilo
6-(trifluorometil)-4-pirimidinilo	6-(CH(=NOMe))-4-pirimidinilo
3-metil-1-pirazolilo	3-metoksi-1-pirazolilo
3-(trifluorometil)-1-pirazolilo	3-(CH(=NOMe))-1-pirazolilo
4-metil-1-pirazolilo	4-metoksi-1-pirazolilo
4-(trifluorometil)-1-pirazolilo	4-(CH(=NOMe))-1-pirazolilo
5-metil-1-pirazolilo	5-metoksi-1-pirazolilo
5-(trifluorometil)-1-pirazolilo	5-(CH(=NOMe))-1-pirazolilo
4-metil-1,2,3-triazin-2-ilo	4-metoksi-1,2,3-triazin-2-ilo
4-(trifluorometil)-1,2,3-triazin-2-ilo	4-(CH(=NOMe))-1,2,3-triazin-2-ilo
6-(2-pirimidinil)-2-piridinilo	2-(2-piridinil)-4-tiazolilo

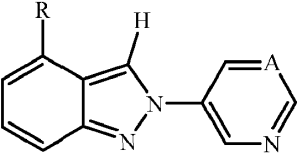
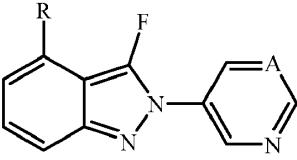
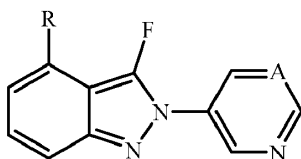
	
2-(2-tiazolil)-4-tiazolilo	2-(2-pirimidinil)etinilo
1,3,4-oxadiazol-2-ilo	tetrahidro-3-furanilo
tetrahidro-2-furanilo	4,5-dihidro-3-isoxazolilo
3-isoxazolilo	Fenilo
2-(trifluorometil)fenilo	3-(trifluorometil)fenilo
4-(trifluorometil)fenilo	6-(trifluorometil)-3-pirazinilo

Tabla 1f

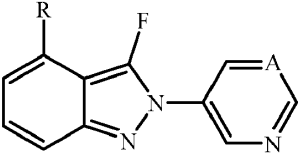
	
A es CH	
R	R
3-metil-2-piridinilo	3-metoxi-2-piridinilo
3-(trifluorometil)-2-piridinilo	3-(CH(=NOMe))-2-piridinilo
4-metil-2-piridinilo	4-metoxi-2-piridinilo
4-(trifluorometil)-2-piridinilo	4-(CH(=NOMe))-2-piridinilo
5-metil-2-piridinilo	5-metoxi-2-piridinilo
5-(trifluorometil)-2-piridinilo	5-(CH(=NOMe))-2-piridinilo
6-metil-2-piridinilo	6-metoxi-2-piridinilo
6-(trifluorometil)-2-piridinilo	6-(CH(=NOMe))-2-piridinilo
2-metil-3-piridinilo	2-metoxi-3-piridinilo
2-(trifluorometil)-3-piridinilo	2-(CH(=NOMe))-3-piridinilo
4-metil-3-piridinilo	4-metoxi-3-piridinilo
4-(trifluorometil)-3-piridinilo	4-(CH(=NOMe))-3-piridinilo
5-metil-3-piridinilo	5-metoxi-3-piridinilo
5-(trifluorometil)-3-piridinilo	5-(CH(=NOMe))-3-piridinilo
6-metil-3-piridinilo	6-metoxi-3-piridinilo
6-(trifluorometil)-3-piridinilo	6-(CH(=NOMe))-3-piridinilo
2-metil-4-piridinilo	2-metoxi-4-piridinilo
2-(trifluorometil)-4-piridinilo	2-(CH(=NOMe))-4-piridinilo
3-metil-4-piridinilo	3-metoxi-4-piridinilo

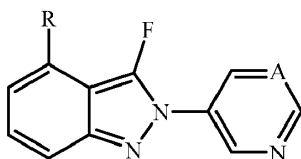
	
3-(trifluorometil)-4-piridinilo	3-(CH(=NOMe))-4-piridinilo
3-metil-2-pirazinilo	3-metoksi-2-pirazinilo
3-(trifluorometil)-2-pirazinilo	3-(CH(=NOMe))-2-pirazinilo
5-metil-2-pirazinilo	5-metoksi-2-pirazinilo
5-(trifluorometil)-2-pirazinilo	5-(CH(=NOMe))-2-pirazinilo
6-metil-2-pirazinilo	6-metoksi-2-pirazinilo
6-(trifluorometil)-2-pirazinilo	6-(CH(=NOMe))-2-pirazinilo
4-metil-2-pirimidinilo	4-metoksi-2-pirimidinilo
4-(trifluorometil)-2-pirimidinilo	4-(CH(=NOMe))-2-pirimidinilo
5-metil-2-pirimidinilo	5-metoksi-2-pirimidinilo
5-(trifluorometil)-2-pirimidinilo	5-(CH(=NOMe))-2-pirimidinilo
2-metil-4-pirimidinilo	2-metoksi-4-pirimidinilo
2-(trifluorometil)-4-pirimidinilo	2-(CH(=NOMe))-4-pirimidinilo
5-metil-4-pirimidinilo	5-metoksi-4-pirimidinilo
5-(trifluorometil)-4-pirimidinilo	5-(CH(=NOMe))-4-pirimidinilo
6-metil-4-pirimidinilo	6-metoksi-4-pirimidinilo
6-(trifluorometil)-4-pirimidinilo	6-(CH(=NOMe))-4-pirimidinilo
3-metil-1-pirazolilo	3-metoksi-1-pirazolilo
3-(trifluorometil)-1-pirazolilo	3-(CH(=NOMe))-1-pirazolilo
4-metil-1-pirazolilo	4-metoksi-1-pirazolilo
4-(trifluorometil)-1-pirazolilo	4-(CH(=NOMe))-1-pirazolilo
5-metil-1-pirazolilo	5-metoksi-1-pirazolilo
5-(trifluorometil)-1-pirazolilo	5-(CH(=NOMe))-1-pirazolilo
4-metil-1,2,3-triazin-2-ilo	4-metoksi-1,2,3-triazin-2-ilo
4-(trifluorometil)-1,2,3-triazin-2-ilo	4-(CH(=NOMe))-1,2,3-triazin-2-ilo
6-(2-pirimidinilo)-2-piridinilo	2-(2-piridinilo)-4-tiazolilo
2-(2-tiazolilo)-4-tiazolilo	2-(2-pirimidinilo)etnilo
1,3,4-oxadiazol-2-ilo	tetrahidro-3-furanilo
tetrahidro-2-furanilo	4,5-dihidro-3-isoxazolilo
3-isoxazolilo	Fenilo
2-(trifluorometil)fenilo	3-(trifluorometil)fenilo
4-(trifluorometil)fenilo	6-(trifluorometil)-3-pirazinilo



A es CF

R	R
3-metil-2-piridinilo	3-metoxi-2-piridinilo
3-(trifluorometil)-2-piridinilo	3-(CH(=NOMe))-2-piridinilo
4-metil-2-piridinilo	4-metoxi-2-piridinilo
4-(trifluorometil)-2-piridinilo	4-(CH(=NOMe))-2-piridinilo
5-metil-2-piridinilo	5-metoxi-2-piridinilo
5-(trifluorometil)-2-piridinilo	5-(CH(=NOMe))-2-piridinilo
6-metil-2-piridinilo	6-metoxi-2-piridinilo
6-(trifluorometil)-2-piridinilo	6-(CH(=NOMe))-2-piridinilo
2-metil-3-piridinilo	2-metoxi-3-piridinilo
2-(trifluorometil)-3-piridinilo	2-(CH(=NOMe))-3-piridinilo
4-metil-3-piridinilo	4-metoxi-3-piridinilo
4-(trifluorometil)-3-piridinilo	4-(CH(=NOMe))-3-piridinilo
5-metil-3-piridinilo	5-metoxi-3-piridinilo
5-(trifluorometil)-3-piridinilo	5-(CH(=NOMe))-3-piridinilo
6-metil-3-piridinilo	6-metoxi-3-piridinilo
6-(trifluorometil)-3-piridinilo	6-(CH(=NOMe))-3-piridinilo
2-metil-4-piridinilo	2-metoxi-4-piridinilo
2-(trifluorometil)-4-piridinilo	2-(CH(=NOMe))-4-piridinilo
3-metil-4-piridinilo	3-metoxi-4-piridinilo
3-(trifluorometil)-4-piridinilo	3-(CH(=NOMe))-4-piridinilo
3-metil-2-pirazinilo	3-metoxi-2-pirazinilo
3-(trifluorometil)-2-pirazinilo	3-(CH(=NOMe))-2-pirazinilo
5-metil-2-pirazinilo	5-metoxi-2-pirazinilo
5-(trifluorometil)-2-pirazinilo	5-(CH(=NOMe))-2-pirazinilo
6-metil-2-pirazinilo	6-metoxi-2-pirazinilo
6-(trifluorometil)-2-pirazinilo	6-(CH(=NOMe))-2-pirazinilo
4-metil-2-pirimidinilo	4-metoxi-2-pirimidinilo
4-(trifluorometil)-2-pirimidinilo	4-(CH(=NOMe))-2-pirimidinilo
5-metil-2-pirimidinilo	5-metoxi-2-pirimidinilo
5-(trifluorometil)-2-pirimidinilo	5-(CH(=NOMe))-2-pirimidinilo

	
2-metil-4-pirimidinilo	2-metoksi-4-pirimidinilo
2-(trifluorometil)-4-pirimidinilo	2-(CH(=NOMe))-4-pirimidinilo
5-metil-4-pirimidinilo	5-metoksi-4-pirimidinilo
5-(trifluorometil)-4-pirimidinilo	5-(CH(=NOMe))-4-pirimidinilo
6-metil-4-pirimidinilo	6-metoksi-4-pirimidinilo
6-(trifluorometil)-4-pirimidinilo	6-(CH(=NOMe))-4-pirimidinilo
3-metil-1-pirazolilo	3-metoksi-1-pirazolilo
3-(trifluorometil)-1-pirazolilo	3-(CH(=NOMe))-1-pirazolilo
4-metil-1-pirazolilo	4-metoksi-1-pirazolilo
4-(trifluorometil)-1-pirazolilo	4-(CH(=NOMe))-1-pirazolilo
5-metil-1-pirazolilo	5-metoksi-1-pirazolilo
5-(trifluorometil)-1-pirazolilo	5-(CH(=NOMe))-1-pirazolilo
4-metil-1,2,3-triazin-2-ilo	4-metoksi-1,2,3-triazin-2-ilo
4-(trifluorometil)-1,2,3-triazin-2-ilo	4-(CH(=NOMe))-1,2,3-triazin-2-ilo
6-(2-pirimidinil)-2-piridinilo	2-(2-piridinil)-4-tiazolilo
2-(2-tiazolil)-4-tiazolilo	2-(2-pirimidinil)etinilo
1,3,4-oxadiazol-2-ilo	tetrahidro-3-furanilo
tetrahidro-2-furanilo	4,5-dihidro-3-isoxazolilo
3-isoxazolilo	fenilo
2-(trifluorometil)fenilo	3-(trifluorometil)fenilo
4-(trifluorometil)fenilo	6-(trifluorometil)-3-pirazinilo
A es N	
R	R
3-metil-2-piridinilo	3-metoksi-2-piridinilo
3-(trifluorometil)-2-piridinilo	3-(CH(=NOMe))-2-piridinilo
4-metil-2-piridinilo	4-metoksi-2-piridinilo
4-(trifluorometil)-2-piridinilo	4-(CH(=NOMe))-2-piridinilo
5-metil-2-piridinilo	5-metoksi-2-piridinilo
5-(trifluorometil)-2-piridinilo	5-(CH(=NOMe))-2-piridinilo
6-metil-2-piridinilo	6-metoksi-2-piridinilo
6-(trifluorometil)-2-piridinilo	6-(CH(=NOMe))-2-piridinilo
2-metil-3-piridinilo	2-metoksi-3-piridinilo



2-(trifluorometil)-3-piridinilo	2-(CH(=NOMe))-3-piridinilo
4-metil-3-piridinilo	4-metoxi-3-piridinilo
4-(trifluorometil)-3-piridinilo	4-(CH(=NOMe))-3-piridinilo
5-metil-3-piridinilo	5-metoxi-3-piridinilo
5-(trifluorometil)-3-piridinilo	5-(CH(=NOMe))-3-piridinilo
6-metil-3-piridinilo	6-metoxi-3-piridinilo
6-(trifluorometil)-3-piridinilo	6-(CH(=NOMe))-3-piridinilo
2-metil-4-piridinilo	2-metoxi-4-piridinilo
2-(trifluorometil)-4-piridinilo	2-(CH(=NOMe))-4-piridinilo
3-metil-4-piridinilo	3-metoxi-4-piridinilo
3-(trifluorometil)-4-piridinilo	3-(CH(=NOMe))-4-piridinilo
3-metil-2-pirazinilo	3-metoxi-2-pirazinilo
3-(trifluorometil)-2-pirazinilo	3-(CH(=NOMe))-2-pirazinilo
5-metil-2-pirazinilo	5-metoxi-2-pirazinilo
5-(trifluorometil)-2-pirazinilo	5-(CH(=NOMe))-2-pirazinilo
6-metil-2-pirazinilo	6-metoxi-2-pirazinilo
6-(trifluorometil)-2-pirazinilo	6-(CH(=NOMe))-2-pirazinilo
4-metil-2-pirimidinilo	4-metoxi-2-pirimidinilo
4-(trifluorometil)-2-pirimidinilo	4-(CH(=NOMe))-2-pirimidinilo
5-metil-2-pirimidinilo	5-metoxi-2-pirimidinilo
5-(trifluorometil)-2-pirimidinilo	5-(CH(=NOMe))-2-pirimidinilo
2-metil-4-pirimidinilo	2-metoxi-4-pirimidinilo
2-(trifluorometil)-4-pirimidinilo	2-(CH(=NOMe))-4-pirimidinilo
5-metil-4-pirimidinilo	5-metoxi-4-pirimidinilo
5-(trifluorometil)-4-pirimidinilo	5-(CH(=NOMe))-4-pirimidinilo
6-metil-4-pirimidinilo	6-metoxi-4-pirimidinilo
6-(trifluorometil)-4-pirimidinilo	6-(CH(=NOMe))-4-pirimidinilo
3-metil-1-pirazolilo	3-metoxi-1-pirazolilo
3-(trifluorometil)-1-pirazolilo	3-(CH(=NOMe))-1-pirazolilo
4-metil-1-pirazolilo	4-metoxi-1-pirazolilo
4-(trifluorometil)-1-pirazolilo	4-(CH(=NOMe))-1-pirazolilo
5-metil-1-pirazolilo	5-metoxi-1-pirazolilo

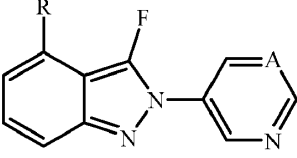
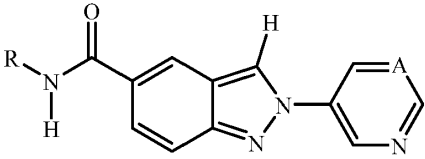
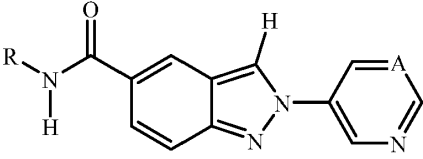
	
5-(trifluorometil)-1-pirazolilo	5-(CH(=NOMe))-1-pirazolilo
4-metil-1,2,3-triazin-2-ilo	4-metoksi-1,2,3-triazin-2-ilo
4-(trifluorometil)-1,2,3-triazin-2-ilo	4-(CH(=NOMe))-1,2,3-triazin-2-ilo
6-(2-pirimidinil)-2-piridinilo	2-(2-piridinil)-4-tiazolilo
2-(2-tiazolil)-4-tiazolilo	2-(2-pirimidinil)etinilo
1,3,4-oxadiazol-2-ilo	tetrahidro-3-furanilo
tetrahidro-2-furanilo	4,5-dihidro-3-isoxazolilo
3-isoxazolilo	fenilo
2-(trifluorometil)fenilo	3-(trifluorometil)fenilo
4-(trifluorometil)fenilo	6-(trifluorometil)-3-pirazinilo

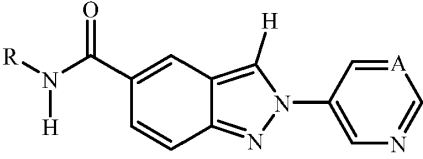
Tabla 2a

		
A es CH		
R	R	R
Me	Et	Pr
i-Pr	-CH ₂ (c-Pr)	-CH(Me)(c-Pr)
Bu	s-Bu	i-Bu
t-Bu	-CH ₂ Ph	-CH ₂ CH=CH ₂
-CH ₂ C≡CH	-C(Me) ₂ C≡CH	-CH ₂ CH ₂ F
-CH ₂ CHF ₂	-CH ₂ CF ₃	-CH(Me)CF ₃
-CH ₂ CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CF ₂ CF ₃	-CH ₂ CF ₂ CH ₃
-CH ₂ CH ₂ CF ₂ CF ₃	-CH(i-Pr)CF ₃	-CH ₂ CH ₂ OMe
-CH ₂ OEt	-CH ₂ CH ₂ O(i-Pr)	-CH ₂ CH ₂ OEt
-CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	-CH ₂ CH(Me)OMe	-CH(Et)CH ₂ OMe
-CH(Me)CH ₂ OMe	-CH ₂ CH ₂ S(O)Me	-CH ₂ CH ₂ SMe
-CH ₂ CH ₂ SEt	-CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	-CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et
-CH ₂ CH ₂ S(O)Et	-CH ₂ CH ₂ S(O)(t-Bu)	-CH ₂ CH ₂ S(t-Bu)
-CH(Me)CH ₂ SMe	-CH ₂ CH ₂ SO ₂ (t-Bu)	-CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me
-CH(Me)CH ₂ S(O)Me	-CH ₂ CH ₂ S(O)CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CF ₃

		
-CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₂ CF ₃
-CH ₂ CH ₂ S(O)CH ₂ CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CN	-CH ₂ CH ₂ CN
-C(Me) ₂ CN	-CH ₂ CH ₂ N(i-Pr) ₂	-CH ₂ CH ₂ N(Me) ₂
-CH ₂ CH(OMe) ₂	c-Pr	c-Bu
1-metilciclopropilo	3-metoxiciclobutilo	-CH(Ph)(c-Pr)
-CH(Me)(c-Pr)	3-tietanilo	3,3-difluorociclobutilo
3-oxetanilo	-CH ₂ (oxiranilo)	3-tietanilo-1,1-dióxido
3-tietanilo-1-óxido	-CH ₂ (CH(-OC(Me) ₂ OCH ₂ -))	-CH ₂ (tetrahidro-2-furanilo)
-CH ₂ (2-furanilo)	tetrahidro-2-furanilo	-CH ₂ (2-tienilo)
-CH ₂ (CH(-OCH ₂ CH ₂ O-))	-CH ₂ CO ₂ Me	-CH ₂ (2,2-difluorociclopropilo)
-C(-CH ₂ CH ₂ -)CO ₂ Me	-CH(Me)CO ₂ Et	-CH(i-Pr)CO ₂ Me
-CH ₂ C(O)NHMe	-CH ₂ C(O)NMe ₂	-CH(Me)C(O)NHMe
-CH(Me)C(O)NH(t-Bu)	-OCH ₂ (c-Pr)	-CH(Me)C(O)NMe ₂
-OCH ₂ CH=CH ₂	-NHC(O)(i-Pr)	-NHC(O)Me
-NHCO ₂ Me	-NHC(O)(3-piridinilo)	-NHC(O)(t-Bu)
-NHC(O)Ph	-NH(c-hexilo)	-NHC(O)NH(i-Pr)
-NH(c-Pr)	-NHC(O)(2-tienilo)	-NH(CH ₂ CF ₃)
-NHC(O)CF ₃	-NHCO ₂ Et	-NHC(O)(2-furanilo)
-C(O)C(O)Me	-NHCO ₂ CH ₂ CF ₃	-C(O)CO ₂ Me
-C(O)(2-piridinilo)	-NHC(O)NMe ₂	-NHC(O)NHMe
-NHC(O)NHCH ₂ CF ₃	-NHC(O)CH ₂ CH ₂ CF ₃	-NHC(O)Et
-NHC(O)CH ₂ CF ₃	-NHCO ₂ CF ₃	-NHCO ₂ CH ₂ CF ₃
-NHCO ₂ CH ₂ CH ₂ CF ₃	-NH(2-piridinilo)	-NH(3-piridinilo)
-NH(4-piridinilo)	-NH(2-pirimidinilo)	-NH(4-pirimidinilo)
-NH(5-pirimidinilo)	-NH(6-CF ₃ -2-piridinilo)	-NH(4-CF ₃ -2-piridinilo)
-NH(3-CF ₃ -2-piridinilo)	-NH(5-CF ₃ -2-pirimidinilo)	-NH(5-CF ₃ -2-piridinilo)
-NH(4-CF ₃ -2-pirimidinilo)	-NH(6-metil-2-piridinilo)	-NH(4-metil-2-piridinilo)
-NH(3-metil-2-piridinilo)	-NH(5-metil-2-pirimidinilo)	-NH(5-metil-2-piridinilo)
-NH(4-metil-2-pirimidinilo)	-NH(6-metoxi-2-piridinilo)	-NH(4-metoxi-2-piridinilo)
-NH(3-metoxi-2-piridinilo)	-NH(5-metoxi-2-pirimidinilo)	-NH(5-metoxi-2-piridinilo)
-NH(4-metoxi-2-pirimidinilo)	-CH ₂ (6-CF ₃ -2-piridinilo)	-CH ₂ (4-CF ₃ -2-piridinilo)
-CH ₂ (3-CF ₃ -2-piridinilo)	-CH ₂ (5-CF ₃ -2-pirimidinilo)	-CH ₂ (5-CF ₃ -2-piridinilo)

		
-CH ₂ (4-CF ₃ -2-pirimidinilo)	-CH ₂ (6-metil-2-piridinilo)	-CH ₂ (4-metil-2-piridinilo)
-CH ₂ (3-metil-2-piridinilo)	-CH ₂ (5-metil-2-pirimidinilo)	-CH ₂ (5-metil-2-piridinilo)
-CH ₂ (4-metil-2-pirimidinilo)	-CH ₂ (6-metoxi-2-piridinilo)	-CH ₂ (4-metoxi-2-piridinilo)
-CH ₂ (3-metoxi-2-piridinilo)	-CH ₂ (5-metoxi-2-pirimidinilo)	-CH ₂ (5-metoxi-2-piridinilo)
-CH ₂ (4-metoxi-2-pirimidinilo)	-CH ₂ (5-pirimidinilo)	-CH ₂ (6-bromo-2-piridinilo)
-CH ₂ (2-pirimidinilo)	-CH ₂ (3-(OCF ₃)fenilo)	-CH ₂ (2-tiazolilo)
-CH ₂ (5-metil-2-pirazinilo)	-CH ₂ (4-piridinilo)	-CH ₂ (2-piridinilo)
Ph	3-piridinilo	-CH ₂ (3-piridinilo)
2-piridinilo	2-pirazinilo	-CH ₂ CH ₂ (2-piridinilo)
4-piridinilo	4-CF ₃ -2-piridinilo	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ (2-piridinilo)
3-CF ₃ -2-piridinilo	4-CF ₃ -2-pirimidinilo	6-CF ₃ -2-piridinilo
5-CF ₃ -2-piridinilo	5-CF ₃ -2-pirazinilo	5-CF ₃ -2-pirimidinilo
-CH ₂ CH ₂ N(-C(O)CH ₂ CH ₂ C(O)-)	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ (1-imidazolilo)	-CH(-C(O)OCH ₂ CH ₂ -)
-CH ₂ (4-pirimidinilo)	Piridazinilo	6-CF ₃ -3-pirazinilo
A es CF		
R	R	R
Me	Et	Pr
i-Pr	-CH ₂ (c-Pr)	-CH(Me)(c-Pr)
Bu	s-Bu	i-Bu
t-Bu	-CH ₂ Ph	-CH ₂ CH=CH ₂
-CH ₂ C≡CH	-C(Me) ₂ C≡CH	-CH ₂ CH ₂ F
-CH ₂ CHF ₂	-CH ₂ CF ₃	-CH(Me)CF ₃
-CH ₂ CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CF ₂ CF ₃	-CH ₂ CF ₂ CH ₃
-CH ₂ CH ₂ CF ₂ CF ₃	-CH(i-Pr)CF ₃	-CH ₂ CH ₂ OMe
-CH ₂ OEt	-CH ₂ CH ₂ O(i-Pr)	-CH ₂ CH ₂ OEt
-CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	-CH ₂ CH(Me)OMe	-CH(Et)CH ₂ OMe
-CH(Me)CH ₂ OMe	-CH ₂ CH ₂ S(O)Me	-CH ₂ CH ₂ SMe
-CH ₂ CH ₂ SEt	-CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	-CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et
-CH ₂ CH ₂ S(O)Et	-CH ₂ CH ₂ S(O)(t-Bu)	-CH ₂ CH ₂ S(t-Bu)
-CH(Me)CH ₂ SMe	-CH ₂ CH ₂ SO ₂ (t-Bu)	-CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me
-CH(Me)CH ₂ S(O)Me	-CH ₂ CH ₂ S(O)CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CF ₃
-CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₂ CF ₃

		
-CH ₂ CH ₂ S(O)CH ₂ CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CN	-CH ₂ CH ₂ CN
-C(Me) ₂ CN	-CH ₂ CH ₂ N(i-Pr) ₂	-CH ₂ CH ₂ N(Me) ₂
-CH ₂ CH(OMe) ₂	c-Pr	c-Bu
1-metilciclopropilo	3-metoxiciclobutilo	-CH(Ph)(c-Pr)
-CH(Me)(c-Pr)	3-tietanilo	3,3-difluorociclobutilo
3-oxetanilo	-CH ₂ (oxiranilo)	3-tietanil-1,1-dióxido
3-tietanil-1-óxido	-CH ₂ (CH(-OC(Me) ₂ OCH ₂ -))	-CH ₂ (tetrahidro-2-furanilo)
-CH ₂ (2-furanilo)	tetrahidro-2-furanilo	-CH ₂ (2-tienilo)
-CH ₂ (CH(-OCH ₂ CH ₂ O-))	-CH ₂ CO ₂ Me	-CH ₂ (2,2-difluorociclopropilo)
-C(-CH ₂ CH ₂ -)CO ₂ Me	-CH(Me)CO ₂ Et	-CH(i-Pr)CO ₂ Me
-CH ₂ C(O)NHMe	-CH ₂ C(O)NMe ₂	-CH(Me)C(O)NHMe
-CH(Me)C(O)NH(t-Bu)	-OCH ₂ (c-Pr)	-CH(Me)C(O)NMe ₂
-OCH ₂ CH=CH ₂	-NHC(O)(i-Pr)	-NHC(O)Me
-NHCO ₂ Me	-NHC(O)(3-piridinilo)	-NHC(O)(t-Bu)
-NHC(O)Ph	-NH(c-hexilo)	-NHC(O)NH(i-Pr)
-NH(c-Pr)	-NHC(O)(2-tienilo)	-NH(CH ₂ CF ₃)
-NHC(O)CF ₃	-NHCO ₂ Et	-NHC(O)(2-furanilo)
-C(O)C(O)Me	-NHCO ₂ CH ₂ CF ₃	-C(O)CO ₂ Me
-C(O)(2-piridinilo)	-NHC(O)NMe ₂	-NHC(O)NHMe
-NHC(O)NHCH ₂ CF ₃	-NHC(O)CH ₂ CH ₂ CF ₃	-NHC(O)Et
-NHC(O)CH ₂ CF ₃	-NHCO ₂ CF ₃	-NHCO ₂ CH ₂ CF ₃
-NHCO ₂ CH ₂ CH ₂ CF ₃	-NH(2-piridinilo)	-NH(3-piridinilo)
-NH(4-piridinilo)	-NH(2-pirimidinilo)	-NH(4-pirimidinilo)
-NH(5-pirimidinilo)	-NH(6-CF ₃ -2-piridinilo)	-NH(4-CF ₃ -2-piridinilo)
-NH(3-CF ₃ -2-piridinilo)	-NH(5-CF ₃ -2-pirimidinilo)	-NH(5-CF ₃ -2-piridinilo)
-NH(4-CF ₃ -2-pirimidinilo)	-NH(6-metil-2-piridinilo)	-NH(4-metil-2-piridinilo)
-NH(3-metil-2-piridinilo)	-NH(5-metil-2-pirimidinilo)	-NH(5-metil-2-piridinilo)
-NH(4-metil-2-pirimidinilo)	-NH(6-metoxi-2-piridinilo)	-NH(4-metoxi-2-piridinilo)
-NH(3-metoxi-2-piridinilo)	-NH(5-metoxi-2-pirimidinilo)	-NH(5-metoxi-2-piridinilo)
-NH(4-metoxi-2-pirimidinilo)	-CH ₂ (6-CF ₃ -2-piridinilo)	-CH ₂ (4-CF ₃ -2-piridinilo)
-CH ₂ (3-CF ₃ -2-piridinilo)	-CH ₂ (5-CF ₃ -2-pirimidinilo)	-CH ₂ (5-CF ₃ -2-piridinilo)
-CH ₂ (4-CF ₃ -2-pirimidinilo)	-CH ₂ (6-metil-2-piridinilo)	-CH ₂ (4-metil-2-piridinilo)

		
-CH ₂ (3-metil-2-piridinilo)	-CH ₂ (5-metil-2-pirimidinilo)	-CH ₂ (5-metil-2-piridinilo)
-CH ₂ (4-metil-2-pirimidinilo)	-CH ₂ (6-metoxi-2-piridinilo)	-CH ₂ (4-metoxi-2-piridinilo)
-CH ₂ (3-metoxi-2-piridinilo)	-CH ₂ (5-metoxi-2-pirimidinilo)	-CH ₂ (5-metoxi-2-piridinilo)
-CH ₂ (4-metoxi-2-pirimidinilo)	-CH ₂ (5-pirimidinilo)	-CH ₂ (6-bromo-2-piridinilo)
-CH ₂ (2-pirimidinilo)	-CH ₂ (3-(OCF ₃)fenilo)	-CH ₂ (2-tiazolilo)
-CH ₂ (5-metil-2-pirazinilo)	-CH ₂ (4-piridinilo)	-CH ₂ (2-piridinilo)
Ph	3-piridinilo	-CH ₂ (3-piridinilo)
2-piridinilo	2-pirazinilo	-CH ₂ CH ₂ (2-piridinilo)
4-piridinilo	4-CF ₃ -2-piridinilo	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ (2-piridinilo)
3-CF ₃ -2-piridinilo	4-CF ₃ -2-pirimidinilo	6-CF ₃ -2-piridinilo
5-CF ₃ -2-piridinilo	5-CF ₃ -2-pirazinilo	5-CF ₃ -2-pirimidinilo
-CH ₂ CH ₂ N(-C(O)CH ₂ CH ₂ C(O)-)	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ (1-imidazolilo)	-CH(-C(O)OCH ₂ CH ₂ -)
-CH ₂ (4-pirimidinilo)	piridazinilo	6-CF ₃ -3-pirazinilo
A es N		
R	R	R
Me	Et	Pr
i-Pr	-CH ₂ (c-Pr)	-CH(Me)(c-Pr)
Bu	s-Bu	i-Bu
t-Bu	-CH ₂ Ph	-CH ₂ CH=CH ₂
-CH ₂ C≡CH	-C(Me) ₂ C≡CH	-CH ₂ CH ₂ F
-CH ₂ CHF ₂	-CH ₂ CF ₃	-CH(Me)CF ₃
-CH ₂ CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CF ₂ CF ₃	-CH ₂ CF ₂ CH ₃
-CH ₂ CH ₂ CF ₂ CF ₃	-CH(i-Pr)CF ₃	-CH ₂ CH ₂ OMe
-CH ₂ OEt	-CH ₂ CH ₂ O(i-Pr)	-CH ₂ CH ₂ OEt
-CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	-CH ₂ CH(Me)OMe	-CH(Et)CH ₂ OMe
-CH(Me)CH ₂ OMe	-CH ₂ CH ₂ S(O)Me	-CH ₂ CH ₂ SMe
-CH ₂ CH ₂ SEt	-CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	-CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et
-CH ₂ CH ₂ S(O)Et	-CH ₂ CH ₂ S(O)(t-Bu)	-CH ₂ CH ₂ S(t-Bu)
-CH(Me)CH ₂ SMe	-CH ₂ CH ₂ SO ₂ (t-Bu)	-CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me
-CH(Me)CH ₂ S(O)Me	-CH ₂ CH ₂ S(O)CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CF ₃
-CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₂ CF ₃
-CH ₂ CH ₂ S(O)CH ₂ CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CN	-CH ₂ CH ₂ CN

		
-C(Me) ₂ CN	-CH ₂ CH ₂ N(i-Pr) ₂	-CH ₂ CH ₂ N(Me) ₂
-CH ₂ CH(OMe) ₂	c-Pr	c-Bu
1-metilciclopropilo	3-metoxiciclobutilo	-CH(Ph)(c-Pr)
-CH(Me)(c-Pr)	3-tietanilo	3,3-difluorociclobutilo
3-oxetanilo	-CH ₂ (oxiranilo)	3-tietanil-1,1-dióxido
3-tietanil-1-óxido	-CH ₂ (CH(-OC(Me) ₂ OCH ₂ -))	-CH ₂ (tetrahidro-2-furanilo)
-CH ₂ (2-furanilo)	tetrahidro-2-furanilo	-CH ₂ (2-tienilo)
-CH ₂ (CH(-OCH ₂ CH ₂ O-))	-CH ₂ CO ₂ Me	-CH ₂ (2,2-difluorociclopropilo)
-C(-CH ₂ CH ₂ -)CO ₂ Me	-CH(Me)CO ₂ Et	-CH(i-Pr)CO ₂ Me
-CH ₂ C(O)NHMe	-CH ₂ C(O)NMe ₂	-CH(Me)C(O)NHMe
-CH(Me)C(O)NH(t-Bu)	-OCH ₂ (c-Pr)	-CH(Me)C(O)NMe ₂
-OCH ₂ CH=CH ₂	-NHC(O)(i-Pr)	-NHC(O)Me
-NHCO ₂ Me	-NHC(O)(3-piridinilo)	-NHC(O)(t-Bu)
-NHC(O)Ph	-NH(c-hexilo)	-NHC(O)NH(i-Pr)
-NH(c-Pr)	-NHC(O)(2-tienilo)	-NH(CH ₂ CF ₃)
-NHC(O)CF ₃	-NHCO ₂ Et	-NHC(O)(2-furanilo)
-C(O)C(O)Me	-NHCO ₂ CH ₂ CF ₃	-C(O)CO ₂ Me
-C(O)(2-piridinilo)	-NHC(O)NMe ₂	-NHC(O)NHMe
-NHC(O)NHCH ₂ CF ₃	-NHC(O)CH ₂ CH ₂ CF ₃	-NHC(O)Et
-NHC(O)CH ₂ CF ₃	-NHCO ₂ CF ₃	-NHCO ₂ CH ₂ CF ₃
-NHCO ₂ CH ₂ CH ₂ CF ₃	-NH(2-piridinilo)	-NH(3-piridinilo)
-NH(4-piridinilo)	-NH(2-pirimidinilo)	-NH(4-pirimidinilo)
-NH(5-pirimidinilo)	-NH(6-CF ₃ -2-piridinilo)	-NH(4-CF ₃ -2-piridinilo)
-NH(3-CF ₃ -2-piridinilo)	-NH(5-CF ₃ -2-pirimidinilo)	-NH(5-CF ₃ -2-piridinilo)
-NH(4-CF ₃ -2-pirimidinilo)	-NH(6-metil-2-piridinilo)	-NH(4-metil-2-piridinilo)
-NH(3-metil-2-piridinilo)	-NH(5-metil-2-pirimidinilo)	-NH(5-metil-2-piridinilo)
-NH(4-metil-2-pirimidinilo)	-NH(6-metoxi-2-piridinilo)	-NH(4-metoxi-2-piridinilo)
-NH(3-metoxi-2-piridinilo)	-NH(5-metoxi-2-pirimidinilo)	-NH(5-metoxi-2-piridinilo)
-NH(4-metoxi-2-pirimidinilo)	-CH ₂ (6-CF ₃ -2-piridinilo)	-CH ₂ (4-CF ₃ -2-piridinilo)
-CH ₂ (3-CF ₃ -2-piridinilo)	-CH ₂ (5-CF ₃ -2-pirimidinilo)	-CH ₂ (5-CF ₃ -2-piridinilo)
-CH ₂ (4-CF ₃ -2-pirimidinilo)	-CH ₂ (6-metil-2-piridinilo)	-CH ₂ (4-metil-2-piridinilo)
-CH ₂ (3-metil-2-piridinilo)	-CH ₂ (5-metil-2-pirimidinilo)	-CH ₂ (5-metil-2-piridinilo)

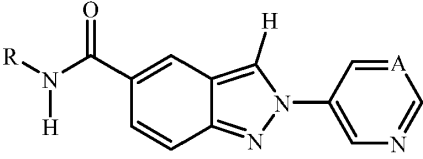
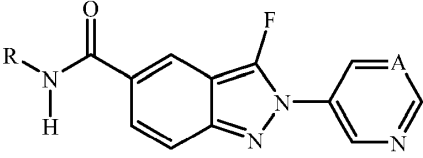

		
-CH ₂ (4-metil-2-pirimidinilo)	-CH ₂ (6-metoxi-2-piridinilo)	-CH ₂ (4-metoxi-2-piridinilo)
-CH ₂ (3-metoxi-2-piridinilo)	-CH ₂ (5-metoxi-2-pirimidinilo)	-CH ₂ (5-metoxi-2-piridinilo)
-CH ₂ (4-metoxi-2-pirimidinilo)	-CH ₂ (5-pirimidinilo)	-CH ₂ (6-bromo-2-piridinilo)
-CH ₂ (2-pirimidinilo)	-CH ₂ (3-(OCF ₃)fenilo)	-CH ₂ (2-tiazolilo)
-CH ₂ (5-metil-2-pirazinilo)	-CH ₂ (4-piridinilo)	-CH ₂ (2-piridinilo)
Ph	3-piridinilo	-CH ₂ (3-piridinilo)
2-piridinilo	2-pirazinilo	-CH ₂ CH ₂ (2-piridinilo)
4-piridinilo	4-CF ₃ -2-piridinilo	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ (2-piridinilo)
3-CF ₃ -2-piridinilo	4-CF ₃ -2-pirimidinilo	6-CF ₃ -2-piridinilo
5-CF ₃ -2-piridinilo	5-CF ₃ -2-pirazinilo	5-CF ₃ -2-pirimidinilo
-CH ₂ CH ₂ N(-C(O)CH ₂ CH ₂ C(O)-)	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ (1-imidazolilo)	-CH(-C(O)OCH ₂ CH ₂ -)
-CH ₂ (4-pirimidinilo)	piridazinilo	6-CF ₃ -3-pirazinilo

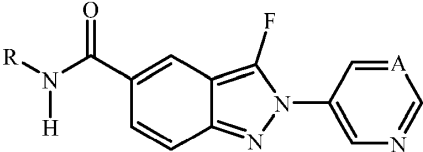
Tabla 2b

		
A es CH		
R	R	R
Me	Et	Pr
i-Pr	-CH ₂ (c-Pr)	-CH(Me)(c-Pr)
Bu	s-Bu	i-Bu
t-Bu	-CH ₂ Ph	-CH ₂ CH=CH ₂
-CH ₂ C≡CH	-C(Me) ₂ C≡CH	-CH ₂ CH ₂ F
-CH ₂ CHF ₂	-CH ₂ CF ₃	-CH(Me)CF ₃
-CH ₂ CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CF ₂ CF ₃	-CH ₂ CF ₂ CH ₃
-CH ₂ CH ₂ CF ₂ CF ₃	-CH(i-Pr)CF ₃	-CH ₂ CH ₂ OMe
-CH ₂ OEt	-CH ₂ CH ₂ O(i-Pr)	-CH ₂ CH ₂ OEt
-CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	-CH ₂ CH(Me)OMe	-CH(Et)CH ₂ OMe
-CH(Me)CH ₂ OMe	-CH ₂ CH ₂ S(O)Me	-CH ₂ CH ₂ SMe
-CH ₂ CH ₂ SEt	-CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	-CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et
-CH ₂ CH ₂ S(O)Et	-CH ₂ CH ₂ S(O)(t-Bu)	-CH ₂ CH ₂ S(t-Bu)

		
-CH(Me)CH ₂ SMe	-CH ₂ CH ₂ SO ₂ (t-Bu)	-CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me
-CH(Me)CH ₂ S(O)Me	-CH ₂ CH ₂ S(O)CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CF ₃
-CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₂ CF ₃
-CH ₂ CH ₂ S(O)CH ₂ CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CN	-CH ₂ CH ₂ CN
-C(Me) ₂ CN	-CH ₂ CH ₂ N(i-Pr) ₂	-CH ₂ CH ₂ N(Me) ₂
-CH ₂ CH(OMe) ₂	c-Pr	c-Bu
1-metilciclopropilo	3-metoxiciclobutilo	-CH(Ph)(c-Pr)
-CH(Me)(c-Pr)	3-tietanilo	3,3-difluorociclobutilo
3-oxetanilo	-CH ₂ (oxiranilo)	3-tietanil-1,1-dióxido
3-tietanil-1-óxido	-CH ₂ (CH(-OC(Me) ₂ OCH ₂ -))	-CH ₂ (tetrahidro-2-furanilo)
-CH ₂ (2-furanilo)	tetrahidro-2-furanilo	-CH ₂ (2-tienilo)
-CH ₂ (CH(-OCH ₂ CH ₂ O-))	-CH ₂ CO ₂ Me	-CH ₂ (2,2-difluorociclopropilo)
-C(-CH ₂ CH ₂ -)CO ₂ Me	-CH(Me)CO ₂ Et	-CH(i-Pr)CO ₂ Me
-CH ₂ C(O)NHMe	-CH ₂ C(O)NMe ₂	-CH(Me)C(O)NHMe
-CH(Me)C(O)NH(t-Bu)	-OCH ₂ (c-Pr)	-CH(Me)C(O)NMe ₂
-OCH ₂ CH=CH ₂	-NHC(O)(i-Pr)	-NHC(O)Me
-NHCO ₂ Me	-NHC(O)(3-piridinilo)	-NHC(O)(t-Bu)
-NHC(O)Ph	-NH(c-hexilo)	-NHC(O)NH(i-Pr)
-NH(c-Pr)	-NHC(O)(2-tienilo)	-NH(CH ₂ CF ₃)
-NHC(O)CF ₃	-NHCO ₂ Et	-NHC(O)(2-furanilo)
-C(O)C(O)Me	-NHCO ₂ CH ₂ CF ₃	-C(O)CO ₂ Me
-C(O)(2-piridinilo)	-NHC(O)NMe ₂	-NHC(O)NHMe
-NHC(O)NHCH ₂ CF ₃	-NHC(O)CH ₂ CH ₂ CF ₃	-NHC(O)Et
-NHC(O)CH ₂ CF ₃	-NHCO ₂ CF ₃	-NHCO ₂ CH ₂ CF ₃
-NHCO ₂ CH ₂ CH ₂ CF ₃	-NH(2-piridinilo)	-NH(3-piridinilo)
-NH(4-piridinilo)	-NH(2-pirimidinilo)	-NH(4-pirimidinilo)
-NH(5-pirimidinilo)	-NH(6-CF ₃ -2-piridinilo)	-NH(4-CF ₃ -2-piridinilo)
-NH(3-CF ₃ -2-piridinilo)	-NH(5-CF ₃ -2-pirimidinilo)	-NH(5-CF ₃ -2-piridinilo)
-NH(4-CF ₃ -2-pirimidinilo)	-NH(6-metil-2-piridinilo)	-NH(4-metil-2-piridinilo)
-NH(3-metil-2-piridinilo)	-NH(5-metil-2-pirimidinilo)	-NH(5-metil-2-piridinilo)
-NH(4-metil-2-pirimidinilo)	-NH(6-metoxi-2-piridinilo)	-NH(4-metoxi-2-piridinilo)
-NH(3-metoxi-2-piridinilo)	-NH(5-metoxi-2-pirimidinilo)	-NH(5-metoxi-2-piridinilo)

		
-NH(4-metoxi-2-pirimidinilo)	-CH ₂ (6-CF ₃ -2-piridinilo)	-CH ₂ (4-CF ₃ -2-piridinilo)
-CH ₂ (3-CF ₃ -2-piridinilo)	-CH ₂ (5-CF ₃ -2-piridinilo)	-CH ₂ (5-CF ₃ -2-piridinilo)
-CH ₂ (4-CF ₃ -2-piridinilo)	-CH ₂ (6-metil-2-piridinilo)	-CH ₂ (4-metil-2-piridinilo)
-CH ₂ (3-metil-2-piridinilo)	-CH ₂ (5-metil-2-piridinilo)	-CH ₂ (5-metil-2-piridinilo)
-CH ₂ (4-metil-2-piridinilo)	-CH ₂ (6-metoxi-2-piridinilo)	-CH ₂ (4-metoxi-2-piridinilo)
-CH ₂ (3-metoxi-2-piridinilo)	-CH ₂ (5-metoxi-2-piridinilo)	-CH ₂ (5-metoxi-2-piridinilo)
-CH ₂ (4-metoxi-2-piridinilo)	-CH ₂ (5-piridinilo)	-CH ₂ (6-bromo-2-piridinilo)
-CH ₂ (2-piridinilo)	-CH ₂ (3-(OCF ₃)fenilo)	-CH ₂ (2-tiazolilo)
-CH ₂ (5-metil-2-pirazinilo)	-CH ₂ (4-piridinilo)	-CH ₂ (2-piridinilo)
Ph	3-piridinilo	-CH ₂ (3-piridinilo)
2-piridinilo	2-pirazinilo	-CH ₂ CH ₂ (2-piridinilo)
4-piridinilo	4-CF ₃ -2-piridinilo	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ (2-piridinilo)
3-CF ₃ -2-piridinilo	4-CF ₃ -2-piridinilo	6-CF ₃ -2-piridinilo
5-CF ₃ -2-piridinilo	5-CF ₃ -2-pirazinilo	5-CF ₃ -2-piridinilo
-CH ₂ CH ₂ N(-C(O)CH ₂ CH ₂ C(O)-)	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ (1-imidazolilo)	-CH(-C(O)OCH ₂ CH ₂ -)
-CH ₂ (4-piridinilo)	piridazinilo	6-CF ₃ -3-pirazinilo
A es CF		
R	R	R
Me	Et	Pr
i-Pr	-CH ₂ (c-Pr)	-CH(Me)(c-Pr)
Bu	s-Bu	i-Bu
t-Bu	-CH ₂ Ph	-CH ₂ CH=CH ₂
-CH ₂ C≡CH	-C(Me) ₂ C≡CH	-CH ₂ CH ₂ F
-CH ₂ CHF ₂	-CH ₂ CF ₃	-CH(Me)CF ₃
-CH ₂ CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CF ₂ CF ₃	-CH ₂ CF ₂ CH ₃
-CH ₂ CH ₂ CF ₂ CF ₃	-CH(i-Pr)CF ₃	-CH ₂ CH ₂ OMe
-CH ₂ OEt	-CH ₂ CH ₂ O(i-Pr)	-CH ₂ CH ₂ OEt
-CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	-CH ₂ CH(Me)OMe	-CH(Et)CH ₂ OMe
-CH(Me)CH ₂ OMe	-CH ₂ CH ₂ S(O)Me	-CH ₂ CH ₂ SMe
-CH ₂ CH ₂ SEt	-CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	-CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et
-CH ₂ CH ₂ S(O)Et	-CH ₂ CH ₂ S(O)(t-Bu)	-CH ₂ CH ₂ S(t-Bu)
-CH(Me)CH ₂ SMe	-CH ₂ CH ₂ SO ₂ (t-Bu)	-CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me

-CH(Me)CH ₂ S(O)Me	-CH ₂ CH ₂ S(O)CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CF ₃
-CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₂ CF ₃
-CH ₂ CH ₂ S(O)CH ₂ CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CN	-CH ₂ CH ₂ CN
-C(Me) ₂ CN	-CH ₂ CH ₂ N(i-Pr) ₂	-CH ₂ CH ₂ N(Me) ₂
-CH ₂ CH(OMe) ₂	c-Pr	c-Bu
1-metilciclopropilo	3-metoxiciclobutilo	-CH(Ph)(c-Pr)
-CH(Me)(c-Pr)	3-tietanilo	3,3-difluorociclobutilo
3-oxetanilo	-CH ₂ (oxiranilo)	3-tietanil-1,1-dióxido
3-tietanil-1-óxido	-CH ₂ (CH(-OC(Me) ₂ OCH ₂ -))	-CH ₂ (tetrahidro-2-furanilo)
-CH ₂ (2-furanilo)	tetrahidro-2-furanilo	-CH ₂ (2-tienilo)
-CH ₂ (CH(-OCH ₂ CH ₂ O-))	-CH ₂ CO ₂ Me	-CH ₂ (2,2-difluorociclopropilo)
-C(-CH ₂ CH ₂ -)CO ₂ Me	-CH(Me)CO ₂ Et	-CH(i-Pr)CO ₂ Me
-CH ₂ C(O)NHMe	-CH ₂ C(O)NMe ₂	-CH(Me)C(O)NHMe
-CH(Me)C(O)NH(t-Bu)	-OCH ₂ (c-Pr)	-CH(Me)C(O)NMe ₂
-OCH ₂ CH=CH ₂	-NHC(O)(i-Pr)	-NHC(O)Me
-NHCO ₂ Me	-NHC(O)(3-piridinilo)	-NHC(O)(t-Bu)
-NHC(O)Ph	-NH(c-hexilo)	-NHC(O)NH(i-Pr)
-NH(c-Pr)	-NHC(O)(2-tienilo)	-NH(CH ₂ CF ₃)
-NHC(O)CF ₃	-NHCO ₂ Et	-NHC(O)(2-furanilo)
-C(O)C(O)Me	-NHCO ₂ CH ₂ CF ₃	-C(O)CO ₂ Me
-C(O)(2-piridinilo)	-NHC(O)NMe ₂	-NHC(O)NHMe
-NHC(O)NHCH ₂ CF ₃	-NHC(O)CH ₂ CH ₂ CF ₃	-NHC(O)Et
-NHC(O)CH ₂ CF ₃	-NHCO ₂ CF ₃	-NHCO ₂ CH ₂ CF ₃
-NHCO ₂ CH ₂ CH ₂ CF ₃	-NH(2-piridinilo)	-NH(3-piridinilo)
-NH(4-piridinilo)	-NH(2-pirimidinilo)	-NH(4-pirimidinilo)
-NH(5-pirimidinilo)	-NH(6-CF ₃ -2-piridinilo)	-NH(4-CF ₃ -2-piridinilo)
-NH(3-CF ₃ -2-piridinilo)	-NH(5-CF ₃ -2-pirimidinilo)	-NH(5-CF ₃ -2-piridinilo)
-NH(4-CF ₃ -2-pirimidinilo)	-NH(6-metil-2-piridinilo)	-NH(4-metil-2-piridinilo)
-NH(3-metil-2-piridinilo)	-NH(5-metil-2-pirimidinilo)	-NH(5-metil-2-piridinilo)
-NH(4-metil-2-pirimidinilo)	-NH(6-metoxi-2-piridinilo)	-NH(4-metoxi-2-piridinilo)
-NH(3-metoxi-2-piridinilo)	-NH(5-metoxi-2-pirimidinilo)	-NH(5-metoxi-2-piridinilo)
-NH(4-metoxi-2-pirimidinilo)	-CH ₂ (6-CF ₃ -2-piridinilo)	-CH ₂ (4-CF ₃ -2-piridinilo)

		
-CH ₂ (3-CF ₃ -2-piridinilo)	-CH ₂ (5-CF ₃ -2-pirimidinilo)	-CH ₂ (5-CF ₃ -2-piridinilo)
-CH ₂ (4-CF ₃ -2-pirimidinilo)	-CH ₂ (6-metil-2-piridinilo)	-CH ₂ (4-metil-2-piridinilo)
-CH ₂ (3-metil-2-piridinilo)	-CH ₂ (5-metil-2-pirimidinilo)	-CH ₂ (5-metil-2-piridinilo)
-CH ₂ (4-metil-2-pirimidinilo)	-CH ₂ (6-metoxi-2-piridinilo)	-CH ₂ (4-metoxi-2-piridinilo)
-CH ₂ (3-metoxi-2-piridinilo)	-CH ₂ (5-metoxi-2-pirimidinilo)	-CH ₂ (5-metoxi-2-piridinilo)
-CH ₂ (4-metoxi-2-pirimidinilo)	-CH ₂ (5-pirimidinilo)	-CH ₂ (6-bromo-2-piridinilo)
-CH ₂ (2-pirimidinilo)	-CH ₂ (3-(OCF ₃)fenilo)	-CH ₂ (2-tiazolilo)
-CH ₂ (5-metil-2-pirazinilo)	-CH ₂ (4-piridinilo)	-CH ₂ (2-piridinilo)
Ph	3-piridinilo	-CH ₂ (3-piridinilo)
2-piridinilo	2-pirazinilo	-CH ₂ CH ₂ (2-piridinilo)
4-piridinilo	4-CF ₃ -2-piridinilo	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ (2-piridinilo)
3-CF ₃ -2-piridinilo	4-CF ₃ -2-pirimidinilo	6-CF ₃ -2-piridinilo
5-CF ₃ -2-piridinilo	5-CF ₃ -2-pirazinilo	5-CF ₃ -2-pirimidinilo
-CH ₂ CH ₂ N(-C(O)CH ₂ CH ₂ C(O)-)	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ (1-imidazolilo)	-CH(-C(O)OCH ₂ CH ₂ -)
-CH ₂ (4-pirimidinilo)	piridazinilo	6-CF ₃ -3-pirazinilo
A es N		
R	R	R
Me	Et	Pr
i-Pr	-CH ₂ (c-Pr)	-CH(Me)(c-Pr)
Bu	s-Bu	i-Bu
t-Bu	-CH ₂ Ph	-CH ₂ CH=CH ₂
-CH ₂ C≡CH	-C(Me) ₂ C≡CH	-CH ₂ CH ₂ F
-CH ₂ CHF ₂	-CH ₂ CF ₃	-CH(Me)CF ₃
-CH ₂ CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CF ₂ CF ₃	-CH ₂ CF ₂ CH ₃
-CH ₂ CH ₂ CF ₂ CF ₃	-CH(i-Pr)CF ₃	-CH ₂ CH ₂ OMe
-CH ₂ OEt	-CH ₂ CH ₂ O(i-Pr)	-CH ₂ CH ₂ OEt
-CH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	-CH ₂ CH(Me)OMe	-CH(Et)CH ₂ OMe
-CH(Me)CH ₂ OMe	-CH ₂ CH ₂ S(O)Me	-CH ₂ CH ₂ SMe
-CH ₂ CH ₂ SEt	-CH ₂ CH ₂ SO ₂ Me	-CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et
-CH ₂ CH ₂ S(O)Et	-CH ₂ CH ₂ S(O)(t-Bu)	-CH ₂ CH ₂ S(t-Bu)
-CH(Me)CH ₂ SMe	-CH ₂ CH ₂ SO ₂ (t-Bu)	-CH(Me)CH ₂ SO ₂ Me
-CH(Me)CH ₂ S(O)Me	-CH ₂ CH ₂ S(O)CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CF ₃

		
-CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₂ CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₂ CF ₃
-CH ₂ CH ₂ S(O)CH ₂ CH ₂ CF ₃	-CH ₂ CN	-CH ₂ CH ₂ CN
-C(Me) ₂ CN	-CH ₂ CH ₂ N(i-Pr) ₂	-CH ₂ CH ₂ N(Me) ₂
-CH ₂ CH(OMe) ₂	c-Pr	c-Bu
1-metilciclopropilo	3-metoxiciclobutilo	-CH(Ph)(c-Pr)
-CH(Me)(c-Pr)	3-tietanilo	3,3-difluorociclobutilo
3-oxetanilo	-CH ₂ (oxiranilo)	3-tietanil-1,1-dióxido
3-tietanil-1-óxido	-CH ₂ (CH(-OC(Me) ₂ OCH ₂ -))	-CH ₂ (tetrahidro-2-furanilo)
-CH ₂ (2-furanilo)	tetrahidro-2-furanilo	-CH ₂ (2-tienilo)
-CH ₂ (CH(-OCH ₂ CH ₂ O-))	-CH ₂ CO ₂ Me	-CH ₂ (2,2-difluorociclopropilo)
-C(-CH ₂ CH ₂ -)CO ₂ Me	-CH(Me)CO ₂ Et	-CH(i-Pr)CO ₂ Me
-CH ₂ C(O)NHMe	-CH ₂ C(O)NMe ₂	-CH(Me)C(O)NHMe
-CH(Me)C(O)NH(t-Bu)	-OCH ₂ (c-Pr)	-CH(Me)C(O)NMe ₂
-OCH ₂ CH=CH ₂	-NHC(O)(i-Pr)	-NHC(O)Me
-NHCO ₂ Me	-NHC(O)(3-piridinilo)	-NHC(O)(t-Bu)
-NHC(O)Ph	-NH(c-hexilo)	-NHC(O)NH(i-Pr)
-NH(c-Pr)	-NHC(O)(2-tienilo)	-NH(CH ₂ CF ₃)
-NHC(O)CF ₃	-NHCO ₂ Et	-NHC(O)(2-furanilo)
-C(O)C(O)Me	-NHCO ₂ CH ₂ CF ₃	-C(O)CO ₂ Me
-C(O)(2-piridinilo)	-NHC(O)NMe ₂	-NHC(O)NHMe
-NHC(O)NHCH ₂ CF ₃	-NHC(O)CH ₂ CH ₂ CF ₃	-NHC(O)Et
-NHC(O)CH ₂ CF ₃	-NHSO ₂ CF ₃	-NHSO ₂ CH ₂ CF ₃
-NHSO ₂ CH ₂ CH ₂ CF ₃	-NH(2-piridinilo)	-NH(3-piridinilo)
-NH(4-piridinilo)	-NH(2-pirimidinilo)	-NH(4-pirimidinilo)
-NH(5-pirimidinilo)	-NH(6-CF ₃ -2-piridinilo)	-NH(4-CF ₃ -2-piridinilo)
-NH(3-CF ₃ -2-piridinilo)	-NH(5-CF ₃ -2-pirimidinilo)	-NH(5-CF ₃ -2-piridinilo)
-NH(4-CF ₃ -2-pirimidinilo)	-NH(6-metil-2-piridinilo)	-NH(4-metil-2-piridinilo)
-NH(3-metil-2-piridinilo)	-NH(5-metil-2-pirimidinilo)	-NH(5-metil-2-piridinilo)
-NH(4-metil-2-pirimidinilo)	-NH(6-metoxi-2-piridinilo)	-NH(4-metoxi-2-piridinilo)
-NH(3-metoxi-2-piridinilo)	-NH(5-metoxi-2-pirimidinilo)	-NH(5-metoxi-2-piridinilo)
-NH(4-metoxi-2-pirimidinilo)	-CH ₂ (6-CF ₃ -2-piridinilo)	-CH ₂ (4-CF ₃ -2-piridinilo)
-CH ₂ (3-CF ₃ -2-piridinilo)	-CH ₂ (5-CF ₃ -2-pirimidinilo)	-CH ₂ (5-CF ₃ -2-piridinilo)


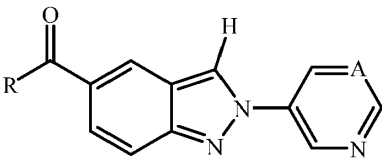
		
-CH ₂ (4-CF ₃ -2-pirimidinilo)	-CH ₂ (6-metil-2-piridinilo)	-CH ₂ (4-metil-2-piridinilo)
-CH ₂ (3-metil-2-piridinilo)	-CH ₂ (5-metil-2-pirimidinilo)	-CH ₂ (5-metil-2-piridinilo)
-CH ₂ (4-metil-2-pirimidinilo)	-CH ₂ (6-metoxi-2-piridinilo)	-CH ₂ (4-metoxi-2-piridinilo)
-CH ₂ (3-metoxi-2-piridinilo)	-CH ₂ (5-metoxi-2-pirimidinilo)	-CH ₂ (5-metoxi-2-piridinilo)
-CH ₂ (4-metoxi-2-pirimidinilo)	-CH ₂ (5-pirimidinilo)	-CH ₂ (6-bromo-2-piridinilo)
-CH ₂ (2-pirimidinilo)	-CH ₂ (3-(OCF ₃)fenilo)	-CH ₂ (2-tiazolilo)
-CH ₂ (5-metil-2-pirazinilo)	-CH ₂ (4-piridinilo)	-CH ₂ (2-piridinilo)
Ph	3-piridinilo	-CH ₂ (3-piridinilo)
2-piridinilo	2-pirazinilo	-CH ₂ CH ₂ (2-piridinilo)
4-piridinilo	4-CF ₃ -2-piridinilo	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ (2-piridinilo)
3-CF ₃ -2-piridinilo	4-CF ₃ -2-pirimidinilo	6-CF ₃ -2-piridinilo
5-CF ₃ -2-piridinilo	5-CF ₃ -2-pirazinilo	5-CF ₃ -2-pirimidinilo
-CH ₂ CH ₂ N(-C(O)CH ₂ CH ₂ C(O)-)	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ (1-imidazolilo)	-CH(-C(O)OCH ₂ CH ₂ -)
-CH ₂ (4-pirimidinilo)	piridazinilo	6-CF ₃ -3-pirazinilo

Tabla 2c

	
A es CH	
R	R
N(-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -)	N(-CH ₂ CH(OMe)CH ₂ -)
N(-CH ₂ CH ₂ CF ₂ CH ₂ CH ₂ -)	N(-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CF ₂ CH ₂ -)
N(-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -)	N(-CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₂ -)
N(-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -)	N(-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -)
N(-CH ₂ CH ₂ N(C(O)(c-Pr))CH ₂ CH ₂ -)	N(-CH ₂ CH ₂ N(Me)CH ₂ CH ₂ -)
N(-CH ₂ C(Me) ₂ N=CH-)	N(-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)CH ₂ -)
N(CH ₂ C≡CH) ₂	N(Et) ₂
N(Pr)CH ₂ (c-Pr)	N(Et)(c-hexilo)
N(-CHC(O)SCH ₂ CH ₂ -)	
A es CF	
R	R
N(-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -)	N(-CH ₂ CH(OMe)CH ₂ -)

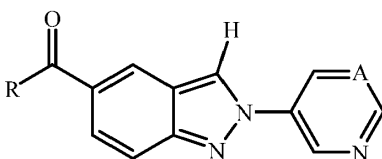
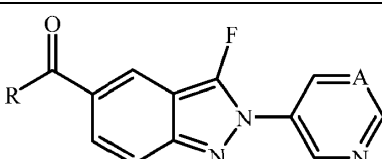
	
N(-CH ₂ CH ₂ CF ₂ CH ₂ CH ₂ -)	N(-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CF ₂ CH ₂ -)
N(-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -)	N(-CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₂ -)
N(-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -)	N(-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -)
N(-CH ₂ CH ₂ N(C(O)(c-Pr))CH ₂ CH ₂ -)	N(-CH ₂ CH ₂ N(Me)CH ₂ CH ₂ -)
N(-CH ₂ C(Me) ₂ N=CH-)	N(-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)CH ₂ -)
N(CH ₂ C≡CH) ₂	N(Et) ₂
N(Pr)CH ₂ (c-Pr)	N(Et)(c-hexilo)
N(-CHC(O)SCH ₂ CH ₂ -)	
A es N	
R	R
N(-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -)	N(-CH ₂ CH(OMe)CH ₂ -)
N(-CH ₂ CH ₂ CF ₂ CH ₂ CH ₂ -)	N(-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CF ₂ CH ₂ -)
N(-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -)	N(-CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₂ -)
N(-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -)	N(-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -)
N(-CH ₂ CH ₂ N(C(O)(c-Pr))CH ₂ CH ₂ -)	N(-CH ₂ CH ₂ N(Me)CH ₂ CH ₂ -)
N(-CH ₂ C(Me) ₂ N=CH-)	N(-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)CH ₂ -)
N(CH ₂ C≡CH) ₂	N(Et) ₂
N(Pr)CH ₂ (c-Pr)	N(Et)(c-hexilo)
N(-CHC(O)SCH ₂ CH ₂ -)	

Tabla 2d

	
A es CH	
R	R
N(-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -)	N(-CH ₂ CH(OMe)CH ₂ -)
N(-CH ₂ CH ₂ CF ₂ CH ₂ CH ₂ -)	N(-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CF ₂ CH ₂ -)
N(-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -)	N(-CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₂ -)
N(-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -)	N(-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -)
N(-CH ₂ CH ₂ N(C(O)(c-Pr))CH ₂ CH ₂ -)	N(-CH ₂ CH ₂ N(Me)CH ₂ CH ₂ -)
N(-CH ₂ C(Me) ₂ N=CH-)	N(-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)CH ₂ -)
N(CH ₂ C≡CH) ₂	N(Et) ₂

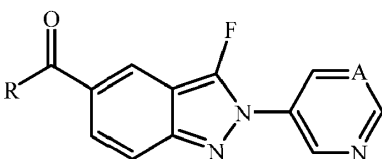
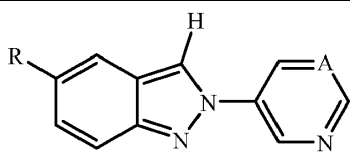
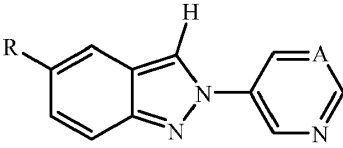
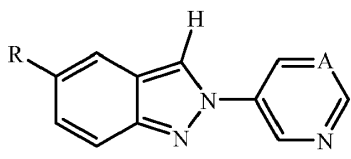
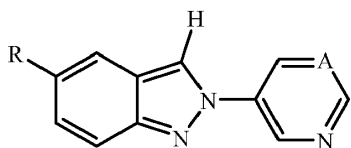
	
N(Pr)CH ₂ (c-Pr)	N(Et)(c-hexilo)
N(-CHC(O)SCH ₂ CH ₂ -)	
A es CF	
R	R
N(-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -)	N(-CH ₂ CH(OMe)CH ₂ -)
N(-CH ₂ CH ₂ CF ₂ CH ₂ CH ₂ -)	N(-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CF ₂ CH ₂ -)
N(-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -)	N(-CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₂ -)
N(-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -)	N(-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -)
N(-CH ₂ CH ₂ N(C(O)(c-Pr))CH ₂ CH ₂ -)	N(-CH ₂ CH ₂ N(Me)CH ₂ CH ₂ -)
N(-CH ₂ C(Me) ₂ N=CH-)	N(-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)CH ₂ -)
N(CH ₂ C≡CH) ₂	N(Et) ₂
N(Pr)CH ₂ (c-Pr)	N(Et)(c-hexilo)
N(-CHC(O)SCH ₂ CH ₂ -)	
A es N	
R	R
N(-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -)	N(-CH ₂ CH(OMe)CH ₂ -)
N(-CH ₂ CH ₂ CF ₂ CH ₂ CH ₂ -)	N(-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CF ₂ CH ₂ -)
N(-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -)	N(-CH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₂ -)
N(-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ -)	N(-CH ₂ CH ₂ OCH ₂ CH ₂ -)
N(-CH ₂ CH ₂ N(C(O)(c-Pr))CH ₂ CH ₂ -)	N(-CH ₂ CH ₂ N(Me)CH ₂ CH ₂ -)
N(-CH ₂ C(Me) ₂ N=CH-)	N(-CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH(CF ₃)CH ₂ -)
N(CH ₂ C≡CH) ₂	N(Et) ₂
N(Pr)CH ₂ (c-Pr)	N(Et)(c-hexilo)
N(-CHC(O)SCH ₂ CH ₂ -)	

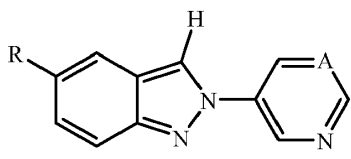
Tabla 2e

	
A es CH	
R	R
3-metil-2-piridinilo	3-metoxi-2-piridinilo
3-(trifluorometil)-2-piridinilo	3-(CH(=NOMe))-2-piridinilo

	
4-metil-2-piridinilo	4-metoksi-2-piridinilo
4-(trifluorometil)-2-piridinilo	4-(CH(=NOMe))-2-piridinilo
5-metil-2-piridinilo	5-metoksi-2-piridinilo
5-(trifluorometil)-2-piridinilo	5-(CH(=NOMe))-2-piridinilo
6-metil-2-piridinilo	6-metoksi-2-piridinilo
6-(trifluorometil)-2-piridinilo	6-(CH(=NOMe))-2-piridinilo
2-metil-3-piridinilo	2-metoksi-3-piridinilo
2-(trifluorometil)-3-piridinilo	2-(CH(=NOMe))-3-piridinilo
4-metil-3-piridinilo	4-metoksi-3-piridinilo
4-(trifluorometil)-3-piridinilo	4-(CH(=NOMe))-3-piridinilo
5-metil-3-piridinilo	5-metoksi-3-piridinilo
5-(trifluorometil)-3-piridinilo	5-(CH(=NOMe))-3-piridinilo
6-metil-3-piridinilo	6-metoksi-3-piridinilo
6-(trifluorometil)-3-piridinilo	6-(CH(=NOMe))-3-piridinilo
2-metil-4-piridinilo	2-metoksi-4-piridinilo
2-(trifluorometil)-4-piridinilo	2-(CH(=NOMe))-4-piridinilo
3-metil-4-piridinilo	3-metoksi-4-piridinilo
3-(trifluorometil)-4-piridinilo	3-(CH(=NOMe))-4-piridinilo
3-metil-2-pirazinilo	3-metoksi-2-pirazinilo
3-(trifluorometil)-2-pirazinilo	3-(CH(=NOMe))-2-pirazinilo
5-metil-2-pirazinilo	5-metoksi-2-pirazinilo
5-(trifluorometil)-2-pirazinilo	5-(CH(=NOMe))-2-pirazinilo
6-metil-2-pirazinilo	6-metoksi-2-pirazinilo
6-(trifluorometil)-2-pirazinilo	6-(CH(=NOMe))-2-pirazinilo
4-metil-2-pirimidinilo	4-metoksi-2-pirimidinilo
4-(trifluorometil)-2-pirimidinilo	4-(CH(=NOMe))-2-pirimidinilo
5-metil-2-pirimidinilo	5-metoksi-2-pirimidinilo
5-(trifluorometil)-2-pirimidinilo	5-(CH(=NOMe))-2-pirimidinilo
2-metil-4-pirimidinilo	2-metoksi-4-pirimidinilo
2-(trifluorometil)-4-pirimidinilo	2-(CH(=NOMe))-4-pirimidinilo
5-metil-4-pirimidinilo	5-metoksi-4-pirimidinilo
5-(trifluorometil)-4-pirimidinilo	5-(CH(=NOMe))-4-pirimidinilo

	
6-metil-4-pirimidinilo	6-metoksi-4-pirimidinilo
6-(trifluorometil)-4-pirimidinilo	6-(CH(=NOMe))-4-pirimidinilo
3-metil-1-pirazolilo	3-metoksi-1-pirazolilo
3-(trifluorometil)-1-pirazolilo	3-(CH(=NOMe))-1-pirazolilo
4-metil-1-pirazolilo	4-metoksi-1-pirazolilo
4-(trifluorometil)-1-pirazolilo	4-(CH(=NOMe))-1-pirazolilo
5-metil-1-pirazolilo	5-metoksi-1-pirazolilo
5-(trifluorometil)-1-pirazolilo	5-(CH(=NOMe))-1-pirazolilo
4-metil-1,2,3-triazin-2-ilo	4-metoksi-1,2,3-triazin-2-ilo
4-(trifluorometil)-1,2,3-triazin-2-ilo	4-(CH(=NOMe))-1,2,3-triazin-2-ilo
6-(2-pirimidinil)-2-piridinilo	2-(2-piridinil)-4-tiazolilo
2-(2-tiazolil)-4-tiazolilo	2-(2-pirimidinil)etinilo
1,3,4-oxadiazol-2-ilo	tetrahidro-3-furanilo
tetrahidro-2-furanilo	4,5-dihidro-3-isoxazolilo
3-isoxazolilo	6-(trifluorometil)-3-pirazinilo
A es CF	
R	R
3-metil-2-piridinilo	3-metoksi-2-piridinilo
3-(trifluorometil)-2-piridinilo	3-(CH(=NOMe))-2-piridinilo
4-metil-2-piridinilo	4-metoksi-2-piridinilo
4-(trifluorometil)-2-piridinilo	4-(CH(=NOMe))-2-piridinilo
5-metil-2-piridinilo	5-metoksi-2-piridinilo
5-(trifluorometil)-2-piridinilo	5-(CH(=NOMe))-2-piridinilo
6-metil-2-piridinilo	6-metoksi-2-piridinilo
6-(trifluorometil)-2-piridinilo	6-(CH(=NOMe))-2-piridinilo
2-metil-3-piridinilo	2-metoksi-3-piridinilo
2-(trifluorometil)-3-piridinilo	2-(CH(=NOMe))-3-piridinilo
4-metil-3-piridinilo	4-metoksi-3-piridinilo
4-(trifluorometil)-3-piridinilo	4-(CH(=NOMe))-3-piridinilo
5-metil-3-piridinilo	5-metoksi-3-piridinilo
5-(trifluorometil)-3-piridinilo	5-(CH(=NOMe))-3-piridinilo
6-metil-3-piridinilo	6-metoksi-3-piridinilo

	
6-(trifluorometil)-3-piridinilo	6-(CH(=NOMe))-3-piridinilo
2-metil-4-piridinilo	2-metoksi-4-piridinilo
2-(trifluorometil)-4-piridinilo	2-(CH(=NOMe))-4-piridinilo
3-metil-4-piridinilo	3-metoksi-4-piridinilo
3-(trifluorometil)-4-piridinilo	3-(CH(=NOMe))-4-piridinilo
3-metil-2-pirazinilo	3-metoksi-2-pirazinilo
3-(trifluorometil)-2-pirazinilo	3-(CH(=NOMe))-2-pirazinilo
5-metil-2-pirazinilo	5-metoksi-2-pirazinilo
5-(trifluorometil)-2-pirazinilo	5-(CH(=NOMe))-2-pirazinilo
6-metil-2-pirazinilo	6-metoksi-2-pirazinilo
6-(trifluorometil)-2-pirazinilo	6-(CH(=NOMe))-2-pirazinilo
4-metil-2-pirimidinilo	4-metoksi-2-pirimidinilo
4-(trifluorometil)-2-pirimidinilo	4-(CH(=NOMe))-2-pirimidinilo
5-metil-2-pirimidinilo	5-metoksi-2-pirimidinilo
5-(trifluorometil)-2-pirimidinilo	5-(CH(=NOMe))-2-pirimidinilo
2-metil-4-pirimidinilo	2-metoksi-4-pirimidinilo
2-(trifluorometil)-4-pirimidinilo	2-(CH(=NOMe))-4-pirimidinilo
5-metil-4-pirimidinilo	5-metoksi-4-pirimidinilo
5-(trifluorometil)-4-pirimidinilo	5-(CH(=NOMe))-4-pirimidinilo
6-metil-4-pirimidinilo	6-metoksi-4-pirimidinilo
6-(trifluorometil)-4-pirimidinilo	6-(CH(=NOMe))-4-pirimidinilo
3-metil-1-pirazolilo	3-metoksi-1-pirazolilo
3-(trifluorometil)-1-pirazolilo	3-(CH(=NOMe))-1-pirazolilo
4-metil-1-pirazolilo	4-metoksi-1-pirazolilo
4-(trifluorometil)-1-pirazolilo	4-(CH(=NOMe))-1-pirazolilo
5-metil-1-pirazolilo	5-metoksi-1-pirazolilo
5-(trifluorometil)-1-pirazolilo	5-(CH(=NOMe))-1-pirazolilo
4-metil-1,2,3-triazin-2-ilo	4-metoksi-1,2,3-triazin-2-ilo
4-(trifluorometil)-1,2,3-triazin-2-ilo	4-(CH(=NOMe))-1,2,3-triazin-2-ilo
6-(2-pirimidinil)-2-piridinilo	2-(2-piridinil)-4-tiazolilo
2-(2-tiazolil)-4-tiazolilo	2-(2-pirimidinil)etinilo
1,3,4-oxadiazol-2-ilo	tetrahidro-3-furanilo

	
tetrahidro-2-furanilo	4,5-dihidro-3-isoxazolilo
3-isoxazolilo	6-(trifluorometil)-3-pirazinilo
A es N	
R	R
3-metil-2-piridinilo	3-metoxi-2-piridinilo
3-(trifluorometil)-2-piridinilo	3-(CH(=NOMe))-2-piridinilo
4-metil-2-piridinilo	4-metoxi-2-piridinilo
4-(trifluorometil)-2-piridinilo	4-(CH(=NOMe))-2-piridinilo
5-metil-2-piridinilo	5-metoxi-2-piridinilo
5-(trifluorometil)-2-piridinilo	5-(CH(=NOMe))-2-piridinilo
6-metil-2-piridinilo	6-metoxi-2-piridinilo
6-(trifluorometil)-2-piridinilo	6-(CH(=NOMe))-2-piridinilo
2-metil-3-piridinilo	2-metoxi-3-piridinilo
2-(trifluorometil)-3-piridinilo	2-(CH(=NOMe))-3-piridinilo
4-metil-3-piridinilo	4-metoxi-3-piridinilo
4-(trifluorometil)-3-piridinilo	4-(CH(=NOMe))-3-piridinilo
5-metil-3-piridinilo	5-metoxi-3-piridinilo
5-(trifluorometil)-3-piridinilo	5-(CH(=NOMe))-3-piridinilo
6-metil-3-piridinilo	6-metoxi-3-piridinilo
6-(trifluorometil)-3-piridinilo	6-(CH(=NOMe))-3-piridinilo
2-metil-4-piridinilo	2-metoxi-4-piridinilo
2-(trifluorometil)-4-piridinilo	2-(CH(=NOMe))-4-piridinilo
3-metil-4-piridinilo	3-metoxi-4-piridinilo
3-(trifluorometil)-4-piridinilo	3-(CH(=NOMe))-4-piridinilo
3-metil-2-pirazinilo	3-metoxi-2-pirazinilo
3-(trifluorometil)-2-pirazinilo	3-(CH(=NOMe))-2-pirazinilo
5-metil-2-pirazinilo	5-metoxi-2-pirazinilo
5-(trifluorometil)-2-pirazinilo	5-(CH(=NOMe))-2-pirazinilo
6-metil-2-pirazinilo	6-metoxi-2-pirazinilo
6-(trifluorometil)-2-pirazinilo	6-(CH(=NOMe))-2-pirazinilo
4-metil-2-pirimidinilo	4-metoxi-2-pirimidinilo
4-(trifluorometil)-2-pirimidinilo	4-(CH(=NOMe))-2-pirimidinilo

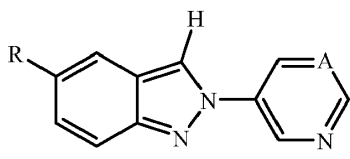
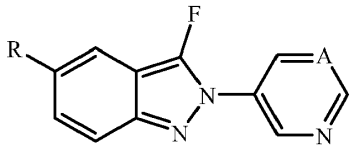
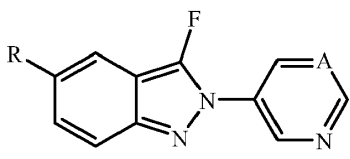
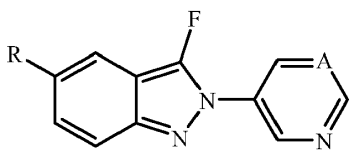
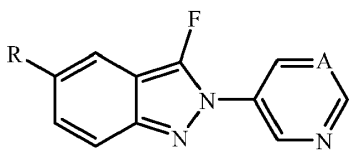
	
5-metil-2-pirimidinilo	5-metoxi-2-pirimidinilo
5-(trifluorometil)-2-pirimidinilo	5-(CH(=NOMe))-2-pirimidinilo
2-metil-4-pirimidinilo	2-metoxi-4-pirimidinilo
2-(trifluorometil)-4-pirimidinilo	2-(CH(=NOMe))-4-pirimidinilo
5-metil-4-pirimidinilo	5 -metoxi-4-pirimidinilo
5-(trifluorometil)-4-pirimidinilo	5-(CH(=NOMe))-4-pirimidinilo
6-metil-4-pirimidinilo	6-metoxi-4-pirimidinilo
6-(trifluorometil)-4-pirimidinilo	6-(CH(=NOMe))-4-pirimidinilo
3-metil-1-pirazolilo	3-metoxi-1-pirazolilo
3-(trifluorometil)-1-pirazolilo	3-(CH(=NOMe))-1-pirazolilo
4-metil-1-pirazolilo	4-metoxi-1-pirazolilo
4-(trifluorometil)-1-pirazolilo	4-(CH(=NOMe))-1-pirazolilo
5-metil-1-pirazolilo	5-metoxi-1-pirazolilo
5-(trifluorometil)-1-pirazolilo	5-(CH(=NOMe))-1-pirazolilo
4-metil-1,2,3-triazin-2-ilo	4-metoxi-1,2,3-triazin-2-ilo
4-(trifluorometil)-1,2,3 -triazin-2-ilo	4-(CH(=NOMe))-1,2,3-triazin-2-ilo
6-(2-pirimidinil)-2-piridinilo	2-(2-piridinil)-4-tiazolilo
2-(2-tiazolil)-4-tiazolilo	2-(2-pirimidinil)etnilo
1,3,4-oxadiazol-2-ilo	tetrahidro-3-furanilo
tetrahidro-2-furanilo	4,5-dihidro-3-isoxazolilo
3-isoxazolilo	6-(trifluorometil)-3-pirazinilo

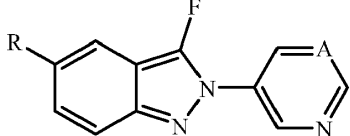
Tabla 2f

	
A es CH	
R	R
3-metil-2-piridinilo	3-metoxi-2-piridinilo
3-(trifluorometil)-2-piridinilo	3-(CH(=NOMe))-2-piridinilo
4-metil-2-piridinilo	4-metoxi-2-piridinilo
4-(trifluorometil)-2-piridinilo	4-(CH(=NOMe))-2-piridinilo
5-metil-2-piridinilo	5-metoxi-2-piridinilo

	
5-(trifluorometil)-2-piridinilo	5-(CH(=NOMe))-2-piridinilo
6-metil-2-piridinilo	6-metoxi-2-piridinilo
6-(trifluorometil)-2-piridinilo	6-(CH(=NOMe))-2-piridinilo
2-metil-3-piridinilo	2-metoxi-3-piridinilo
2-(trifluorometil)-3-piridinilo	2-(CH(=NOMe))-3-piridinilo
4-metil-3-piridinilo	4-metoxi-3-piridinilo
4-(trifluorometil)-3-piridinilo	4-(CH(=NOMe))-3-piridinilo
5-metil-3-piridinilo	5-metoxi-3-piridinilo
5-(trifluorometil)-3-piridinilo	5-(CH(=NOMe))-3-piridinilo
6-metil-3-piridinilo	6-metoxi-3-piridinilo
6-(trifluorometil)-3-piridinilo	6-(CH(=NOMe))-3-piridinilo
2-metil-4-piridinilo	2-metoxi-4-piridinilo
2-(trifluorometil)-4-piridinilo	2-(CH(=NOMe))-4-piridinilo
3-metil-4-piridinilo	3-metoxi-4-piridinilo
3-(trifluorometil)-4-piridinilo	3-(CH(=NOMe))-4-piridinilo
3-metil-2-pirazinilo	3-metoxi-2-pirazinilo
3-(trifluorometil)-2-pirazinilo	3-(CH(=NOMe))-2-pirazinilo
5-metil-2-pirazinilo	5-metoxi-2-pirazinilo
5-(trifluorometil)-2-pirazinilo	5-(CH(=NOMe))-2-pirazinilo
6-metil-2-pirazinilo	6-metoxi-2-pirazinilo
6-(trifluorometil)-2-pirazinilo	6-(CH(=NOMe))-2-pirazinilo
4-metil-2-pirimidinilo	4-metoxi-2-pirimidinilo
4-(trifluorometil)-2-pirimidinilo	4-(CH(=NOMe))-2-pirimidinilo
5-metil-2-pirimidinilo	5-metoxi-2-pirimidinilo
5-(trifluorometil)-2-pirimidinilo	5-(CH(=NOMe))-2-pirimidinilo
2-metil-4-pirimidinilo	2-metoxi-4-pirimidinilo
2-(trifluorometil)-4-pirimidinilo	2-(CH(=NOMe))-4-pirimidinilo
5-metil-4-pirimidinilo	5-metoxi-4-pirimidinilo
5-(trifluorometil)-4-pirimidinilo	5-(CH(=NOMe))-4-pirimidinilo
6-metil-4-pirimidinilo	6-metoxi-4-pirimidinilo
6-(trifluorometil)-4-pirimidinilo	6-(CH(=NOMe))-4-pirimidinilo
3-metil-1-pirazolilo	3-metoxi-1-pirazolilo
3-(trifluorometil)-1-pirazolilo	3-(CH(=NOMe))-1-pirazolilo

	
4-metil-1-pirazolilo	4-metoxi-1-pirazolilo
4-(trifluorometil)-1-pirazolilo	4-(CH(=NOMe))-1-pirazolilo
5-metil-1-pirazolilo	5-metoxi-1-pirazolilo
5-(trifluorometil)-1-pirazolilo	5-(CH(=NOMe))-1-pirazolilo
4-metil-1,2,3-triazin-2-ilo	4-metoxi-1,2,3-triazin-2-ilo
4-(trifluorometil)-1,2,3-triazin-2-ilo	4-(CH(=NOMe))-1,2,3-triazin-2-ilo
6-(2-pirimidinil)-2-piridinilo	2-(2-piridinil)-4-tiazolilo
2-(2-tiazolil)-4-tiazolilo	2-(2-pirimidinil)etnilo
1,3,4-oxadiazol-2-ilo	tetrahidro-3-furanilo
tetrahidro-2-furanilo	4,5-dihidro-3-isoxazolilo
3-isoxazolilo	6-(trifluorometil)-3-pirazinilo
A es CF	
R	R
3-metil-2-piridinilo	3-metoxi-2-piridinilo
3-(trifluorometil)-2-piridinilo	3-(CH(=NOMe))-2-piridinilo
4-metil-2-piridinilo	4-metoxi-2-piridinilo
4-(trifluorometil)-2-piridinilo	4-(CH(=NOMe))-2-piridinilo
5-metil-2-piridinilo	5-metoxi-2-piridinilo
5-(trifluorometil)-2-piridinilo	5-(CH(=NOMe))-2-piridinilo
6-metil-2-piridinilo	6-metoxi-2-piridinilo
6-(trifluorometil)-2-piridinilo	6-(CH(=NOMe))-2-piridinilo
2-metil-3-piridinilo	2-metoxi-3-piridinilo
2-(trifluorometil)-3-piridinilo	2-(CH(=NOMe))-3-piridinilo
4-metil-3-piridinilo	4-metoxi-3-piridinilo
4-(trifluorometil)-3-piridinilo	4-(CH(=NOMe))-3-piridinilo
5-metil-3-piridinilo	5-metoxi-3-piridinilo
5-(trifluorometil)-3-piridinilo	5-(CH(=NOMe))-3-piridinilo
6-metil-3-piridinilo	6-metoxi-3-piridinilo
6-(trifluorometil)-3-piridinilo	6-(CH(=NOMe))-3-piridinilo
2-metil-4-piridinilo	2-metoxi-4-piridinilo
2-(trifluorometil)-4-piridinilo	2-(CH(=NOMe))-4-piridinilo
3-metil-4-piridinilo	3-metoxi-4-piridinilo
3-(trifluorometil)-4-piridinilo	3-(CH(=NOMe))-4-piridinilo

	
3-metil-2-pirazinilo	3-metoksi-2-pirazinilo
3-(trifluorometil)-2-pirazinilo	3-(CH(=NOMe))-2-pirazinilo
5-metil-2-pirazinilo	5-metoksi-2-pirazinilo
5-(trifluorometil)-2-pirazinilo	5-(CH(=NOMe))-2-pirazinilo
6-metil-2-pirazinilo	6-metoksi-2-pirazinilo
6-(trifluorometil)-2-pirazinilo	6-(CH(=NOMe))-2-pirazinilo
4-metil-2-pirimidinilo	4-metoksi-2-pirimidinilo
4-(trifluorometil)-2-pirimidinilo	4-(CH(=NOMe))-2-pirimidinilo
5-metil-2-pirimidinilo	5-metoksi-2-pirimidinilo
5-(trifluorometil)-2-pirimidinilo	5-(CH(=NOMe))-2-pirimidinilo
2-metil-4-pirimidinilo	2-metoksi-4-pirimidinilo
2-(trifluorometil)-4-pirimidinilo	2-(CH(=NOMe))-4-pirimidinilo
5-metil-4-pirimidinilo	5-metoksi-4-pirimidinilo
5-(trifluorometil)-4-pirimidinilo	5-(CH(=NOMe))-4-pirimidinilo
6-metil-4-pirimidinilo	6-metoksi-4-pirimidinilo
6-(trifluorometil)-4-pirimidinilo	6-(CH(=NOMe))-4-pirimidinilo
3-metil-1-pirazolilo	3-metoksi-1-pirazolilo
3-(trifluorometil)-1-pirazolilo	3-(CH(=NOMe))-1-pirazolilo
4-metil-1-pirazolilo	4-metoksi-1-pirazolilo
4-(trifluorometil)-1-pirazolilo	4-(CH(=NOMe))-1-pirazolilo
5-metil-1-pirazolilo	5-metoksi-1-pirazolilo
5-(trifluorometil)-1-pirazolilo	5-(CH(=NOMe))-1-pirazolilo
4-metil-1,2,3-triazin-2-ilo	4-metoksi-1,2,3-triazin-2-ilo
4-(trifluorometil)-1,2,3-triazin-2-ilo	4-(CH(=NOMe))-1,2,3-triazin-2-ilo
6-(2-pirimidinil)-2-piridinilo	2-(2-piridinil)-4-tiazolilo
2-(2-tiazolil)-4-tiazolilo	2-(2-pirimidinil)etinilo
1,3,4-oxadiazol-2-ilo	tetrahidro-3-furanilo
tetrahidro-2-furanilo	4,5-dihidro-3-isoxazolilo
3-isoxazolilo	6-(trifluorometil)-3-pirazinilo
A es N	
R	R
3-metil-2-piridinilo	3-metoksi-2-piridinilo
3-(trifluorometil)-2-piridinilo	3-(CH(=NOMe))-2-piridinilo

	
4-metil-2-piridinilo	4-metoxi-2-piridinilo
4-(trifluorometil)-2-piridinilo	4-(CH(=NOMe))-2-piridinilo
5-metil-2-piridinilo	5-metoxi-2-piridinilo
5-(trifluorometil)-2-piridinilo	5-(CH(=NOMe))-2-piridinilo
6-metil-2-piridinilo	6-metoxi-2-piridinilo
6-(trifluorometil)-2-piridinilo	6-(CH(=NOMe))-2-piridinilo
2-metil-3-piridinilo	2-metoxi-3-piridinilo
2-(trifluorometil)-3-piridinilo	2-(CH(=NOMe))-3-piridinilo
4-metil-3-piridinilo	4-metoxi-3-piridinilo
4-(trifluorometil)-3-piridinilo	4-(CH(=NOMe))-3-piridinilo
5-metil-3-piridinilo	5-metoxi-3-piridinilo
5-(trifluorometil)-3-piridinilo	5-(CH(=NOMe))-3-piridinilo
6-metil-3-piridinilo	6-metoxi-3-piridinilo
6-(trifluorometil)-3-piridinilo	6-(CH(=NOMe))-3-piridinilo
2-metil-4-piridinilo	2-metoxi-4-piridinilo
2-(trifluorometil)-4-piridinilo	2-(CH(=NOMe))-4-piridinilo
3-metil-4-piridinilo	3-metoxi-4-piridinilo
3-(trifluorometil)-4-piridinilo	3-(CH(=NOMe))-4-piridinilo
3-metil-2-pirazinilo	3-metoxi-2-pirazinilo
3-(trifluorometil)-2-pirazinilo	3-(CH(=NOMe))-2-pirazinilo
5-metil-2-pirazinilo	5-metoxi-2-pirazinilo
5-(trifluorometil)-2-pirazinilo	5-(CH(=NOMe))-2-pirazinilo
6-metil-2-pirazinilo	6-metoxi-2-pirazinilo
6-(trifluorometil)-2-pirazinilo	6-(CH(=NOMe))-2-pirazinilo
4-metil-2-pirimidinilo	4-metoxi-2-pirimidinilo
4-(trifluorometil)-2-pirimidinilo	4-(CH(=NOMe))-2-pirimidinilo
5-metil-2-pirimidinilo	5-metoxi-2-pirimidinilo
5-(trifluorometil)-2-pirimidinilo	5-(CH(=NOMe))-2-pirimidinilo
2-metil-4-pirimidinilo	2-metoxi-4-pirimidinilo
2-(trifluorometil)-4-pirimidinilo	2-(CH(=NOMe))-4-pirimidinilo
5-metil-4-pirimidinilo	5-metoxi-4-pirimidinilo
5-(trifluorometil)-4-pirimidinilo	5-(CH(=NOMe))-4-pirimidinilo
6-metil-4-pirimidinilo	6-metoxi-4-pirimidinilo

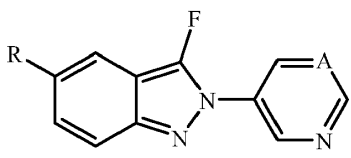
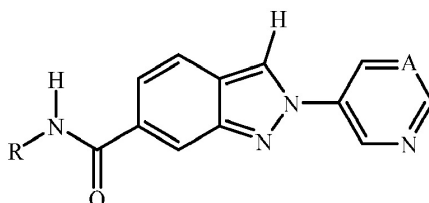
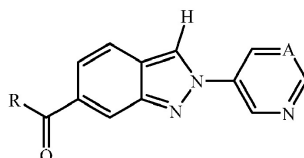
	
6-(trifluorometil)-4-pirimidinilo	6-(CH(=NOMe))-4-pirimidinilo
3-metil-1-pirazolilo	3-metoxi-1-pirazolilo
3-(trifluorometil)-1-pirazolilo	3-(CH(=NOMe))-1-pirazolilo
4-metil-1-pirazolilo	4-metoxi-1-pirazolilo
4-(trifluorometil)-1-pirazolilo	4-(CH(=NOMe))-1-pirazolilo
5-metil-1-pirazolilo	5-metoxi-1-pirazolilo
5-(trifluorometil)-1-pirazolilo	5-(CH(=NOMe))-1-pirazolilo
4-metil-1,2,3-triazin-2-ilo	4-metoxi-1,2,3-triazin-2-ilo
4-(trifluorometil)-1,2,3-triazin-2-ilo	4-(CH(=NOMe))-1,2,3-triazin-2-ilo
6-(2-pirimidinil)-2-piridinilo	2-(2-piridinil)-4-tiazolilo
2-(2-tiazolil)-4-tiazolilo	2-(2-pirimidinil)etinilo
1,3,4-oxadiazol-2-ilo	tetrahidro-3-furanilo
tetrahidro-2-furanilo	4,5-dihidro-3-isoxazolilo
3-isoxazolilo	6-(trifluorometil)-3-pirazinilo

Tabla 3a



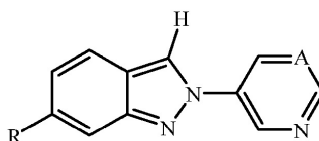
La Tabla 3a es idéntica a la Tabla 1a, excepto que la estructura mostrada bajo el encabezado "Tabla 1a" se sustituye por la estructura mostrada encima.

TABLA 3c



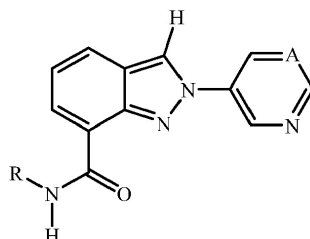
- 5 La Tabla 3c es idéntica a la Tabla 1c, excepto que la estructura mostrada bajo el encabezado "Tabla 1c" se sustituye por la estructura mostrada encima.

TABLA 3e



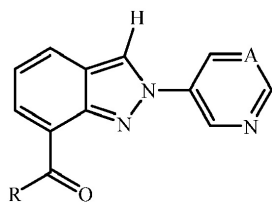
La Tabla 3e es idéntica a la Tabla 1e, excepto que la estructura mostrada bajo el encabezado "Tabla 1e" se sustituye por la estructura mostrada encima.

TABLA 4a



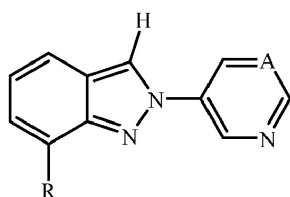
La Tabla 4a es idéntica a la Tabla 1a, excepto que la estructura mostrada bajo el encabezado "Tabla 1a" se sustituye por la estructura mostrada encima.

TABLA 4c



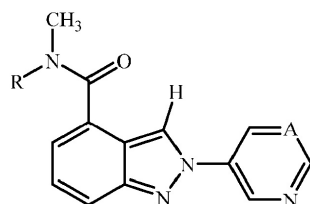
- 5 La Tabla 4c es idéntica a la Tabla 1c, excepto que la estructura mostrada bajo el encabezado "Tabla 1c" se sustituye por la estructura mostrada encima.

TABLA 4e



La Tabla 4e es idéntica a la Tabla 1e, excepto que la estructura mostrada bajo el encabezado "Tabla 1e" se sustituye por la estructura mostrada encima.

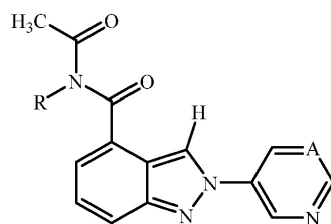
TABLA 5a



10

La Tabla 5a es idéntica a la Tabla 1a, excepto que la estructura mostrada bajo el encabezado "Tabla 1a" se sustituye por la estructura mostrada encima.

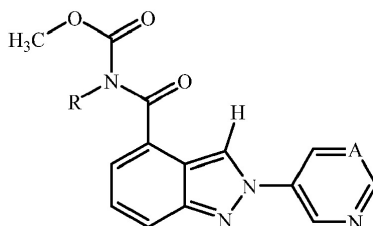
TABLA 5b



15

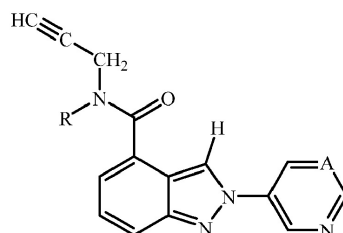
La Tabla 5b es idéntica a la Tabla 1a, excepto que la estructura mostrada bajo el encabezado "Tabla 1a" se sustituye por la estructura mostrada encima.

TABLA 5c



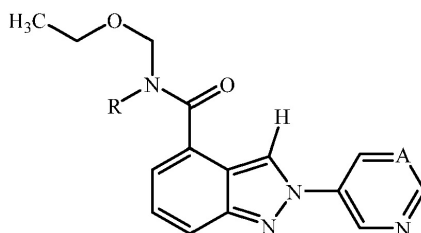
La Tabla 5c es idéntica a la Tabla 1a, excepto que la estructura mostrada bajo el encabezado "Tabla 1a" se sustituye por la estructura mostrada encima.

TABLA 5d



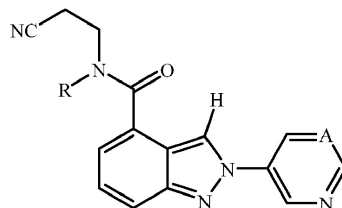
5 La Tabla 5d es idéntica a la Tabla 1a, excepto que la estructura mostrada bajo el encabezado "Tabla 1a" se sustituye por la estructura mostrada encima.

TABLA 5e



La Tabla 5e es idéntica a la Tabla 1a, excepto que la estructura mostrada bajo el encabezado "Tabla 1a" se sustituye por la estructura mostrada encima.

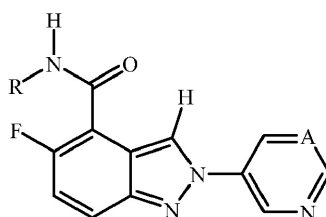
TABLA 5f



10

La Tabla 5f es idéntica a la Tabla 1a, excepto que la estructura mostrada bajo el encabezado "Tabla 1a" se sustituye por la estructura mostrada encima.

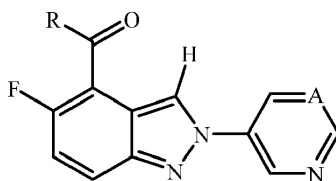
TABLA 6a



15

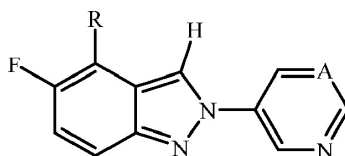
La Tabla 6a es idéntica a la Tabla 1a, excepto que la estructura mostrada bajo el encabezado "Tabla 1a" se sustituye por la estructura mostrada encima.

TABLA 6c



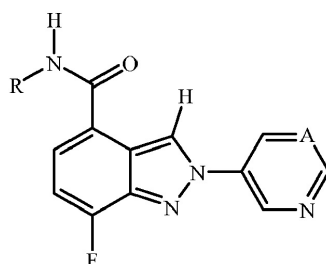
La Tabla 6c es idéntica a la Tabla 1c, excepto que la estructura mostrada bajo el encabezado "Tabla 1c" se sustituye por la estructura mostrada encima.

TABLA 6e



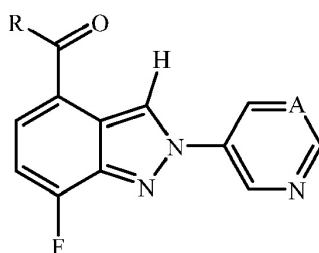
5 La Tabla 6e es idéntica a la Tabla 1e, excepto que la estructura mostrada bajo el encabezado "Tabla 1e" se sustituye por la estructura mostrada encima.

TABLA 7a



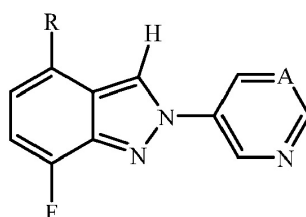
La Tabla 7a es idéntica a la Tabla 1a, excepto que la estructura mostrada bajo el encabezado "Tabla 1a" se sustituye por la estructura mostrada encima.

TABLA 7c



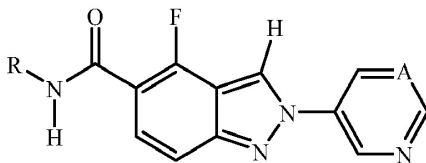
10 La Tabla 7c es idéntica a la Tabla 1c, excepto que la estructura mostrada bajo el encabezado "Tabla 1c" se sustituye por la estructura mostrada encima.

TABLA 7e



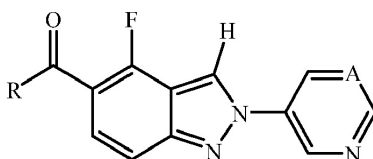
15 La Tabla 7e es idéntica a la Tabla 1e, excepto que la estructura mostrada bajo el encabezado "Tabla 1e" se sustituye por la estructura mostrada encima.

TABLA 8a



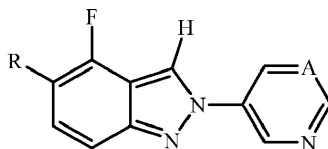
La Tabla 8a es idéntica a la Tabla 1a, excepto que la estructura mostrada bajo el encabezado "Tabla 1a" se sustituye por la estructura mostrada encima.

TABLA 8c



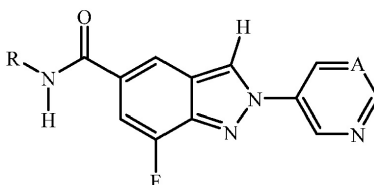
5 La Tabla 8c es idéntica a la Tabla 1c, excepto que la estructura mostrada bajo el encabezado "Tabla 1c" se sustituye por la estructura mostrada encima.

TABLA 8e



La Tabla 8e es idéntica a la Tabla 1e, excepto que la estructura mostrada bajo el encabezado "Tabla 1e" se sustituye por la estructura mostrada encima.

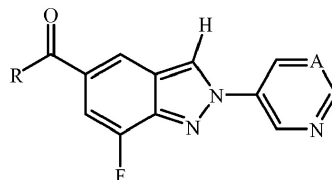
TABLA 9a



10

La Tabla 9a es idéntica a la Tabla 1a, excepto que la estructura mostrada bajo el encabezado "Tabla 1a" se sustituye por la estructura mostrada encima.

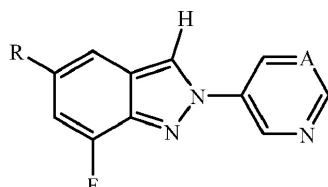
TABLA 9c



15

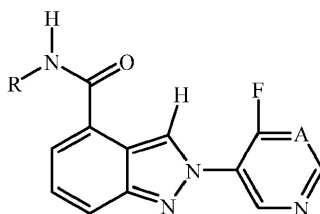
La Tabla 9c es idéntica a la Tabla 1c, excepto que la estructura mostrada bajo el encabezado "Tabla 1c" se sustituye por la estructura mostrada encima.

TABLA 9e



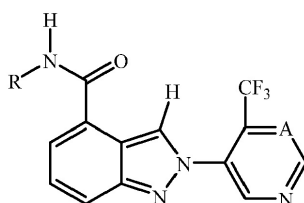
La Tabla 9e es idéntica a la Tabla 1e, excepto que la estructura mostrada bajo el encabezado "Tabla 1e" se sustituye por la estructura mostrada encima.

TABLA 10a



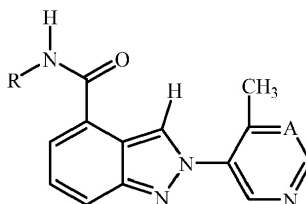
5 La Tabla 10a es idéntica a la Tabla 1a, excepto que la estructura mostrada bajo el encabezado "Tabla 1a" se sustituye por la estructura mostrada encima.

TABLA 10b



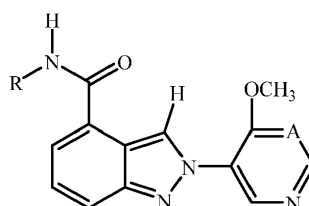
La Tabla 10b es idéntica a la Tabla 1a, excepto que la estructura mostrada bajo el encabezado "Tabla 1a" se sustituye por la estructura mostrada encima.

TABLA 10c



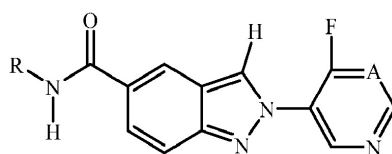
10 La Tabla 10c es idéntica a la Tabla 1a, excepto que la estructura mostrada bajo el encabezado "Tabla 1a" se sustituye por la estructura mostrada encima.

TABLA 10d



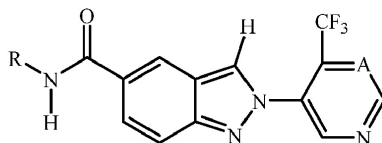
La Tabla 10d es idéntica a la Tabla 1a, excepto que la estructura mostrada bajo el encabezado "Tabla 1a" se sustituye por la estructura mostrada encima.

TABLA 11a



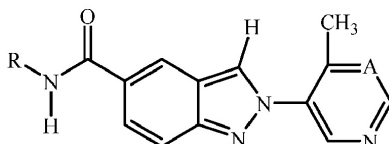
15 La Tabla 11a es idéntica a la Tabla 1a, excepto que la estructura mostrada bajo el encabezado "Tabla 1a" se sustituye por la estructura mostrada encima.

TABLA 11b



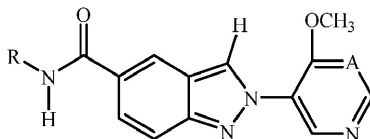
La Tabla 11b es idéntica a la Tabla 1a, excepto que la estructura mostrada bajo el encabezado "Tabla 1a" se sustituye por la estructura mostrada encima.

TABLA 11c



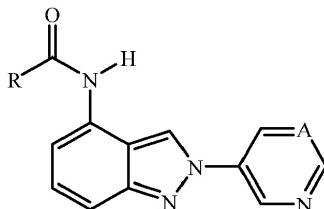
5 La Tabla 11c es idéntica a la Tabla 1a, excepto que la estructura mostrada bajo el encabezado "Tabla 1a" se sustituye por la estructura mostrada encima.

TABLA 11d



La Tabla 11d es idéntica a la Tabla 1a, excepto que la estructura mostrada bajo el encabezado "Tabla 1a" se sustituye por la estructura mostrada encima.

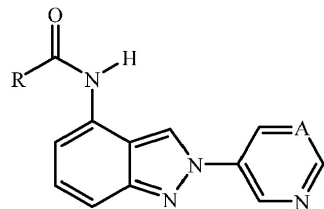
TABLA 20a



10

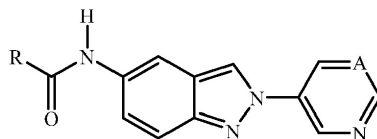
La Tabla 20a es idéntica a la Tabla 1a, excepto que la estructura mostrada bajo el encabezado "Tabla 1a" se sustituye por la estructura mostrada encima.

TABLA 20b



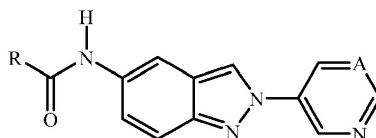
15 La Tabla 20b es idéntica a la Tabla 1e, excepto que la estructura mostrada bajo el encabezado "Tabla 1e" se sustituye por la estructura mostrada encima.

TABLA 21a



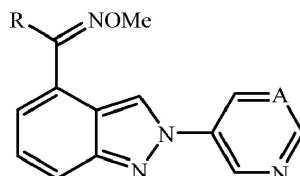
La Tabla 21a es idéntica a la Tabla 1a, excepto que la estructura mostrada bajo el encabezado "Tabla 1a" se sustituye por la estructura mostrada encima.

TABLA 21b



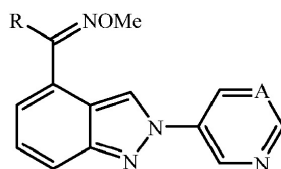
La Tabla 21b es idéntica a la Tabla 1e, excepto que la estructura mostrada bajo el encabezado "Tabla 1e" se sustituye por la estructura mostrada encima.

TABLA 22a



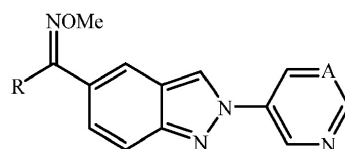
5 La Tabla 22a es idéntica a la Tabla 1a, excepto que la estructura mostrada bajo el encabezado "Tabla 1a" se sustituye por la estructura mostrada encima.

TABLA 22b



La Tabla 22b es idéntica a la Tabla 1e, excepto que la estructura mostrada bajo el encabezado "Tabla 1e" se sustituye por la estructura mostrada encima.

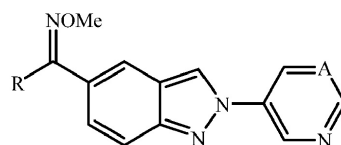
TABLA 23a



10

La Tabla 23a es idéntica a la Tabla 1a, excepto que la estructura mostrada bajo el encabezado "Tabla 1a" se sustituye por la estructura mostrada encima.

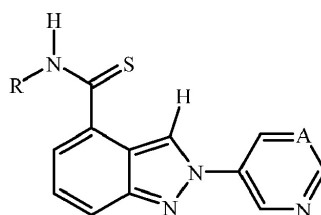
TABLA 23b



15

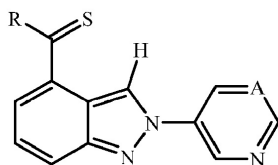
La Tabla 23b es idéntica a la Tabla 1e, excepto que la estructura mostrada bajo el encabezado "Tabla 1e" se sustituye por la estructura mostrada encima.

TABLA 24a



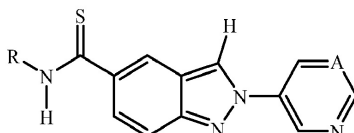
La Tabla 24a es idéntica a la Tabla 1a, excepto que la estructura mostrada bajo el encabezado "Tabla 1a" se sustituye por la estructura mostrada encima.

TABLA 24b



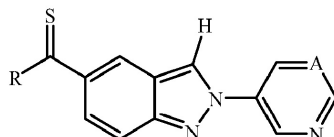
La Tabla 24b es idéntica a la Tabla 1c, excepto que la estructura mostrada bajo el encabezado "Tabla 1c" se sustituye por la estructura mostrada encima.

TABLA 25a



5 La Tabla 25a es idéntica a la Tabla 1a, excepto que la estructura mostrada bajo el encabezado "Tabla 1a" se sustituye por la estructura mostrada encima.

TABLA 25b



La Tabla 25b es idéntica a la Tabla 1c, excepto que la estructura mostrada bajo el encabezado "Tabla 1c" se sustituye por la estructura mostrada encima.

10 Un compuesto de esta invención se usará generalmente como un ingrediente activo del control de plagas de invertebrados en una composición, es decir, formulación, con al menos un componente adicional seleccionado del grupo que consiste en tensioactivos, diluyentes sólidos y diluyentes líquidos, que sirve como un vehículo. Los ingredientes de la formulación o composición se seleccionan para ser coherentes con las propiedades físicas del ingrediente activo, modo de aplicación y factores ambientales tales como tipo de suelo, humedad y temperatura.

15 Las formulaciones útiles incluyen composiciones tanto líquidas como sólidas. Las composiciones líquidas incluyen disoluciones (que incluyen concentrados emulsificables), suspensiones, emulsiones (que incluyen microemulsiones, emulsiones de aceite en agua, concentrados fluidos y/o suspoemulsiones) y similares, que opcionalmente pueden espesarse a geles. Los tipos generales de composiciones líquidas acuosas son concentrado soluble, concentrado en suspensión, suspensión de cápsulas, emulsión concentrada, microemulsión, emulsión de aceite en agua, 20 concentrado fluido y suspoemulsión. Los tipos generales de composiciones líquidas no acuosas son concentrado emulsificable, concentrado microemulsificable, concentrado dispersable y dispersión en aceite.

Los tipos generales de composiciones sólidas son polvos finos, polvos, gránulos, granulados, perlados, pastillas, comprimidos, películas recubiertas (que incluyen recubrimientos de semillas) y similares, que pueden ser 25 dispersables en agua ("humectables") o solubles en agua. Las películas y recubrimientos formados a partir de disoluciones formadoras de película o suspensiones fluidas son particularmente útiles para el tratamiento de semillas. El ingrediente activo puede estar (micro)encapsulado y formado adicionalmente en una suspensión o formulación sólida; alternativamente la formulación entera del ingrediente activo puede estar encapsulado (o "sobrecubierto"). La encapsulación puede controlar o retrasar la liberación del ingrediente activo. un gránulo emulsificable combina las ventajas tanto de una formulación de concentrado emulsificable como una formulación granular seca. 30 Las composiciones de alta resistencia se usan principalmente como intermedios para la formulación adicional.

Las formulaciones pulverizables se extienden típicamente en un medio adecuado antes del pulverizado. Dichas formulaciones líquidas y sólidas se formulan para diluirse fácilmente en el medio de pulverización, normalmente agua, aunque ocasionalmente otro medio adecuado como un hidrocarburo aromático o parafínico o aceite vegetal. Los volúmenes de pulverización pueden oscilar de aproximadamente uno a varios miles de litros por hectárea, pero 35 más típicamente están en el intervalo de aproximadamente diez a varios cientos de litros por hectárea. Las formulaciones pulverizables pueden mezclarse en tanques con agua u otro medio adecuado para el tratamiento foliar mediante aplicación aérea o del suelo, o para aplicación al medio en crecimiento de la planta. Las formulaciones líquidas y sólidas pueden medirse directamente en sistemas de irrigación por goteo o medirse en el surco durante la plantación. Las formulaciones líquidas y sólidas pueden aplicarse en semillas de cultivos y otra 40 vegetación deseable como tratamientos de semillas antes de plantarse para proteger las raíces en desarrollo y otras partes subterráneas de la planta y/o el follaje a través de absorción sistémica.

ES 2 707 398 T3

Las formulaciones contendrán típicamente cantidades efectivas de ingrediente activo, diluyente y tensioactivo en los siguientes intervalos aproximados que añaden hasta el 100 por cien en peso.

	Porcentaje en peso		
	<u>Ingrediente activo</u>	<u>Diluyente</u>	<u>Tensioactivo</u>
Gránulos, comprimidos y polvos dispersables en agua y solubles en agua	0,001-90	0-99,999	0-15
Dispersiones en aceite, suspensiones, emulsiones, disoluciones (que incluyen concentrados emulsificables)	1-50	40-99	0-50
Polvos finos	1-25	70-99	0-5
Gránulos y granulados	0,001-99	5-99,999	0-15
Composiciones de alta resistencia	90-99	0-10	0-2

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

10 Los diluyentes líquidos incluyen, por ejemplo, agua, N,N-dimetilalcanamidas (p.ej., N,N-dimetilformamida), limoneno, dimetilsulfóxido, N-alquilpirrolidonas (p.ej., N-metilpirrolidinona), fosfatos de alquilo (p.ej., trietilfosfato), etilenglicol, trietilenglicol, propilenglicol, dipropilenglicol, polipropilenglicol, carbonato de propileno, carbonato de butileno, parafinas (p.ej., aceites minerales blancos, parafinas normales, isoparafinas), alquilbencenos, alquilnaftalenos, glicerina, triacetato de glicerol, sorbitol, hidrocarburos aromáticos, compuestos alifáticos desaromatizados, alquilbencenos, alquilnaftalenos, cetonas tales como ciclohexanona, 2-heptanona, isoforona y 4-hidroxi-4-metil-2-pentanona, acetatos tales como acetato de isoamilo, acetato de hexilo, acetato de heptilo, acetato de octilo, acetato de nonilo acetato de tridecilo y acetato de isobornilo, otros ésteres tales como ésteres de lactato alquilado, ésteres dibásicos y benzoatos de alquilo y arilo, γ -butirolactona, y alcoholes, que pueden ser lineales, ramificados, saturados o insaturados, tales como metanol, etanol, n-propanol, alcohol isopropílico, n-butanol, alcohol isobutílico, n-hexanol, 2-etilhexanol, n-octanol, decanol, alcohol isodecílico, isooctadecanol, alcohol cetílico, alcohol de laurilo, alcohol de tridecilo, alcohol de oleilo, ciclohexanol, alcohol de tetrahidrofurfurilo, alcohol de diacetona, cresol y alcohol bencílico.

15 Los diluyentes líquidos también incluyen ésteres de glicerol de ácidos grasos saturados e insaturados (típicamente C₆-C₂₂), tales como aceites de semillas de plantas y frutas (p.ej., aceites de oliva, ricino, linaza, sésamo, maíz, cacahuete, girasol, semillas de uva, cártamo, semilla de algodón, soja, colza, coco y palma kernel), grasas de fuentes animales (p.ej., sebo de ternera, sebo de cerdo, manteca de cerdo, aceite de hígado de bacalao, aceite de pescado), y mezclas de los mismos. Los diluyentes líquidos también incluyen ácidos grasos alquilados (p.ej., metilados, etilados, butilados) en los que los ácidos grasos pueden obtenerse por hidrólisis de ésteres de glicerol de fuentes vegetales y animales, y pueden purificarse por destilación. Los diluyentes líquidos típicos se describen en Marsden, Solvents Guide, 2ª Ed., Interscience, Nueva York, 1950.

30 Las composiciones sólidas y líquidas de la presente invención a menudo incluyen uno o más tensioactivos. Cuando se añaden a un líquido, los tensioactivos (también conocidos como "agentes de superficie activa") generalmente modifican, la mayoría de las veces reducen, la tensión superficial del líquido. Dependiendo de la naturaleza de los grupos hidrófilos y lipófilos en una molécula tensioactiva, los tensioactivos pueden ser útiles como agentes humectantes, dispersantes, emulgentes o agentes desespumantes.

35 Los tensioactivos pueden clasificarse como no iónicos, aniónicos o catiónicos. Los tensioactivos no iónicos útiles para las presentes composiciones incluyen, aunque no están limitados a: alcoxilatos de alcohol tales como alcoxilatos de alcohol basados en alcoholes naturales y sintéticos (que pueden ser ramificados o lineales) y preparados a partir de los alcoholes y óxido de etileno, óxido de propileno, óxido de butileno o mezclas de los mismos; etoxilatos de amina, alcanolamidas y alcanolamidas etoxiladas; triglicéridos alcoxilados tales como aceites de soja, ricino y colza etoxilados; alcoxilatos de alquilfenol tales como etoxilatos de octilfenol, etoxilatos de nonilfenol, etoxilatos de dinonilfenol y etoxilatos de dodecilfenol (preparados a partir de los fenoles y óxido de etileno, óxido de propileno, óxido de butileno o mezclas de los mismos); polímeros en bloque preparados a partir de óxido de etileno u óxido de propileno y polímeros en bloque inversos donde los bloques terminales se preparan a partir de óxido de propileno; ácidos grasos etoxilados; ésteres grasos y aceites etoxilados, ésteres de metilo etoxilados; tristirilfenol etoxilado (que incluyen los preparados a partir de óxido de etileno, óxido de propileno, óxido de butileno o mezclas de los mismos); ésteres de ácidos grasos, ésteres de glicerol, derivados basados en lanolina, ésteres de polietoxilato tales como ésteres de ácidos grasos de sorbitano polietoxilados, ésteres de ácidos grasos de sorbitol polietoxilados y ésteres de ácidos grasos de glicerol polietoxilados; otros derivados de sorbitano tales como ésteres

de sorbitano; tensioactivos poliméricos tales como copolímeros aleatorios, copolímeros en bloque, resinas peg (polietilenglicol) alquídicas, polímeros de injerto o en peine y polímeros en estrella, polietilenglicoles (pegs); ésteres de ácidos grasos de polietilenglicol; tensioactivos basados en silicona; y derivados de azúcar tales como ésteres de sacarosa, poliglicósidos de alquilo y polisacáridos de alquilo.

- 5 Los tensioactivos aniónicos útiles incluyen, aunque no están limitados a: ácidos alquilarilsulfónicos y sus sales; etoxilatos de alcohol o alquilfenol carboxilados; derivados de difenilsulfonato; lignina y derivados de lignina tales como lignosulfonatos, ácidos maleico o succínico o sus anhídridos; sulfonatos de olefina, ésteres de fosfato tales como ésteres de fosfato de alcoxilatos de alcohol, ésteres de fosfato de alcoxilatos de alquilfenol y ésteres de fosfato de etoxilatos de estirilfenol; tensioactivos con base de proteína; derivados de sarcosina; sulfato de estirilfenoléter;
- 10 sulfatos y sulfonatos de aceites y ácidos grasos; sulfatos y sulfonatos de alquilfenoles etoxilados; sulfatos de alcoholes, sulfatos de alcoholes etoxilados; sulfonatos de aminas y amidas tales como *N,N*-alquiltauratos; sulfonatos de benceno, cumeno, tolueno, xileno y dodecil y tridecibencenos; sulfonatos de naftalenos condensados; sulfonatos de naftaleno y alquilnaftaleno; sulfonatos de petróleo fraccionado; sulfosuccinamatos; y sulfosuccinatos y sus derivados tales como sales de dialquilsulfosuccinato.
- 15 Los tensioactivos catiónicos útiles incluyen, aunque no están limitados a: amidas y amidas etoxiladas; aminas tales como *N*-alquilpropanodiaminas, tripropilenotriaminas y dipropilenotetraminas, y aminas etoxiladas, diaminas etoxiladas y aminas propoxiladas (preparadas a partir de aminas y óxido de etileno, óxido de propileno, óxido de butileno o mezclas de los mismos); sales de amina tales como acetatos de amina y sales de diamina; sales de amonio cuaternario tales como sales cuaternarias, sales cuaternarias etoxiladas y sales dicuaternarias; y óxidos de amina tales como óxidos de alquildimetilamina y óxidos de bis-(2-hidroxietyl)-alquilamina.
- 20

También útiles para las presentes composiciones son mezclas de tensioactivos no iónicos y aniónicos o mezclas de tensioactivos no iónicos y catiónicos. Los tensioactivos no iónicos, aniónicos y catiónicos y sus usos recomendados se describen en una variedad de referencias publicadas que incluyen McCutcheon's Emulsifiers and Detergents, Ediciones anuales americana e internacional publicada por McCutcheon's Division, the Manufacturing Confectioner Publishing Co.; Sisely y Wood, Encyclopedia of Surface Active Agents, Chemical Publ. Co., Inc., Nueva York, 1964;

25 y A.S. Davidson y B. Milwidsky, Synthetic Detergents, Séptima edición, John Wiley and Sons, Nueva York, 1987.

Las composiciones de esta invención pueden contener también auxiliares de formulación y aditivos, conocidos por los expertos en la técnica como auxiliares de formulación (algunos de los cuales pueden considerarse que funcionan también como diluyentes sólidos, diluyentes líquidos o tensioactivos). Dichos auxiliares de formulación y aditivos pueden controlar: pH (tampones), espumado durante el procesado (antiespumantes como poliorganosiloxanos), sedimentación de los ingredientes activos (agentes de suspensión), viscosidad (espesantes tixotrópicos), crecimiento microbiano en el recipiente (antimicrobianos), congelación del producto (anticongelantes), color (tintes/dispersiones de pigmento), lavado (formadores de película o etiquetas), evaporación (retardantes de evaporación) y otros atributos de formulación. Los formadores de película incluyen, por ejemplo, poli(acetatos de vinilo), copolímeros de poli(acetato de vinilo), copolímero de polivinilpirrolidona-acetato de vinilo, poli(alcoholes de vinilo), copolímeros de poli(alcohol de vinilo) y ceras. Ejemplos de auxiliares de formulación y aditivos incluyen los enumerados en McCutcheon's Volumen 2. Functional Materials, ediciones anuales internacional y norteamericana publicadas por McCutcheon's Division, The Manufacturing Confectioner Publishing Co.; y la publicación PCT WO 03/024222.

30

35

40 El compuesto de Fórmula 1 y cualquier otro ingrediente activo se incorporan típicamente en las presentes composiciones disolviendo el ingrediente activo en un disolvente o moliendo en un diluyente líquido o seco. Las disoluciones, que incluyen concentrados emulsificables, pueden prepararse mezclando sencillamente los ingredientes. Si el disolvente de una composición líquida prevista para usar como un concentrado emulsificable es inmiscible en agua, un emulgente típicamente se añade para emulsionar el disolvente que contiene el compuesto activo tras la dilución con agua. Las lechadas de ingrediente activo, con diámetros de partícula de hasta 2.000 µm pueden molerse en húmedo usando molinos con medios de granulado para obtener partículas con diámetros promedio por debajo de 3 µm. Las lechadas acuosas pueden hacerse en concentrados de suspensión acabados (véase, por ejemplo, el documento U.S. 3.060.084) o procesarse más secando por pulverización para formar gránulos dispersables en agua. Las formulaciones secas normalmente necesitan procesos de molienda en seco, que producen diámetros de partícula promedio en el intervalo de 2 a 10 µm. Los polvos finos y polvos pueden prepararse mezclando y normalmente moliendo (tal como con un molino de martillo o molino de energía de fluido). Los gránulos y granulados pueden prepararse pulverizando el material activo sobre vehículos granulares preformados o mediante técnicas de aglomeración. Véase Browning, "Agglomeration", Chemical Engineering, 4 de diciembre de 1967, págs. 147-48, Perry's Chemical Engineer's Handbook, 4ª Ed., McGraw Hill, Nueva York, 1963, páginas 8-57 y siguientes,

45 y el documento WO 91/13546. Los granulados pueden prepararse como se describe en el documento U.S. 4.172.714. Los gránulos dispersables en agua y solubles en agua pueden prepararse como se enseña en los documentos U.S. 4.144.050, U.S. 3.920.442 y DE 3.246.493. Los comprimidos pueden prepararse como se enseña en los documentos U.S. 5.180.587, U.S. 5.232.701 y U.S. 5.208.030. Las películas pueden prepararse como se enseña en los documentos GB 2.095.558 y U.S. 3.299.566.

50

55

60 Para más información respecto a la técnica de formulación, véase T.S. Woods, "The Formulator's Toolbox – Product Forms for Modern Agriculture" en Pesticide Chemistry and Bioscience, The Food-Environment Challenge, T. Brooks

5 y T.R. Roberts, Eds., Proceedings of the 9th International Congress on Pesticide Chemistry, Real sociedad de química, Cambridge, 1999, págs. 120-133. Véase también el documento U.S. 3.235.361, Col. 6, línea 16 a Col. 7, línea 19 y los Ejemplos 10-41; documento U.S. 3.309.192, Col. 5, línea 43 a Col. 7, línea 62 y Ejemplos 8, 12, 15, 39, 41, 52, 53, 58, 132, 138-140, 162-164, 166, 167 y 169-182; documento U.S. 2.891.855, Col. 3, línea 66 a Col. 5, línea 17 y Ejemplos 1-4; Klingman, Weed Control as a Science, John Wiley and Sons, Inc., Nueva York, 1961, págs. 81-96; Hance et al., Weed Control Handbook, 8ª Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1989; y Developments in formulation technology, PJB Publications, Richmond, RU, 2000.

10 En los siguientes ejemplos, todas las formulaciones se preparan en formas convencionales. Los números de compuesto se refieren a compuestos en las Tablas de índice A-N. Sin más elaboración, se cree que un experto en la técnica que usa la descripción anterior puede utilizar la presente invención en toda su extensión. Los siguientes ejemplos, por lo tanto, se van a construir como meramente ilustrativos, y no limitantes de la descripción en ninguna forma en absoluto. Los porcentajes son en peso excepto donde se indique otra cosa.

Ejemplo A

Concentrado de alta resistencia

Compuesto 8	98,5%
Aerogel de sílice	0,5%
Sílice fino amorfo sintético	1,0%

15 Ejemplo B

Polvo humectable

Compuesto 14	65,0%
Dodecifenol-polietilenglicoléter	2,0%
Ligninsulfonato sódico	4,0%
Silicoaluminato sódico	6,0%
Montmorillonita (calcinada)	23,0%

Ejemplo C

Gránulo

Compuesto 16	10,0%
Gránulos de atapulgita (material de baja volatilidad, 0,71/0,30 mm; tamices U.S.S. Núm. 25-50)	90,0%

Ejemplo D

20 Granulado extrudido

Compuesto 19	25,0%
Sulfato sódico anhidro	10,0%
Ligninsulfonato de calcio en bruto	5,0%
Alquilnaftalenosulfonato sódico	1,0%
Bentonita de calcio/magnesio	59,0%

Ejemplo E

Concentrado emulsificable

Compuesto 41	10,0%
Hexoleato de polioxietilensorbitol	20,0%
Metiléster de ácido graso C ₆ -C ₁₀	70,0%

Ejemplo F

Microemulsión

Compuesto 42	5,0%
Copolímero de polivinilpirrolidona-acetato de vinilo	30,0%
alquilpoliglicósido	30,0%
Monooleato de glicerilo	15,0%
Agua	20,0%

Ejemplo G

Tratamiento de semillas

Compuesto 51 (no reivindicado)	20,00%
Copolímero de polivinilpirrolidona-acetato de vinilo	5,00%
Cera ácida montan	5,00%
Ligninsulfonato de calcio	1,00%
Copolímeros en bloques de polioxietileno/polioxipropileno	1,00%
Alcohol estearílico (POE 20)	2,00%
Poliorganosilano	0,20%
Tinte rojo colorante	0,05%
Agua	65,75%

5 Ejemplo H

Barra fertilizante

Compuesto 54	2,5%
Copolímero de pirrolidona-estireno	4,8%
16-etoxilato de tristirilfenilo	2,3%
Talco	0,8%
Almidón de maíz	5,0%
Fertilizante de liberación lenta	36,0%
Caolín	38,0%
Agua	10,6%

Ejemplo I

Concentrado en suspensión

Compuesto 55	35%
Copolímero en bloque de butil polioxietileno/polipropileno	4,0%
Copolímero de ácido estearico/polietilenglicol	1,0%
Polímero acrílico de estireno	1,0%
Goma de xantano	0,1%
Propilenglicol	5,0%

ES 2 707 398 T3

Compuesto 55	35%
Desespumante basado en silicona	0,1%
1,2-benzisotiazolin-3-ona	0,1%
Agua	53,7%

Ejemplo J

Emulsión en agua

Compuesto 76	10,0%
Copolímero en bloque de butil polioxietileno/polipropileno	4,0%
Copolímero de ácido estearico/polietilenglicol	1,0%
Polímero acrílico de estireno	1,0%
Goma de xantano	0,1%
Propilenglicol	5,0%
Desespumante con base de silicona	0,1%
1,2-benzisotiazolin-3-ona	0,1%
Hidrocarburo con base de petróleo aromático	20,0
Agua	58,7%

Ejemplo K

Dispersión en aceite

Compuesto 19	25%
Hexaoleato de polioxietilensorbitol	15%
Arcilla bentonita orgánicamente modificada	2,5%
Metiléster de ácido graso	57,5%

5 Ejemplo L

Suspoemulsión

Compuesto 42	10,0%
imidacloprid	5,0%
Copolímero en bloque de butil polioxietileno/polipropileno	4,0%
Copolímero de ácido estearico/polietilenglicol	1,0%
Polímero acrílico de estireno	1,0%
Goma de xantano	0,1%
Propilenglicol	5,0%
Desespumante con base de silicona	0,1%
1,2-benzisotiazolin-3-ona	0,1%
Hidrocarburo con base de petróleo aromático	20,0%
Agua	53,7%

Los compuestos de esta invención muestran actividad frente a un amplio espectro de plagas de invertebrados. Estas plagas incluyen invertebrados que habitan una variedad de medios tales como, por ejemplo, follaje de las plantas,

raíces, suelo, cultivos cosechados u otros productos alimenticios, estructuras de edificios o integumentos animales. Estas plagas incluyen, por ejemplo, invertebrados que se alimentan del follaje (que incluyen hojas, tallos, flores y frutas), semillas, madera, fibras textiles o sangre o tejidos animales, y que por lo tanto provocan lesión o daño a, por ejemplo, cultivos agronómicos en crecimiento o almacenados, bosques, cultivos de invernadero, plantas ornamentales, cultivos de cobertura, productos alimenticios almacenados o productos de fibra, o casas u otras estructuras o sus contenidos, o que son dañinos para la salud animal o salud pública. Los expertos en la técnica apreciarán que no todos los compuestos son igualmente efectivos frente a todas las etapas de crecimiento de todas las plagas.

Estos compuestos y composiciones actuales son por consiguiente útiles agronómicamente para proteger cultivos extensivos de plagas de invertebrados fitófagos, y además no agronómicamente para proteger otros cultivos hortícolas y plantas de las plagas de invertebrados fitófagos. Esta utilidad incluye proteger cultivos y otras plantas (es decir, tanto agronómicos como no agronómicos) que contienen material genético introducido por ingeniería genética (es decir, transgénicos), o modificados por mutagénesis para proporcionar características ventajosas. Ejemplos de dichas características incluyen tolerancia a los herbicidas, resistencia a las plagas fitófagas (p.ej., insectos, ácaros, pulgones, arañas, nematodos, caracoles, hongos, bacterias y virus patógenos para las plantas), crecimiento de la planta mejorado, tolerancia aumentada a condiciones de crecimiento adversas tales como altas o bajas temperaturas, baja o alta humedad del suelo, y alta salinidad, formación de flores y frutos aumentada, mayores rendimientos de cosecha, maduración más rápida, mayor calidad y/o valor nutricional del producto cosechado, o propiedades de almacenaje o procesado mejoradas de los productos cosechados. Las plantas transgénicas pueden modificarse para expresar múltiples características. Ejemplos de plantas que contienen características proporcionadas por ingeniería genética o mutagénesis incluyen variedades de maíz, algodón, soja y patata que expresan una toxina de *Bacillus thuringiensis* insecticida tal como YIELD GARD®, KNOCKOUT®, STARLINK®, BOLLGARD®, NuCOTN® y NEWLEAF®, INVICTA RR2 PRO™, y variedades tolerantes a herbicidas de maíz, algodón, soja y colza tal como ROUNDUP READY®, LIBERTY LINK®, IMI®, STS® y CLEARFIELD®, además de cultivos que expresan *N*-acetiltransferasa (GAT) para proporcionar resistencia al herbicida glifosato, o cultivos que contienen el gen HRA que proporciona resistencia a herbicidas que inhiben la acetolactato sintasa (ALS). Los presentes compuestos y composiciones pueden interactuar de forma sinérgica con características introducidas por ingeniería genética o modificados por mutagénesis, mejorando por consiguiente la expresión fenotípica o efectividad de las características o aumentando la efectividad del control de plagas de invertebrados de los presentes compuestos y composiciones. En particular, los presentes compuestos y composiciones pueden interactuar de forma sinérgica con la expresión fenotípica de proteínas u otros productos naturales tóxicos para las plagas de invertebrados para proporcionar un control mayor que aditivo de estas plagas.

Las composiciones de esta invención pueden comprender además opcionalmente nutrientes de plantas, p.ej., una composición fertilizante que comprende al menos un nutriente de plantas seleccionado de nitrógeno, fósforo, potasio, azufre, calcio, magnesio, hierro, cobre, boro, manganeso, zinc y molibdeno. Dignas de mención son las composiciones que comprenden al menos una composición fertilizante que comprende al menos un nutriente de plantas seleccionado de nitrógeno, fósforo, potasio, azufre, calcio y magnesio. Las composiciones de la presente invención que comprenden además al menos un nutriente de plantas pueden estar en forma de líquidos o sólidos. Son dignas de mención las formulaciones en forma de gránulos, pequeñas barras o comprimidos. Las formulaciones sólidas que comprenden una composición fertilizante pueden prepararse mezclando el compuesto o composición de la presente invención con la composición fertilizante junto con ingredientes de formulación y después preparando la formulación por métodos tales como granulado o extrusión. Alternativamente las formulaciones sólidas pueden prepararse pulverizando una disolución o suspensión de un compuesto o composición de la presente invención en un disolvente volátil en una composición fertilizante preparada anteriormente en forma de mezclas dimensionalmente estables, p.ej., gránulos, barras pequeñas o comprimidos, y después evaporando el disolvente.

Los usos no agronómicos se refieren a control de plagas de invertebrados en áreas distintas de campos de plantas cultivadas. Los usos no agronómicos de los presentes compuestos y composiciones incluyen el control de plagas de invertebrados en granos almacenados, judías y otros productos alimenticios, y en textiles tales como ropa y alfombras. Los usos no agronómicos de los presentes compuestos y composiciones incluyen también el control de plagas de invertebrados en plantas ornamentales, bosques, en patios, a lo largo de cunetas y derechos de paso de vías férreas, y en césped tal como prados, campos de golf y pastos. Los usos no agronómicos de los presentes compuestos y composiciones también incluyen control de plagas de invertebrados en casas y otros edificios que pueden estar ocupados por humanos y/o animales de compañía, de granja, rancho, zoo u otros animales. Los usos no agronómicos de los presentes compuestos y composiciones también incluyen el control de plagas tales como termitas que pueden dañar la madera y otros materiales estructurales usados en edificios.

Los usos no agronómicos de los presentes compuestos y composiciones también incluyen proteger la salud humana y animal controlando las plagas de invertebrados que son parasitarios o transmiten enfermedades infecciosas. El control de los parásitos de animales incluye controlar parásitos externos que son parasitarios para la superficie del cuerpo del animal huésped (p.ej., hombros, axilas, abdomen, parte interna de los muslos) y parásitos internos que son parasitarios al interior del cuerpo del animal huésped (p.ej., estómago, intestino, pulmón, venas, bajo la piel, tejido linfático). Las plagas externas parasitarias o que transmiten enfermedades incluyen, por ejemplo, niguas, garrapatas, piojos, mosquitos, moscas, ácaros y pulgas. Los parásitos internos incluyen gusanos del corazón, anquilostomas y helmintos. Los compuestos y composiciones de la presente invención son adecuados para el

control sistémico y/o no sistémico de infestación o infección por parásitos en los animales. Los compuestos y composiciones de la presente invención son particularmente adecuados para combatir las plagas externas parasitarias o que transmiten enfermedades. Los compuestos y composiciones de la presente invención son adecuados para combatir parásitos que infestan los animales para el trabajo agrícola, tales como ganado vacuno, 5 ovejas, cabras, caballos, cerdos, burros, camellos, búfalos, conejos, gallinas, pavos, patos, ocas y abejas; mascotas y animales domésticos tales como perros, gatos, pájaros y peces de acuario; además de los denominados animales experimentales, tales como hámsteres, cobayas, ratas y ratones. Combatiendo estos parásitos, las fatalidades y la reducción de rendimiento (en términos de carne, leche, lana, pieles, huevos, miel, etc.) se reducen, de manera que aplicar una composición que comprende un compuesto de la presente invención permite la cría de animales más 10 económica y sencilla.

Ejemplos de plagas de invertebrados agronómicas o no agronómicas incluyen huevos, larvas y adultos del orden Lepidoptera, tal como gusanos soldados, gusanos cortadores, gusanos medidores, heliothines en la familia Noctuidae (p.ej. barrenador rosado del tallo (*Sesamia inferens* Walker), barrenador del tallo de maíz (*Sesamia nonagrioides* Lefebvre), gusano meridional (*Spodoptera eridania* Cramer), palomilla del maíz (*Spodoptera frugiperda* J.E. Smith), rosquilla verde (*Spodoptera exigua* Hübner), oruga de la hoja del algodónero (*Spodoptera littoralis* Boisduval), gusano soldado de franjas amarillas (*Spodoptera ornithogalli* Guenée), gusano cortador negro (*Agrotis ipsilon* Hufnagel), oruga de las leguminosas (*Anticarsia gemmatalis* Hübner), gusano de la fruta verde (*Lithophane antennata* Walker), gusano soldado de la col (*Barathra brassicae* Linnaeus), gusano medidor de la soja (*Pseudoplusia includens* Walker), gusano medidor de la col (*Trichoplusia ni* Hübner), gusano de las yemas del tabaco (*Heliothis virescens* Fabricius)); barrenadores, minadoras, palomillas, orugas de la piña del pino, gusanos de la col y esqueletizadores de la familia Pyralidae (p.ej., barrenador del maíz europeo (*Ostrinia nubilalis* Hübner), gusano de la naranja navel (*Amyelois transitella* Walker), palomilla de la raíz del maíz (*Crambus caliginosellus* Clemens), palomillas (Pyralidae: *Crambinae*) tal como gusano del pasto (*Herpetogramma licarsisalis* Walker), barrenador del tallo de la caña de azúcar (*Chilo infuscatellus* Snellen), barrenador pequeño del tomate (*Neoleucinodes elegantalis* Guenée), enrollador de hojas verde (*Cnaphalocrocis medinalis*), oruga de la hoja de la uva (*Desmia funeralis* Hübner), gusano del melón (*Diaphania nitidalis* Stoll), larva del centro de la col (*Helluala hydralis* Guenée), barrenador del tallo amarillo (*Scirpophaga incertulas* Walker), barrenador del brote temprano (*Scirpophaga infuscatellus* Snellen), barrenador del tallo blanco (*Scirpophaga innotata* Walker), barrenador del brote alto (*Scirpophaga nivella* Fabricius), barrenador del arroz de cabeza oscura (*Chilo polychrysus* Meyrick), barrenador del arroz rayado (*Chilo suppressalis* Walker), oruga del racimo de la col (*Crociodolomia binotalis* English)); enrolladores de hojas, gusanos de las yemas, gusanos de las semillas y gusanos de los frutos en la familia Tortricidae (p.ej., polilla de las manzanas (*Cydia pomonella* Linnaeus), polilla de la uva (*Endopiza viteana* Clemens), polilla de la fruta oriental (*Grapholita molesta* Busck), polilla del cítrico (*Cryptophlebia leucotreta* Meyrick), barrenador de los cítricos (*Ecdytolopa aurantiana* Lima), enrollador de hojas de bandas rojas (*Argyrotaenia velutinana* Walker), enrollador de hojas de banda oblicua (*Choristoneura rosaceana* Harris), polilla de la manzana marrón clara (*Epiphyas postvittana* Walker), polilla de la uva europea (*Eupoecilia ambiguella* Hübner), polilla de las yemas de la manzana (*Pandemis pyrusana* Kearfott), enrollador de hojas omnívoro (*Platynota stultana* Walsingham), tortrix de los frutales barrada (*Pandemis cerasana* Hübner), tortrix marrón de la manzana (*Pandemis heparana* Denis & Schiffermuller)); y muchos otros lepidópteros económicamente importantes (p.ej., polilla de dorso negro (*Plutella xylostella* Linnaeus), lagarta rosada (*Pectinophora gossypiella* Saunders), lagarta peluda (*Lymantria dispar* Linnaeus), barrenador del melocotón (*Carposina niponensis* Walsingham), barrenador de la ramita de melocotón (*Anarsia lineatella* Zeller), polilla del tubérculo de la patata (*Phthorimaea operculella* Zeller), minador teniforme manchado (*Lithocolletis blancardella* Fabricius), minador de la manzana asiático (*Lithocolletis ringoniella* Matsumura), enrollador de las hojas del arroz (*Lerodea eufala* Edwards), minador de la manzana (*Leucoptera scitella* Zeller)); huevos, ninfas y adultos del orden Blattodea que incluyen cucarachas de las familias Blattellidae y Blattidae (p.ej., cucaracha oriental (*Blatta orientalis* Linnaeus), cucaracha asiática (*Blattella asahinai* Mizukubo), cucaracha alemana (*Blattella germanica* Linnaeus), cucaracha con bandas marrones (*Supella longipalpa* Fabricius), cucaracha americana (*Periplaneta americana* Linnaeus), cucaracha marrón (*Periplaneta brunnea* Burmeister), cucaracha de Madeira (*Leucophaea maderae* Fabricius)), cucaracha marrón ahumada (*Periplaneta fuliginosa* Service), cucaracha australiana (*Periplaneta australasiae* Fabr.), cucaracha moteada (*Nauphoeta cinerea* Olivier), cucaracha blanda (*Symptloce pallens* Stephens)); huevos, larvas de alimentación foliar, alimentación con fruta, alimentación con raíces, alimentación con semillas y alimentación de tejido vesicular y adultos del orden Coleoptera que incluyen gorgojos de las familias Anthribidae, Bruchidae y Curculionidae (p.ej., picudo del algodónero (*Anthonomus grandis* Boheman), gorgojo de agua del arroz (*Lissorhoptrus oryzophilus* Kuschel), gorgojo de los graneros (*Sitophilus granarius* Linnaeus), gorgojo del arroz (*Sitophilus oryzae* Linnaeus)), gorgojo azul de los prados (*Listronotus maculicollis* Dietz), picudo de los prados (*Sphenophorus parvulus* Gyllenhal), gorgojo cazador (*Sphenophorus venatus vestitus*), gorgojo de Denver (*Sphenophorus cicatristriatus* Fahraeus)); escarabajos pequeños, escarabajos del pepino, gusanos de las raíces, escarabajos de las hojas, escarabajos de la patata y minadores en la familia Chrysomelidae (p.ej., escarabajo de la patata de Colorado (*Leptinotarsa decemlineata* Say), gusano de la raíz del maíz occidental (*Diabrotica virgifera virgifera* LeConte)); gusanos blancos y otros escarabajos de la familia Scarabaeidae (p.ej., escarabajo japonés (*Popillia japonica* Newman), escarabajo oriental (*Anomala orientalis* Waterhouse, *Exomala orientalis* (Waterhouse) Baraud), gusano blanco enmascarado del norte (*Cyclocephala borealis* Arrow), gusano blanco enmascarado del sur (*Cyclocephala immaculata* Olivier o *C. lurida* Bland), escarabajos peloteros y gusanos blancos (*Aphodius* spp.), ataenius del césped negro (*Ataenius spretulus* Haldeman), escarabajo de junio verde (*Cotinis nitida* Linnaeus), escarabajo de jardín asiático (*Maladera castanea* Arrow), escarabajos de mayo/junio 65

(*Phyllophaga* spp.) y gusano blanco europeo (*Rhizotrogus majalis* Razoumowsky)); escarabajos de las alfombras de la familia Dermestidae; gusanos de alambre de la familia Elateridae; perforadores de la corteza de la familia Scolytidae y escarabajos de la harina de la familia Tenebrionidae.

5 Además, las plagas agronómicas y no agronómicas incluyen: huevos, adultos y larvas del orden Dermaptera que incluyen tijeretas de la familia Forficulidae (p.ej., tijereta europea (*Forficula auricularia* Linnaeus), tijereta negra (*Chelisoches morio* Fabricius)); huevos, inmaduros, adultos y ninfas de los órdenes Hemiptera y Homoptera tales como, chinches de las plantas de la familia Miridae, cigarras de la familia Cicadidae, saltahojas (p.ej. *Empoasca* spp.) de la familia Cicadellidae, chinches de la cama (p.ej., *Cimex lectularius* Linnaeus) de la familia Cimicidae, saltapuntas de las familias Fulgoroidae y Delphacidae, saltadores de árboles de la familia Membracidae, pulgillas de la familia Psyllidae, moscas blancas de la familia Aleyrodidae, pulgones de la familia Aphididae, filoxera de la familia Phylloxeridae, piojos blancos de la familia Pseudococcidae, sarros de la familia Coccidae, Diaspididae y Margarodidae, insectos de encaje de la familia Tingidae, chinches hediondos de la familia Pentatomidae, chinches (p.ej., chinches del cabello (*Blissus leucopterus hirtus* Montandon) y chinches del sur (*Blissus insularis* Barber)) y otros chinches de las semillas de la familia Lygaeidae, afróforas de la familia Cercopidae, chinche de la calabaza de la familia Coreidae y chinches rojos y manchadores del algodón de la familia Pyrrhocoridae.

Las plagas agronómicas y no agronómicas también incluyen: huevos, larvas, ninfas y adultos del orden Acari (ácaros) tales como arañuelas rojas y ácaros rojos de la familia Tetranychidae (p.ej. ácaros rojos europeos (*Panonychus ulmi* Koch), arañuela roja de dos manchas (*Tetranychus urticae* Koch), ácaro de McDaniel (*Tetranychus mcdanieli* McGregor)); ácaros planos en la familia Tenuipalpidae (p.ej., ácaro plano de los cítricos (*Brevipalpus lewisi* McGregor)); aradores y ácaros de las yemas en la familia Eriophyidae y otros ácaros de alimentación foliar y ácaros importantes en la salud humana y animal, es decir, ácaros del polvo en la familia Epidermoptidae, ácaros de los folículos en la familia Demodicidae, ácaros del grano en la familia Glycyphagidae; garrapatas en la familia Ixodidae, normalmente conocidas como garrapatas duras (p.ej., garrapata del venado (*Ixodes scapularis* Say), garrapata de la parálisis australiana (*Ixodes holocyclus* Neumann), garrapata del perro americana (*Dermacentor variabilis* Say), garrapata de la estrella solitaria (*Amblyomma americanum* Linnaeus)) y garrapatas de la familia Argasidae, normalmente conocidas como garrapatas blandas (p.ej., garrapata de la fiebre recurrente (*Ornithodoros turicata*), garrapata de las aves común (*Argas radiatus*)); aradores de la sarna y ácaros de la sarna en las familias Psoroptidae, Pyemotidae y Sarcoptidae; huevos, adultos e inmaduros del orden Orthoptera que incluyen saltamontes, langostas y grillos (p.ej., saltamontes migratorios (p.ej., *Melanoplus sanguinipes* Fabricius, *M. differentialis* Thomas), saltamontes americanos (p.ej., *Schistocerca americana* Drury), langosta del desierto (*Schistocerca gregaria* Forskal), langosta migratoria (*Locusta migratoria* Linnaeus), langosta del arbusto (*Zonocerus* spp.), grillo doméstico (*Acheta domestica* Linnaeus), grillo topo (p.ej. grillo topo leonado (*Scapteriscus vicinus* Scudder) y grillo topo del sur (*Scapteriscus borellii* Giglio-Tos)); huevos, adultos e inmaduros del orden Diptera que incluyen minadores (p.ej., *Liriomyza* spp. tal como minador de las hojas de vegetales serpentinos (*Liriomyza sativae* Blanchard)), mosquitos, moscas de la fruta (Tephritidae), moscas frit (p.ej., *Oscinella frit* Linnaeus), gusanos del suelo, moscas domésticas (p.ej., *Musca domestica* Linnaeus), mosca doméstica menor (p.ej., *Fannia canicularis* Linnaeus, *F. femoralis* Stein), moscas de los establos (p.ej., *Stomoxys calcitrans* Linnaeus), moscas de la cara, moscas de los cuernos, moscas de la carne (p.ej., *Chrysomya* spp., *Phormia* spp.), y otras plagas de moscas muscoides, tábanos (p.ej., *Tabanus* spp.), estros (p.ej., *Gastrophilus* spp., *Oestrus* spp.), reznos (p.ej., *Hypoderma* spp.), moscas de los venados (p.ej., *Chrysops* spp.), melófagos (p.ej., *Melophagus ovinus* Linnaeus) y otros Brachycera, mosquitos (p.ej., *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Culex* spp.), moscas negras (p.ej., *Prosimulium* spp., *Simulium* spp.), mosquitos picadores, moscas de la arena, esciáridos y otros Nematocera; huevos, adultos e inmaduros del orden Thysanoptera que incluyen trips de la cebolla (*Thrips tabaci* Lindeman), trips de las flores (*Frankliniella* spp.), y otros trips que se alimentan de hojas; plagas de insectos del orden Hymenoptera que incluyen hormigas de la familia Formicidae que incluyen la hormiga carpintera de Florida (*Camponotus floridanus* Buckley), hormiga carpintera roja (*Camponotus ferrugineus* Fabricius), hormiga carpintera negra (*Camponotus pennsylvanicus* De Geer), hormiga de patas blancas (*Technomyrmex albipes* fr. Smith), hormigas de cabeza grande (*Pheidole* sp.), hormiga fantasma (*Tapinoma melanocephalum* Fabricius); hormiga cosechadora (*Monomorium pharaonis* Linnaeus), hormiga de fuego pequeña (*Wasmannia auropunctata* Roger), hormiga de fuego (*Solenopsis geminata* Fabricius), hormiga de fuego importada roja (*Solenopsis invicta* Buren), hormiga argentina (*Iridomyrmex humilis* Mayr), hormiga loca (*Paratrechina longicornis* Latreille), hormiga del pavimento (*Tetramorium caespitum* Linnaeus), hormiga del campo de maíz (*Lasius alienus* Forster) y hormiga doméstica olorosa (*Tapinoma sessile* Say). Otros Hymenoptera que incluyen abejas (que incluyen abejas carpinteras), avispones, avispas amarillas, avispas y moscas de sierra (*Neodiprion* spp.; *Cephus* spp.); plagas de insectos del orden Isoptera que incluyen termitas en las familias Termitidae (p.ej., *Macrotermes* sp., *Odontotermes obesus* Rambur), kalotermitidae (p.ej., *Cryptotermes* sp.) y Rhinotermitidae (p.ej., *Reticulitermes* sp., *Coptotermes* sp., *Heterotermes tenuis* Hagen), la termita subterránea oriental (*Reticulitermes flavipes* Kollar), termita subterránea occidental (*Reticulitermes hesperus* Banks), termita subterránea de Formosa (*Coptotermes formosanus* Shiraki), termitas de la madera seca de las indias occidentales (*Incisitermes immigrans* Snyder), termita del polvo (*Cryptotermes brevis* Walker), termita de la madera seca (*Incisitermes snyderi* Light), termita subterránea suoriental (*Reticulitermes virginicus* Banks), termita de la madera seca occidental (*Incisitermes minor* Hagen), termitas arbóreas tal como *Nasutitermes* sp. y otras termitas de importancia económica; plagas de insectos del orden Thysanura tales como pececillo plateado (*Lepisma saccharina* Linnaeus) e insectos de fuego (*Thermobia domestica* Packard); plagas de insectos del orden Mallophaga e incluyen piojo de la cabeza (*Pediculus humanus capitis* De Geer), piojo del cuerpo (*Pediculus humanus* Linnaeus), piojo del

cuerpo del pollo (*Menacanthus stramineus* Nitzsch), piojo mordedor del perro (*Trichodectes canis* De Geer), piojo de la pelusa (*Goniocotes gallinae* De Geer), piojo del cuerpo de la oveja (*Bovicola ovis* Schrank), piojo del ganado de nariz corta (*Haematopinus eurysternus* Nitzsch), piojo del ganado de nariz larga (*Linognathus vituli* Linnaeus) y otros piojos parasitarios que chupan y mastican que atacan al hombre y a los animales; plagas de insectos del orden Siphonoptera que incluyen la pulga de rata oriental (*Xenopsylla cheopis* Rothschild), pulga del gato (*Ctenocephalides felis* Bouche), pulga del perro (*Ctenocephalides canis* Curtis), pulga de la gallina (*Ceratophyllus gallinae* Schrank), pulga adherente (*Echidnophaga gallinacea* Westwood), pulga humana (*Pulex irritans* Linnaeus) y otras pulgas que afectan a mamíferos y aves. Plagas de artrópodos adicionales cubiertas incluyen: arañas del orden Araneae tal como la araña reclusa marrón (*Loxosceles reclusa* Gertsch & Mulaik) y la araña viuda negra (*Latrodectus mactans* Fabricius), y ciempiés del orden Scutigeraomorpha tales como el ciempiés doméstico (*Scutigera coleoptrata* Linnaeus).

Ejemplos de plagas de invertebrados del grano almacenado incluyen barrenador del grano más largo (*Prostephanus truncatus*), barrenador del grano más pequeño (*Rhyzopertha dominica*), gorgojo del arroz (*Stiophilus oryzae*), gorgojo del maíz (*Stiophilus zeamais*), gorgojo del caupí (*Callosobruchus maculatus*), escarabajo de la harina rojo (*Tribolium castaneum*), gorgojo del granero (*Stiophilus granarius*), palomilla bandeada (*Plodia interpunctella*), escarabajo de la harina mediterráneo (*Ephestia kuhniella*) y escarabajo del grano plano o rojizo (*Cryptolestis ferrugineus*).

Los compuestos de la presente invención pueden tener actividad en miembros de las clases Nematoda, Cestoda, Trematoda y Acanthocephala que incluyen miembros económicamente importantes de las órdenes Strongylida, Ascaridida, Oxyurida, Rhabditida, Spirurida y Enoplida tales como aunque no limitados a plagas agrícolas económicamente importantes (es decir, nematodo de los nudos de la raíz en el género *Meloidogyne*, nematodos de lesión en el género *Pratylenchus*, nematodos de raíces cortas del género *Trichodorus*, etc.) y plagas para la salud animal y humana (es decir, todos los trematodos, cestodos y ascárides económicamente importantes, tales como *Strongylus vulgaris* en caballos, *Toxocara canis* en perros, *Haemonchus contortus* en ovejas, *Diriofilaria immitis* Leidy en perros, *Anoplocephala perfoliata* en caballos, *Fasciola hepatica* Linnaeus en rumiante, etc.).

Los compuestos de la invención pueden tener actividad frente a las plagas en el orden Lepidoptera (p.ej., *Alabama argillacea* Hübner (gusano de las hojas del algodón), *Archips argyrospila* Walker (enrollador de hojas de árboles frutales), *A. Rosana* Linnaeus (enrollador de las hojas europeo) y otras especies Archips, *Chilo suppressalis* Walker (barrenador del tallo del arroz), *Cnaphalocrosis medinalis* Guenée (enrollador de las hojas del arroz), *Crambus caliginosellus* Clemens (palomilla de la raíz del maíz), *Crambus teterrellus* Zincken (gusano de la poa), *Cydia pomonella* Linnaeus (gusano de la manzana), *Earias insulana* Boisduval (oruga espinosa de las cápsulas), *Earias vittella* Fabricius (oruga moteada), *Helicoverpa armigera* Hübner (oruga americana), *Helicoverpa zea* Boddie (gusano de la mazorca de maíz), *Heliiothis virescens* Fabricius (gusano de las yemas del tabaco), *Herpetogramma licarsisalis* Walker (gusano del pasto), *Lobesia botrana* Denis & Schiffer-müller (polilla de la uva), *Pectinophora gossypiella* Saunders (lagarta rosada), *Phyllocnistis citrella* Stainton (minador de las hojas de los cítricos), *Pieris brassicae* Linnaeus (mariposa blanca grande), *Pieris rapae* Linnaeus (mariposa blanca pequeña), *Plutella xylostella* Linnaeus (polilla de la col), *Spodoptera exigua* Hübner (rosquilla verde), *Spodoptera litura* Fabricius (gusano cortador del tabaco, rosquilla negra), *Spodoptera frugiperda* J.E. Smith (gusano cogollero del maíz), *Trichoplusia ni* Hübner (gusano medidor de la col) y *Tuta absoluta* Meyrick (minador de la hoja del tomate)).

Los compuestos de la invención tienen actividad significativa en miembros del orden Homoptera que incluyen: *Acyrtosiphon pisum* Harris (pulgón del guisante), *Aphis craccivora* Koch (pulgón del caupí), *Aphis fabae* Scopoli (pulgón negro de las habas), *Aphis gossypii* Glover (pulgón del algodón, pulgón del melón), *Aphis pomi* De Geer (pulgón de la manzana), *Aphis spiraecola* Patch (pulgón de los cítricos), *Aulacorthum solani* Kaltentbach (pulgón de la patata), *Chaetosiphon fragaefolii* Cockerell (pulgón de la fresa), *Diuraphis noxia* Kurdjumov/Mordvilko (pulgón del trigo ruso), *Dysaphis plantaginea* Paaserini (pulgón rojo del manzano), *Eriosoma lanigerum* Hausmann (pulgón lanudo de la manzana), *Hyalopterus pruni* Geoffroy (pulgón verde harinoso del ciruelo), *Lipaphis erysimi* Kaltentbach (pulgón del nabo), *Metopolophium dirrhodum* Walker (pulgón del cereal), *Macrosiphum euphorbiae* Thomas (pulgón de la patata), *Myzus persicae* Sulzer (pulgón del melocotonero y la patata, pulgón verde del melocotonero), *Nasonovia ribisnigri* Mosley (pulgón de la lechuga), *Pemphigus* spp. (pulgón de las raíces y pulgón productor de agallas), *Rhopalosiphum maidis* Fitch (pulgón de la hoja de maíz), *Rhopalosiphum padi* Linnaeus (pulgón de la cereza), *Schizaphis graminum* Rondani (pulgón verde de los cereales), *Sitobion avenae* Fabricius (pulgón del grano inglés), *Therioaphis maculata* Buckton (pulgón de la alfalfa moteado), *Toxoptera aurantii* Boyer de Fonscolombe (pulgón negro de los cítricos) y *Toxoptera citricida* Kirkaldy (pulgón marrón de los cítricos); *Adelges* spp. (adélgidos); *Phylloxera devastatrix* Pergande (filoxera del nogal); *Bemisia tabaci* Gennadius (mosca blanca del tabaco, mosca blanca de la batata), *Bemisia argentifolii* Bellows & Perring (mosca blanca del mal del plomo del ciruelo), *Dialeurodes citri* Ashmead (mosca blanca de los cítricos) y *Trialeurodes vaporariorum* Westwood (mosca blanca del invernadero); *Empoasca fabae* Harris (saltahojas de la patata), *Laodelphax striatellus* Fallen (saltaplantas marrón pequeño), *Macrolestes quarilineatus* Forbes (saltahojas áster), *Nephotettix cincticeps* Uhler (saltahojas verde), *Nephotettix nigropictus* Stål (saltahojas del arroz), *Nilaparvata lugens* Stål (saltaplantas marrón), *Peregrinus maidis* Ashmead (saltaplantas del maíz), *Sogatella furcifera* Horvath (saltaplantas del espalda blanca), *Sogatodes orizicola* Muir (delfácido del arroz), *Typhlocyba pomaria* McAtee (saltahojas blanco de la manzana), *Erythroneoura* spp. (saltahojas de la uva); *Magacidada septendecim* Linnaeus (cigarra periódica); *Icerya purchasi* Maskell (cochinilla acanalada), *Quadraspidiotus perniciosus* Comstock (cochinilla de San José), *Planococcus citri* Risso (piojo blanco de los

cítricos); *Pseudococcus* spp. (otros complejos de piojo blanco); *Cacopsylla pyricola* Foerster (pulguilla del peral), *Trioza diospyri* Ashmead (pulguilla del caqui).

Los compuestos de esta invención también tienen actividad en miembros del orden Hemiptera que incluyen *Acrosternum hilare* Say (chinche hedionda verde), *Anasa tristis* De Geer (chinche de la calabaza), *Blissus leucopterus leucopterus* Say (chinche del prado), *Cimex lectularius* Linnaeus (chinche de la cama) *Corythuca gossypii* Fabricius (insecto de encaje del algodón), *Cyrtopeltis modesta* Distant (chinche del tomate), *Dysdercus suturellus* Herrich-Schäffer (chinche tintórea), *Euchistus servus* Say (chinche hedionda marrón), *Euchistus variolarius* Palisot de Beauvois (chinche hedionda de una mancha), *Graptosthetus* spp. (complejo de chinches de las semillas), *Halymorpha halys* Stål (chinche marmóreo marrón), *Leptoglossus corculus* Say (chinche de patas de hojas del pino), *Lygus lineolaris* Palisot de Beauvois (chinche manchador), *Nezara viridula* Linnaeus (chinche hedionda verde del sur), *Oebalus pugnax* Fabricius (chinche hedionda del arroz), *Oncopeltus fasciatus* Dallas (chinche grande de la algodoncilla), *Pseudatomoscelis seriatus* Reuter (saltahojas del algodón). Otros órdenes de insectos controlados por los compuestos de la invención incluyen Thysanoptera (p.ej., *Frankliniella occidentalis* Pergande (trips de las flores occidentales), *Scirtothrips citri* Moulton (trips de los cítricos), *Sericothrips variabilis* Beach (trips de la soja) y *Thrips tabaci* Lindeman (trips de la cebolla); y el orden Coleoptera (p.ej., *Leptinotarsa decemlineata* Say (escarabajo de la patata de Colorado), *Epilachna varivestis* Mulsant (escarabajo de la judía mejicano) y gusanos de alambre de los géneros *Agriotes*, *Athous* o *Limonius*).

Notar que algunos sistemas de clasificación contemporáneos sitúan al Homoptera como un suborden en el orden Hemiptera.

Digno de mención es el uso de los compuestos de esta invención para controlar los trips de las flores occidentales (*Frankliniella occidentalis*). Digno de mención es el uso de los compuestos de esta invención para controlar los saltahojas de la patata (*Empoasca fabae*). Digno de mención es el uso de los compuestos de esta invención para controlar el pulgón del algodón y el melón (*Aphis gossypii*). Digno de mención es el uso de los compuestos de esta invención para controlar al pulgón verde del melocotonero (*Myzus persicae*). Digno de mención es el uso de los compuestos de esta invención para controlar la mosca blanca de la batata (*Bemisia tabaci*).

Los compuestos de la presente invención pueden también ser útiles para aumentar el vigor de una planta cultivada. Este método comprende poner en contacto la planta cultivada (p.ej., follaje, flores, frutas o raíces) o la semilla de la que se cultiva la planta cultivada con un compuesto de Fórmula 1 en cantidad suficiente para alcanzar el efecto de vigor de la planta deseado (es decir cantidad biológicamente efectiva). Típicamente el compuesto de Fórmula 1 se aplica en una composición formulada. Aunque el compuesto de Fórmula 1 se aplica a menudo directamente a la planta cultivada o su semilla, también puede aplicarse a la ubicación de la planta cultivada, es decir el medio de la planta cultivada, particularmente la parte del medio en una proximidad suficientemente cerca para permitir al compuesto de Fórmula 1 para migrar a la planta cultivada. La ubicación relevante a este método comprende normalmente el medio de crecimiento (es decir el medio que proporciona nutrientes a la planta), típicamente el suelo en que la planta se cultiva. El tratamiento de una planta cultivada para aumentar el vigor de la planta cultivada comprende por consiguiente poner en contacto la planta cultivada, la semilla de la que se cultiva la planta cultivada o la ubicación de la planta cultivada con una cantidad biológicamente efectiva de un compuesto de Fórmula 1.

El vigor del cultivo aumentado puede dar por resultado uno o más de los siguientes efectos observados: (a) el establecimiento óptimo del cultivo como se demuestra por la excelente germinación de las semillas, la aparición del cultivo y la posición del cultivo; (b) crecimiento del cultivo mejorado como se demuestra por el rápido y robusto crecimiento de la hoja (p.ej., medido por el índice del área de la hoja), altura de la planta, número de brotes (p.ej., para el arroz), masa de la raíz y el peso seco total de la masa vegetal del cultivo; (c) rendimientos del cultivo mejorados, como se demuestra con el tiempo de floración, duración de la floración, número de flores, acumulación de la biomasa total (es decir cantidad de rendimiento) y/o el grado de comerciabilidad de la fruta o el grano del producto agrícola (es decir, calidad del rendimiento); (d) capacidad mejorada del cultivo para resistir o prevenir las infecciones de enfermedad de la planta e infestaciones de plagas de artrópodos, nematodos o moluscos; y (e) capacidad aumentada del cultivo para resistir las tensiones ambientales tales como exposición a extremos térmicos, humedad subóptima o compuestos químicos fitotóxicos.

Los compuestos de la presente invención pueden aumentar el vigor de las plantas tratadas en comparación con las plantas no tratadas matando o evitando de otra forma la alimentación de plagas de invertebrados fitófagos en el medio de las plantas. En ausencia de dicho control de plagas de invertebrados fitófagos, las plagas reducen el vigor de las plantas consumiendo tejidos o savia de las plantas, o transmitiendo patógenos a la planta tales como virus. Incluso en ausencia de plagas de invertebrados fitófagos, los compuestos de la invención pueden aumentar el vigor de las plantas modificando el metabolismo de las plantas. Generalmente, el vigor de una planta cultivada se aumentará lo más significativamente tratando la planta con un compuesto de la invención si la planta se cultiva en un medio no ideal, es decir, un medio que comprende uno o más aspectos adversos a la planta que alcanza el potencial genético total que mostraría en un medio ideal.

Es digno de mención un método para aumentar el vigor de una planta cultivada en el que la planta cultivada se cultiva en un medio que comprende plagas de invertebrados fitófagos. También es digno de mención un método para aumentar el vigor de una planta cultivada en el que la planta cultivada se cultiva en un medio que no

comprende plagas de invertebrados fitófagos. También es digno de mención un método para aumentar el vigor de una planta cultivada en el que la planta cultivada se cultiva en un medio que comprende una cantidad de humedad menor que la ideal para soportar el crecimiento de la planta cultivada. Es digno de mención un método para aumentar el vigor de una planta cultivada en el que el cultivo es arroz. También es digno de mención un método para aumentar el vigor de una planta cultivada en el que el cultivo es maíz. También es digno de mención un método para aumentar el vigor de una planta cultivada en el que el cultivo es soja.

Los compuestos de esta invención pueden también mezclarse con uno o más compuestos o agentes biológicamente activos que incluyen insecticidas, fungicidas, nematocidas, bactericidas, acaricidas, herbicidas, protectores contra herbicidas, reguladores del crecimiento tales como inhibidores de la muda de los insectos y estimulantes del enraizamiento, quimioesterilizantes, semioquímicos, repelentes, atrayentes, feromonas, estimulantes de la alimentación, otros compuestos biológicamente activos o bacterias, virus u hongos entomopatógenos para formar un pesticida multi-componente que da un espectro incluso más amplio de utilidad agronómica y no agronómica. Por consiguiente la presente invención también pertenece a una composición que comprende una cantidad biológicamente efectiva de un compuesto de Fórmula 1, al menos un componente adicional seleccionado del grupo que consiste en tensioactivos, diluyentes sólidos y diluyentes líquidos, y al menos un compuesto o agente biológicamente activo adicional. Para mezclas de la presente invención, los otros compuestos u agentes biológicamente activos pueden formularse junto con los presentes compuestos, que incluyen los compuestos de Fórmula 1, para formar una premezcla, o los otros compuestos o agentes biológicamente activos pueden formularse de forma separada a partir de los presentes compuestos, que incluyen los compuestos de Fórmula 1, y las dos formulaciones combinadas antes de la aplicación (p.ej., en un tanque de pulverización) o, de forma alternativa, aplicados en sucesión.

Ejemplos de dichos compuestos o agentes biológicamente activos con cuyos compuestos de esta invención pueden formularse son insecticidas tales como abamectina, acefato, acequinocilo, acetamiprid, acrinatrina, afidopiropeno (ciclopropano-carboxilato de [(3S,4R,4aR,6S,6aS,12R,12aS,12bS)-3-[(ciclopropilcarbonil)oxi]-1,3,4,4a,5,6,6a,12,12a,12b-decahidro-6,12-dihidroxi-4,6a,12b-trimetil-11-oxo-9-(3-piridinil)-2H,11H-nafto[2,1-b]pirano[3,4-e]piran-4-il]metilo), amidoflumet, amitraz, avermectina, azadiractina, azinfos-metilo, benfuracarb, bensultap, bifentrina, bifenazato, bistriflurona, borato, buprofezina, cadusafos, carbarilo, carbofurano, cartap, carzol, clorantraniliprol, clorfenapir, clorfluazurona, clorpirifos, clorpirifos-metilo, cromafenozida, clofentezina, clotianidina, ciantraniliprol (3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-N-[4-ciano-2-metil-6-[(metilamino)carbonil]fenil]-1H-pirazol-5-carboxamida), ciclaniliprol (3-bromo-N-[2-bromo-4-cloro-6-[[1-ciclopropiletil]amino]carbonil]fenil]-1-(3-cloro)-2-piridinil)-1H-pirazol-5-carboxamida), cicloprotrina, cicloxaprid ((5S,8R)-1-[(6-cloro-3-piridinil)metil]-2,3,5,6,7,8-hexahidro-9-nitro-5,8-epoxi-1H-imidazo[1,2-a]azepina) ciflumetofeno, ciflutrina, beta-ciflutrina, cihalotrina, gamma-cihalotrina, lambda-cihalotrina, cipermetrina, alfa-cipermetrina, zeta-cipermetrina, ciromazina, deltametrina, diafentiuurona, diazinona, dieldrina, diflubenzurona, dimeflutrina, dimehipo, dimetoato, dinotefurano, diofenolano, emamectina, endosulfano, esfenvalerato, etiprol, etofenprox, etoxazol, óxido de fenbutatina, feniltrotiona, fenotiocarb, fenoxicarb, fenpropatrina, fenvalerato, fipronilo, flometoquina (2-etil-3,7-dimetil-6-[4-(trifluorometoxi)fenoxi]-4-quinolinilmetil carbonato), flonicamid, flubendiamida, flucitrinato, flufenimer, flufenoxurona, flufenoxiestrobina ((αE)-2-[[2-cloro-4-(trifluorometil)fenoxi]metil]-α-(metoximetileno)benconoacetato de metilo), fluensulfona (5-cloro-2-[(3,4,4-trifluoro-3-buten-1-il)sulfonil]tiazol), fluhexafona, fluopiram, flupiprol (1-[2,6-dicloro-4-(trifluorometil)fenil]-5-[[2-metil-2-propen-1-il]amino]-4-[(trifluorometil)sulfonil]-1H-pirazol-3-carbonitrilo), flupiradifurona (4-[[6-cloro-3-piridinil]metil](2,2-difluoroetil)amino)-2(5H)-furanona), fluvalinato, tau-fluvalinato, fonofos, formetanato, fostiazato, halofenozida, heptaflutrina (2,2-dimetil-3-[(1Z)-3,3,3-trifluoro-1-propen-1-il]ciclopropanocarboxilato de [2,3,5,6-tetrafluoro-4-(metoximetil)fenil]metilo), hexaflumurona, hexitiazox, hidrametilnona, imidacloprid, indoxacarb, jabones insecticidas, isofenfos, lufenurona, malatión, meperflutrina ((1R,3S)-3-(2,2-dicloroetil)-2,2-dimetilciclopropanocarboxilato de [2,3,5,6-tetrafluoro-4-(metoximetil)fenil]metilo), metaflumizona, metaldehído, metamidofos, metidiazona, metiodicarb, metomilo, metopreno, metoxiclor, metoflutrina, metoxifenozida, metoflutrina, monocrotofos, monofluorotrina (3-(2-ciano-1-propen-1-il)-2,2-dimetilciclopropanocarboxilato de [2,3,5,6-tetrafluoro-4-(metoximetil)fenil]metilo), nicotina, nitenpiram, nitiazina, novalurona, noviflumurona, oxamilo, paratión, paratión-metilo, permetrina, forato, fosalona, fosmet, fosfamidona, pirimicarb, profenofos, proflutrina, propargita, protrifenbute, piflubumida (1,3,5-trimetil-N-(2-metil-1-oxopropil)-N-[3-(2-metilpropil)-4-[2,2,2-trifluoro-1-metoxi-1-(trifluorometil)etil]fenil]-1H-pirazol-4-carboxamida), pimetozina, pirafuprol, piretrina, piridabeno, piridalilo, pirifluquinazona, piriminostrobina ((αE)-2-[[[2-(2,4-diclorofenil)amino]-6-(trifluorometil)-4-pirimidinil]oxi]metil]-α-(metoximetileno)benconoacetato de metilo), piriprol, piriproxifeno, rotenona, rianodina, silafluofeno, espinetoram, espinosad, espirociclofeno, espiromesifeno, espirotetramat, sulprofos, sulfoxaflor (N-[metilóxido[1-[6-(trifluorometil)-3-piridinil]etil]-λ⁴-sulfanilideno]cianamida), tebufenozida, tebufenpirad, teflubenzurona, teflutrina, terbufos, tetraclorvinfos, tetrametrina, tetrametilflutrina (2,2,3,3-tetrametilciclopropanocarboxilato de [2,3,5,6-tetrafluoro-4-(metoximetil)fenil]metilo), tetraniliprol, tiacloprid, tiametoxam, tiodicarb, tiosultap-sodio, tioazafeno (3-fenil-5-(2-tienil)-1,2,4-oxadiazol), telfopirad, tralometrina, triazamato, triclorfona, triflumezopirim (sal interna de 2,4-dioxo-1-(5-pirimidinilmetil)-3-[3-(trifluorometil)fenil]-2H-pirido[1,2-α]pirimidinio), triflumurona, delta-endotoxinas de *Bacillus thuringiensis*, bacterias entomopatógenas, virus entomopatógenos y hongos entomopatógenos.

Son dignos de mención los insecticidas tales como abamectina, acetamiprid, acrinatrina, afidopiropeno, amitraz, avermectina, azadiractina, benfuracarb, bensultap, bifentrina, buprofezina, cadusafos, carbarilo, cartap, clorantraniliprol, clorfenapir, clorpirifos, clotianidina, ciantraniliprol, ciclaniliprol, cicloprotrina, ciflutrina, beta-ciflutrina,

5 cihalotrina, gamma-cihalotrina, lambda-cihalotrina, cipermetrina, alfa-cipermetrina, zeta-cipermetrina, ciromazina, deltametrina, dieldrina, dinotefurano, diofenolano, emamectina, endosulfano, esfenvalerato, etiprol, etofenprox, etoxazol, fenitrotiona, fenotiocarb, fenoxicarb, fenvalerato, fipronilo, flometoquina, flonicamid, flubendiamida, flufenoxurona, flufenoxiestrobina, fluensulfona, flupiprol, flupiradifurona, fluvalinato, formetanato, fostiazato, heptaflutrina, hexaflumurona, hidrametilnona, imidacloprid, indoxacarb, lufenurona, meperflutrina, metaflumizona, metiodicarb, metomilo, metopreno, metoxifeno, metoflutrina, monofluorotrina, nitenpiram, nitiazina, novalurona, oxamilo, piflubumida, pimetozina, piretrina, piridabeno, piridalilo, piriminostrobina, piriproxifeno, rianodina, espinetoram, espinosad, espiroclifeno, espiromesifeno, espirotetramat, sulfoxaflor, tebufenozida, tetrametrina, tetrametilflutrina, tiacloprid, tiametoxam, tiodicarb, tiosultap-sodio, tralometrina, triazamato, triflumezopirim, triflumurona, delta-endotoxinas de *Bacillus thuringiensis*, todas las cepas de *Bacillus thuringiensis* y todas las cepas de virus de nucleopolihedrosis.

15 Una realización de agentes biológicos para mezclar con compuestos de esta invención incluyen bacterias entomopatógenas tal como *Bacillus thuringiensis*, y las delta-endotoxinas encapsuladas de *Bacillus thuringiensis* tal como bioinsecticidas MVP® y MVPII® preparados mediante el proceso CellCap® (CellCap®, MVP® y MVPII® son marcas registradas de Mycogen Corporation, Indianápolis, Indiana, EE.UU.); hongos entomopatógenos tales como hongo de muscardina verde; y virus entomopatógenos (que se dan tanto de forma natural como genéticamente modificados) que incluyen baculovirus, nucleopolihedrovirus (NPV) tales como nucleopolihedrovirus *Helicoverpa zea* (HzNPV), nucleopolihedrovirus *Anagrapha falcifera* (AfNPV); y virus de granulosis (GV) tal como virus de la granulosis *Cydia pomonella* (CpGV).

20 Es digna de mención particular una combinación tal donde el otro ingrediente activo de control de plagas de invertebrados pertenece a una clase química diferente o tiene un diferente sitio de acción que el compuesto de Fórmula 1. En ciertos ejemplos, una combinación con al menos un ingrediente activo del control de plagas de invertebrados diferente que tiene un espectro similar de control pero un diferente sitio de acción será particularmente ventajoso para la gestión de la resistencia. Por consiguiente, una composición de la presente invención puede comprender además una cantidad biológicamente efectiva de al menos un ingrediente activo de control de plagas de invertebrados adicional que tiene un espectro similar de control pero que pertenece a una clase química diferente o que tiene un diferente sitio de acción. Estos compuestos o agentes biológicamente activos adicionales incluyen, aunque no están limitados a, inhibidores de acetilcolinesterasa (AChE) tal como los carbamatos de metomilo, oxamilo, tiodicarb, triazamato, y los organofosfatos clorpirifos; antagonistas del canal cloruro regulado por GABA tal como los ciclodienos dieldrina y endosulfano, y los fenilpirazoles etiprol y fipronilo; moduladores del canal sodio tal como los piretroides bifentrina, ciflutrina, beta-ciflutrina, cihalotrina, lambda-cihalotrina, cipermetrina, deltametrina, dimeflutrina, esfenvalerato, metoflutrina y proflutrina; agonistas del acetilcolin receptor nicotínico (nAChR) tal como los neonicotinoides acetamiprid, clotianidina, dinotefurano, imidacloprid, nitenpiram, nitiazina, tiacloprid y tiametoxam y sulfoxaflor; activadores alostéricos del receptor de acetilcolina nicotínico (nAChR) tal como las espinosinas espinetoram y espinosad; activadores del canal cloruro tales como las avermectinas abamectina y emamectina; miméticos de hormona juvenil tal como diofenolano, metopreno, fenoxicarb y piriproxifeno; bloqueantes de alimentación de homoptero selectivos tal como pimetozina y flonicamid; inhibidores del crecimiento de ácaros tal como etoxazol; inhibidores de ATP sintasa mitocondrial tal como propargita; desacopladores de fosforilación oxidativa por medio de la interrupción del gradiente de protones tal como clorfenapir; bloqueantes del canal del receptor de acetilcolina nicotínico (nAChR) tal como los análogos de nereistoxina cartap; inhibidores de biosíntesis de quitina tal como las benzoilureas flufenoxurona, hexaflumurona, lufenurona, novalurona, noviflumurona y triflumurona y buprofezina; disruptores de la muda de dípteros tal como ciromazina; agonistas del receptor de ecdisona tal como las diacilhidrazinas metoxifeno, tebufenozida; agonistas del receptor de octopamina tal como amitraz; inhibidores del transporte de electrones del complejo mitocondrial III tal como hidrametilnona; inhibidores del transporte electrónico del complejo mitocondrial I tal como piridabeno; bloqueantes del canal sodio dependiente del voltaje tal como indoxacarb; inhibidores de acetil CoA carboxilasa tal como los ácidos tetrónicos y tetrámico espiroclifeno, espiromesifeno y espirotetramat; inhibidores del transporte electrónico del complejo mitocondrial II tal como las beta-cetonitrilos, cienopirafeno y ciflumetofeno; moduladores del receptor de rianidina tal como las diamidas antranílicas clorantraniliprol, ciantraniliprol y ciantraniliprol, diamidas tal como flubendiamida, y ligandos del receptor de rianodina tal como rianodina; compuestos en los que el sitio diana responsable de la actividad biológica es desconocido o no caracterizado tal como azadiractina, bifenazato, piridalilo, pirifluquinazona y triflumezopirim; disruptores microbianos de membranas del estómago medio del insecto tal como *Bacillus thuringiensis* y las delta-endotoxinas que producen y *Bacillus sphaericus*; y agentes biológicos que incluyen nucleopolihedrovirus (NPV) y otros virus insecticidas que se dan de forma natural o modificados genéticamente.

55 Más ejemplos de compuestos o agentes biológicamente activos con los que los compuestos de esta invención pueden formularse son: fungicidas tal como acibenzolar-S-metilo, aldimofo, ametocradina, amisulbrom, anilazina, azaconazol, azoxistrobina, benalaxilo (que incluye benalaxilo-M), benodanila, benomilo, bentiavalicarb (que incluyen bentiavalicarb-isopropilo), benzovindiflupir, betoxazina, binapacril, bifenilo, bitertanol, bixafeno, blastidina-S, boscalid, bromuconazol, bupirimato, butiobato, carboxina, carpropamid, captafol, captano, carbendazim, cloroneb, clorotalonilo, clozolinato, hidróxido de cobre, oxiclورو de cobre, sulfato de cobre, coumoxistrobina, ciazofamid, ciflufenamid, cimoxanilo, ciproconazol, ciprodinilo, diclofluanid, diclocimet, diclomezina, diclorano, dietofencarb, difenoconazol, diflumetorim, dimetirimol, dimetomorfo, dimoxistrobina, diniconazol (que incluye diniconazol-M), dinocap, ditianona, ditiolanos, dodemorfo, dodina, econazol, etaconazol, edifenfos, enoxastrobina (también conocido

como enestroburina), epoxiconazol, etaboxam, etirimol, etridiazol, famoxadona, fenamidona, fenaminestrobina, fenarimol, fenbuconazol, fenfuram, fenhexamida, fenoxanilo, fempiclonilo, fenpropidina, fenpropimorfo, fempirazamina, acetato de fentina, hidróxido de fentina, ferbam, ferimzona, flometoquina, fluazinam, fludioxonilo, flufenxiestrobina, flumorfo, fluopicolida, fluopiram, fluoxastrobina, fluquinconazol, flusilazol, flusulfamida, flutianilo, flutolanilo, flutriafol, fluxapiroxad, folpet, ftalida (también conocida como ftalida), fuberidazol, furalaxilo, furametpir, hexaconazol, himexazol, guazatina, imazalilo, imibenconazol, albesilato de iminoctadina, triacetato de iminoctadina, iodicarb, ipconazol, isofetamid, iprobenfos, iprodiona, iprovalicarb, isoprotiolano, isopirazam, isotianilo, kasugamicina, cresoxim-metilo, mancozeb, mandipropamid, mandestrobina, maneb, mapanipirina, mepromilo, meptildinocap, metalaxilo (que incluye metalaxilo-M/mefenoxam), metconazol, metasulfocarb, metiram, metominostrobina, metrafenona, miclobutanilo, naftitina, neo-asozina (metanoarsonato férrico), nuarimol, octilinona, ofurace, orisastrobina, oxadixilo, oxatiapiprolina, ácido oxolínico, oxpoconazol, oxicarboxina, oxitetraciclina, penconazol, pencicurona, penflufeno, pentiopirad, perfurazoato, ácido fosforoso (que incluye sales del mismo, p.ej., fosetil-aluminio), picoxistrobina, piperalina, polioxina, probenazol, procloraz, procimidona, propamocarb, propiconazol, propineb, proquinazid, protiocarb, proticoconazol, piraclostrobina, pirametostrobina, piraoxistrobina, piribenzol, piribencarb, piributacarb, pirifenox, piriofenona, perisoxazol, pirimetanilo, pirifenox, pirrolnitrina, piroquilona, quinconazol, quinmetionato, quinoxifeno, quintoceno, siltiofam, sedaxano, simeconazol, espiroxamina, estreptomycin, azufre, tebuconazol, tebufloquina, tecloftalam, tecnaceno, terbinafina, tetraconazol, tiabendazol, tifulzamida, tiofanato, tiofanato-metilo, tiram, tiadinilo, tolclofos-metilo, tolprocarb, tolfluanida, triadimefona, triadimenol, triarimol, triazóxido, sulfato de cobre tribásico, triclopiricarb, tridemorfo, trifloxistrobina, triflumizol, trimoframida triciclazol, trifloxistrobina, triforina, triticonazol, uniconazol, validamicina, valifenalato (también conocido como valifenal), vinclozolina, zineb, ziram, zoxamida y 1-[4-[4-[5-(2,6-difluorofenil)-4,5-dihidro-3-isoxazolil]-2-tiazolil]-1-piperidinil]-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-1-il]etanona; nematocidas tales como fluopiram, espirotetramat, tiodicarb, fostiazato, abamectina, iprodiona, fluensulfona, disulfuro de dimetilo, tioxazafeno, 1,3-dicloropropano (1,3-D), metam (de sodio y potasio), dazomet, cloropicrina, fenamifos, etoprofos, cadusafos, terbufos, imiciafos, oxamilo, carbofurano, tioxazafeno, *Bacillus firmus* y *Pasteuria nishizawae*; bactericidas tales como estreptomycin; acaricidas tales como amitraz, quinometionat, clorobenzilato, cihexatina, dicofol, dienoclor, etoxazol, fenazaquina, óxido de fenbutatina, fenpropatrina, fenpiroximato, hexitiazox, propargita, piridabeno y tebufenpirad.

En ciertos ejemplos, las combinaciones de un compuesto de esta invención con otros compuestos o agentes biológicamente activos (particularmente control de plagas de invertebrados) (es decir ingredientes activos) pueden dar por resultado un efecto más que aditivo (es decir, sinérgico). Reducir la cantidad de ingredientes activos liberados en el medioambiente mientras se asegura el control de plagas efectivo siempre es deseable. Cuando el sinergismo de los ingredientes activos del control de plagas de invertebrados se da a tasas de aplicación que dan niveles agrónomicamente satisfactorios de control de plagas de invertebrados, dichas combinaciones pueden ser ventajosas para reducir el coste de la producción del cultivo y disminuir la carga medioambiental.

Los compuestos de esta invención y composiciones de los mismos pueden aplicarse a plantas genéticamente transformadas para expresar proteínas tóxicas para las plagas de invertebrados (tal como delta-endotoxinas de *Bacillus thuringiensis*). Dicha aplicación puede proporcionar un espectro más amplio de protección de plantas y ser ventajosa para la gestión de la resistencia. El efecto de los compuestos de control de plagas de invertebrados aplicados de forma exógena de esta invención puede ser sinérgico con las proteínas de toxina expresadas.

Las referencias generales para estos protectores agrícolas (es decir, insecticidas, fungicidas, nematocidas, acaricidas, herbicidas y agentes biológicos) incluyen The Pesticide Manual, 13ª Edición, C.D.S. Tomlin, Ed., Consejo inglés para la protección de cultivos, Farnham, Surrey, R.U., 2003 y The BioPesticide Manual, 2ª Edición, L.G. Copping, Ed., Consejo inglés para la protección de cultivos, Farnham, Surrey, R.U., 2001.

Para las realizaciones donde se usan uno o más de estos diversos compañeros de mezcla, la relación en peso de estos diversos compañeros de mezcla (en total) al compuesto de Fórmula 1 está típicamente entre aproximadamente 1:3000 y aproximadamente 3000:1. Son dignas de mención las relaciones entre aproximadamente 1:300 y aproximadamente 300:1 (por ejemplo relaciones entre aproximadamente 1:30 y aproximadamente 30:1). Un experto en la técnica puede determinar fácilmente a través de la simple experimentación las cantidades biológicamente efectivas de ingredientes activos necesarios para el espectro deseado de actividad biológica. Será evidente que incluir estos componentes adicionales puede expandir el espectro de plagas de invertebrados controlados más allá del espectro controlado por el compuesto de Fórmula 1 solo.

La Tabla A enumera las combinaciones específicas de un compuesto de Fórmula 1 con otros agentes de control de plagas de invertebrados ilustrativos de las mezclas, composiciones y métodos de la presente invención. La primera columna de la Tabla A enumera los agentes de control de plagas de invertebrados específicos (p.ej., "Abamectina" en la primera línea). La segunda columna de la Tabla A enumera el modo de acción (si se sabe) o la clase química de los agentes de control de plagas de invertebrados. La tercera columna de la Tabla A enumera realización(ones) de intervalos de relaciones en peso para tasas a las que el agente de control de las plagas de invertebrados pueden aplicarse respecto a un compuesto de Fórmula 1 (p.ej., "50:1 a 1:50" de abamectina respecto a un compuesto de Fórmula 1 en peso). Por consiguiente, por ejemplo, la primera línea de la Tabla A describe específicamente la combinación de un compuesto de Fórmula 1 con abamectina puede aplicarse en una relación en peso entre 50:1 a 1:50. Las líneas restantes de la Tabla A se van a construir de forma similar. Digno más de mención la Tabla A enumera combinaciones específicas de un compuesto de Fórmula 1 con otros agentes de control de plagas de

ES 2 707 398 T3

invertebrados ilustrativos de las mezclas, composiciones y métodos de la presente invención e incluye realizaciones adicionales de intervalos de relación en peso para velocidades de aplicación.

Tabla A

Agente de control de plagas de invertebrados	Modo de acción o clase química	Relación en peso típica
Abamectina	Activador del canal cloruro	50:1 a 1:50
Acetamiprid	Agonista de acetilcolinareceptor nicotínico (nAChR)	150:1 a 1:200
Amitraz	Agonistas del receptor de octopamina	200:1 a 1:100
Avermectina	Lactonas macrocíclicas	50:1 a 1:50
Azadiractina	Sitio de acción desconocido	100:1 a 1:120
Beta-ciflutrina	Moduladores del canal sodio	150:1 a 1:200
Bifentrina	Moduladores del canal sodio	100:1 a 1:10
Buprofezina	Inhibidores de biosíntesis de quitina	500:1 a 1:50
Cartap	Bloqueante del canal del receptor de acetilcolina nicotínico (nAChR)	100:1 a 1:200
Clorantraniliprol	Modulador del receptor de rianodina	100:1 a 1:120
Clorfenapir	Desacopladores de la fosforilación oxidativa	300:1 a 1:200
Clorpirifos	Inhibidor de acetilcolinesterasa	500:1 a 1:200
Clotianidina	Agonista de receptor de acetilcolina nicotínica (nAChR)	100:1 a 1:400
Ciantraniliprol	Modulador del receptor de rianodina	100:1 a 1:120
Ciflutrina	Modulador del canal sodio	150:1 a 1:200
Cihalotrina	Modulador del canal sodio	150:1 a 1:200
Cipermetrina	Modulador del canal sodio	150:1 a 1:200
Ciromazina	Disruptor de la muda de dípteros	400:1 a 1:50
Deltametrina	Moduladores del canal sodio	50:1 a 1:400
Dieldrina	Antagonistas del canal cloruro regulado por GABA	200:1 a 1:100
Dinotefurano	Agonista del receptor de acetilcolina nicotínico (nAChR)	150:1 a 1:200
Diofenolano	Mimético de la hormona juvenil	150:1 a 1:200
Emamectina	Activador del canal cloruro	50:1 a 1:10
Endosulfano	Antagonista del canal cloruro regulado por GABA	200:1 a 1:100
Esfenvalerato	Modulador del canal sodio	100:1 a 1:400
Etiprol	Antagonista del canal cloruro regulado por GABA	200:1 a 1:100
Fenotiocarb		150:1 a 1:200

ES 2 707 398 T3

Agente de control de plagas de invertebrados	Modo de acción o clase química	Relación en peso típica
Fenoxicarb	Miméticos de la hormona juvenil	500:1 a 1:100
Fenvalerato	Modulador del canal sodio	150:1 a 1:200
Fipronilo	Antagonista del canal cloruro regulado por GABA	150:1 a 1:100
Flonicamid	Bloqueante de alimentación del homoptero selectivo	200:1 a 1:100
Flubendiamida	Modulador del receptor de rianodina	100:1 a 1:120
Flufenoxurona	Inhibidor de la biosíntesis de quitina	200:1 a 1:100
Hexaflumurona	Inhibidor de la biosíntesis de quitina	300:1 a 1:50
Hidrametilnona	Inhibidores del transporte electrónico del complejo mitocondrial III	150:1 a 1:250
Imidacloprid	Agonista del receptor de acetilcolina nicotínica (nAChR)	1000:1 a 1:1000
Indoxacarb	Bloqueante del canal sodio dependiente del voltaje	200:1 a 1:50
Lambda-cihalotrina	Modulador del canal sodio	50:1 a 1:250
Lufenurona	Inhibidor de la biosíntesis de quitina	500:1 a 1:250
Metaflumizona	Bloqueante del canal sodio dependiente del voltaje	200:1 a 1:200
Metomilo	Inhibidor de acetilcolinesterasa	500:1 a 1:100
Metopreno	Mimético de la hormona juvenil	500:1 a 1:100
Metoxifenozida	Agonista del receptor de ecdisona	50:1 a 1:50
Nitenpiram	Agonista del receptor de acetilcolina nicotínico (nAChR)	150:1 a 1:200
Nitiazina	Agonista del receptor de acetilcolina nicotínico (nAChR)	150:1 a 1:200
Novalurona	Inhibidor de la biosíntesis de quitina	500:1 a 1:150
Oxamilo	Inhibidores de acetilcolinesterasa	200:1 a 1:200
Pimetrozina	Bloqueante de la alimentación del hemoptero selectivo	200:1 a 1:100
Piretrina	Modulador del canal sodio	100:1 a 1:10
Piridabeno	Inhibidor del transporte electrónico del complejo mitocondrial I	200:1 a 1:100
Piridaililo	Sitio de acción desconocido	200:1 a 1:100
Piriproxifeno	Mimético de la hormona juvenil	500:1 a 1:100
Rianodina	Ligando receptor de la rianodina	100:1 a 1:120
Espinetoram	Activador alostérico del receptor de acetilcolina nicotínico (nAChR)	150:1 a 1:100
Espinosad	Activadores alostéricos del receptor	500:1 a 1:10

Agente de control de plagas de invertebrados	Modo de acción o clase química	Relación en peso típica
	de acetilcolina nicotínico (nAChR)	
Espirodiclofeno	Inhibidor de acetil CoA carboxilasa	200:1 a 1:200
Espiromesifeno	Inhibidor de acetil CoA carboxilasa	200:1 a 1:200
Tebufenozida	Agonista del receptor de ecdisona	500:1 a 1:250
Tiacloprid	Agonista del receptor de acetilcolina nicotínico (nAChR)	100:1 a 1:200
Tiametoxam	Agonista del receptor de acetilcolina nicotínico (nAChR)	1250:1 a 1:1000
Tiodicarb	Inhibidores de acetilcolinesterasa	500:1 a 1:400
Tiosultap-sodio	Bloqueante del canal del receptor de acetilcolina nicotínico (nAChR)	150:1 a 1:100
Tralometrina	Modulador del canal sodio	150:1 a 1:200
Triazamato	Inhibidores de acetilcolinesterasa	250:1 a 1:100
Triflumezopirim		
Triflumurona	Inhibidor de la síntesis de quitina	200:1 a 1:100
<i>Bacillus thuringiensis</i>	Agentes biológicos	50:1 a 1:10
delta-endotoxinas de <i>Bacillus thuringiensis</i>	Agentes biológicos	50:1 a 1:10
NPV (p.ej., Gemstar)	Agentes biológicos	50:1 a 1:10

Es digna de mención la composición de la presente invención en la que un compuesto o agente biológicamente activo adicional se selecciona de los Agentes de control de plagas de invertebrados enumerados en la Tabla A anterior.

- 5 Las relaciones en peso de un compuesto, que incluyen un compuesto de Fórmula 1, un *N*-óxido o una sal del mismo, al agente de control de plagas de invertebrados adicional están típicamente entre 1000:1 y 1:1000, estando una realización entre 500:1 y 1:500, estando otra realización entre 250:1 y 1:200 y estando otra realización entre 100:1 y 1:50.

- 10 Están enumeradas a continuación en las Tablas B1 a B10 las realizaciones de composiciones específicas que comprenden un compuesto de Fórmula 1 (los números de compuesto se refieren a compuestos en las Tablas de índice A-N) y un agente de control de plagas de invertebrados adicional.

Tabla B1

Mezcla núm.	Comp. Núm.	y	Agente de control de plagas de invertebrados	Mezcla núm.	Comp. Núm.	y	Agente de control de plagas de invertebrados
B1-1	8	y	Abamectina	B1-38	8	y	Indoxacarb
B1-2	8	y	Acetamiprid	B1-39	8	y	Lambda-cihalotrina
B1-3	8	y	Amitraz	B1-40	8	y	Lufenurona
B1-4	8	y	Avermectina	B1-41	8	y	Metaflumizona
B1-5	8	y	Azadiractina	B1-42	8	y	Metomilo
B1-6	8	y	Bensultap	B1-43	8	y	Metopreno
B1-7	8	y	Beta-ciflutrina	B1-44	8	y	Metoxifenoazida
B1-8	8	y	Bifentrina	B1-45	8	y	Nitenpiram

Mezcla número.	Comp. Núm.	y	Agente de control de plagas de invertebrados	Mezcla número.	Comp. Núm.	y	Agente de control de plagas de invertebrados
B1-9	8	y	Buprofezina	B1-46	8	y	Nitiazina
B1-10	8	y	Cartap	B1-47	8	y	Novalurona
B1-11	8	y	Clorantraniliprol	B1-48	8	y	Oxamilo
B1-12	8	y	Clorfenapir	B1-49	8	y	Fosmet
B1-13	8	y	Clorpirifos	B1-50	8	y	Pimetrozina
B1-14	8	y	Clotianidina	B1-51	8	y	Piretrina
B1-15	8	y	Ciantraniliprol	B1-52	8	y	Piridabeno
B1-16	8	y	Ciflutrina	B1-53	8	y	Piridalilo
B1-17	8	y	Cihalotrina	B1-54	8	y	Piriproxifeno
B1-18	8	y	Cipermetrina	B1-55	8	y	Rianodina
B1-19	8	y	Ciromazina	B1-56	8	y	Espinetoram
B1-20	8	y	Deltametrina	B1-57	8	y	Espinosad
B1-21	8	y	Dieldrina	B1-58	8	y	Espirodiclofeno
B1-22	8	y	Dinotefurano	B1-59	8	y	Espiromesifeno
B1-23	8	y	Diofenolano	B1-60	8	y	Espirotetramat
B1-24	8	y	Emamectina	B1-61	8	y	Sulfoxaflor
B1-25	8	y	Endosulfano	B1-62	8	y	Tebufenozida
B1-26	8	y	Esfenvalerato	B1-63	8	y	Teflutrina
B1-27	8	y	Etiprol	B1-64	8	y	Tiaclopid
B1-28	8	y	Fenotiocarb	B1-65	8	y	Tiametoxam
B1-29	8	y	Fenoxicarb	B1-66	8	y	Tiodicarb
B1-30	8	y	Fenvalerato	B1-67	8	y	Tiosultap-sodio
B1-31	8	y	Fipronilo	B1-68	8	y	Tolfenpirad
B1-32	8	y	Fonicamid	B1-69	8	y	Tralometrina
B1-33	8	y	Flubendiamida	B1-70	8	y	Triazamato
B1-34	8	y	Flufenoxurona	B1-71	8	y	Triflumezopirim
B1-35	8	y	Hexaflumurona	B1-72	8	y	Triflumurona
B1-36	8	y	Hidrametilnona	B1-73	8	y	<i>Bacillus thuringiensis</i>
B1-37	8	y	Imidaclopid	B1-74	8	y	delta-endotoxinas de <i>Bacillus thuringiensis</i>
				B1-75	8	y	NPV (p.ej., Gemstar)

Tabla B2

La tabla B2 es idéntica a la Tabla B1, excepto que cada referencia al compuesto 8 en la columna encabezada "Comp. Núm." se sustituye por una referencia al compuesto 14. Por ejemplo, la primera mezcla en la Tabla B2 se designa B2-1 y es una mezcla de compuesto 14 y el agente de control de plagas de invertebrados adicional abamectina.

Tabla B3

5 La tabla B3 es idéntica a la Tabla B1, excepto que cada referencia al compuesto 8 en la columna encabezada "Comp. Núm." se sustituye por una referencia al compuesto 16. Por ejemplo, la primera mezcla en la Tabla B3 se designa B3-1 y es una mezcla del compuesto 16 y el agente de control de plagas de invertebrados adicional abamectina.

Tabla B4

10 La tabla B4 es idéntica a la Tabla B1, excepto que cada referencia al compuesto 8 en la columna encabezada "Comp. Núm." se sustituye por una referencia al compuesto 19. Por ejemplo, la primera mezcla en la Tabla B4 se designa B4-1 y es una mezcla del compuesto 19 y el agente de control de plagas de invertebrados adicional abamectina.

Tabla B5

15 La tabla B5 es idéntica a la Tabla B1, excepto que cada referencia al compuesto 8 en la columna encabezada "Comp. Núm." se sustituye por una referencia al compuesto 41. Por ejemplo, la primera mezcla en la Tabla B5 se designa B5-1 y es una mezcla de compuesto 41 y el agente de control de plagas de invertebrados adicional abamectina.

Tabla B6

20 La tabla B6 es idéntica a la Tabla B1, excepto que cada referencia al compuesto 8 en la columna encabezada "Comp. Núm." se sustituye por una referencia al compuesto 42. Por ejemplo, la primera mezcla en la Tabla B6 se designa B6-1 y es una mezcla de compuesto 42 y el agente de control de plagas de invertebrados adicional abamectina.

Tabla B8

25 La tabla B8 es idéntica a la Tabla B1, excepto que cada referencia al compuesto 8 en la columna encabezada "Comp. Núm." se sustituye por una referencia al compuesto 54. Por ejemplo, la primera mezcla en la Tabla B8 se designa B8-1 y es una mezcla de compuesto 54 y el agente de control de plagas de invertebrados adicional abamectina.

Tabla B9

30 La tabla B9 es idéntica a la Tabla B1, excepto que cada referencia al compuesto 8 en la columna encabezada "Comp. Núm." se sustituye por una referencia al compuesto 55. Por ejemplo, la primera mezcla en la Tabla B9 se designa B9-1 y es una mezcla del compuesto 55 y el agente de control de plagas de invertebrados adicional abamectina.

Tabla B10

35 La tabla B10 es idéntica a la Tabla B1, excepto que cada referencia al compuesto 8 en la columna encabezada "Comp. Núm." se sustituye por una referencia al compuesto 76. Por ejemplo, la primera mezcla en la Tabla B10 se designa B10-1 y es una mezcla del compuesto 76 y el agente de control de plagas de invertebrados adicional abamectina.

Las mezclas específicas enumeradas en las Tablas B1 a B10 combinan típicamente un compuesto de Fórmula 1 con el otro agente de plagas de invertebrados en las relaciones especificadas en la Tabla A.

40 Se enumeran a continuación en las Tablas C1 a C10 mezclas específicas que comprenden un compuesto de Fórmula 1 (los números de compuesto (Comp. Núm.) se refieren a compuestos en las Tablas de índice A-N) y un agente de control de plagas de invertebrados adicional. Las Tablas C1 a C10 enumeran además relaciones en peso específicas típicas de las mezclas de las Tablas C1 a C10. Por ejemplo, la primera entrada de relación en peso de la primera línea de la Tabla C1 describe específicamente la mezcla del Compuesto 8 de la Tabla de índice A con abamectina aplicada en una relación en peso de 100 partes de Compuesto 1 a 1 parte de abamectina.

Tabla C1

Mezcla núm.	Comp. Núm.	y	Agente de control de plagas de invertebrados	Relación de mezclas típicas (en peso)								
				100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-1	8	y	Abamectina	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-2	8	y	Acetamiprid	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-3	8	y	Amitraz	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-4	8	y	Avermectina	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-5	8	y	Azadiractina	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-6	8	y	Bensultap	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-7	8	y	Beta-ciflutrina	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-8	8	y	Bifentrina	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-9	8	y	Buprofezina	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-10	8	y	Cartap	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-11	8	y	Clorantraniliprol	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-12	8	y	Clorfenapir	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-13	8	y	Clorpirifos	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-14	8	y	Clotianidina	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-15	8	y	Ciantraniliprol	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-16	8	y	Ciflutrina	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-17	8	y	Cihalotrina	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-18	8	y	Cipermetrina	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-19	8	y	Ciromazina	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-20	8	y	Deltametrina	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-21	8	y	Dieldrina	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-22	8	y	Dinotefurano	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-23	8	y	Diofenolano	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-24	8	y	Emamectina	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-25	8	y	Endosulfano	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-26	8	y	Esfenvalerato	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-27	8	y	Etiprol	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-28	8	y	Fenotiocarb	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-29	8	y	Fenoxicarb	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-30	8	y	Fenvalerato	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-31	8	y	Fipronilo	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-32	8	y	Flonicamid	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-33	8	y	Flubendiamida	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-34	8	y	Flufenoxurona	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100

ES 2 707 398 T3

Mezcla número.	Comp. Núm.	y	Agente de control de plagas de invertebrados	Relación de mezclas típicas (en peso)								
				100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-35	8	y	Hexaflumurona	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-36	8	y	Hidrametilnona	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-37	8	y	Imidacloprid	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-38	8	y	Indoxacarb	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-39	8	y	Lambda-cihalotrina	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-40	8	y	Lufenurona	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-41	8	y	Metaflumizona	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-42	8	y	Metomilo	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-43	8	y	Metopreno	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-44	8	y	Metoxifeno	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-45	8	y	Nitenpiram	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-46	8	y	Nitiazina	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-47	8	y	Novalurona	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-48	8	y	Oxamilo	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-49	8	y	Fosmet	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-50	8	y	Pimetrozina	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-51	8	y	Piretrina	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-52	8	y	Piridabeno	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-53	8	y	Piridaliilo	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-54	8	y	Piriproxifeno	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-55	8	y	Rianodina	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-56	8	y	Espinetoram	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-57	8	y	Espinosad	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-58	8	y	Espirodiclofeno	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-59	8	y	Espiromesifeno	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-60	8	y	Espirotetramat	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-61	8	y	Sulfoxaflor	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-62	8	y	Tebufenozida	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-63	8	y	Teflutrina	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-64	8	y	Tiacloprid	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-65	8	y	Tiametoxam	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-66	8	y	Tiodicarb	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-67	8	y	Tiosultap-sodio	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-68	8	y	Tolfenpirad	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-69	8	y	Tralometrino	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100

Mezcla núm.	Comp. Núm.	y	Agente de control de plagas de invertebrados	Relación de mezclas típicas (en peso)								
				100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-70	8	y	Triazamato	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-71	8	y	Triflumezopirim	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-72	8	y	Triflumurona	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-73	8	y	<i>Bacillus thuringiensis</i>	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-74	8	y	delta-endotoxinas de <i>Bacillus thuringiensis</i>	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100
C1-75	8	y	NPV (p.ej., Gemstar)	100:1	10:1	5:1	2:1	1:1	1:2	1:5	1:10	1:100

Tabla C2

La tabla C2 es idéntica a la Tabla C1, excepto que cada referencia al compuesto 8 en la columna encabezada "Comp. Núm." se sustituye por una referencia al compuesto 14. Por ejemplo, la primera entrada de relación en peso de la primera línea de la Tabla C2 describe específicamente la mezcla del Compuesto 14 con abamectina aplicada en una relación en peso de 100 partes de Compuesto 1 a 1 parte de abamectina.

Tabla C3

La tabla C3 es idéntica a la Tabla C1, excepto que cada referencia al compuesto 8 en la columna encabezada "Comp. Núm." se sustituye por una referencia al compuesto 16. Por ejemplo, la primera entrada de relación en peso de la primera línea de la Tabla C3 describe específicamente la mezcla del Compuesto 16 con abamectina aplicada en una relación en peso de 100 partes de Compuesto 1 a 1 parte de abamectina.

Tabla C4

La tabla C4 es idéntica a la Tabla C1, excepto que cada referencia al compuesto 8 en la columna encabezada "Comp. Núm." se sustituye por una referencia al compuesto 19. Por ejemplo, la primera entrada de relación en peso de la primera línea de la Tabla C4 describe específicamente la mezcla del Compuesto 19 con abamectina aplicada en una relación en peso de 100 partes de Compuesto 1 a 1 parte de abamectina.

Tabla C5

La tabla C5 es idéntica a la Tabla C1, excepto que cada referencia al compuesto 8 en la columna encabezada "Comp. Núm." se sustituye por una referencia al compuesto 41. Por ejemplo, la primera entrada de relación en peso de la primera línea de la Tabla C5 describe específicamente la mezcla del Compuesto 41 con abamectina aplicada en una relación en peso de 100 partes de Compuesto 1 a 1 parte de abamectina.

Tabla C6

La tabla C6 es idéntica a la Tabla C1, excepto que cada referencia al compuesto 8 en la columna encabezada "Comp. Núm." se sustituye por una referencia al compuesto 42. Por ejemplo, la primera entrada de relación en peso de la primera línea de la Tabla C6 describe específicamente la mezcla del Compuesto 42 con abamectina aplicada en una relación en peso de 100 partes de Compuesto 1 a 1 parte de abamectina.

Tabla C8

La tabla C8 es idéntica a la Tabla C1, excepto que cada referencia al compuesto 8 en la columna encabezada "Comp. Núm." se sustituye por una referencia al compuesto 54. Por ejemplo, la primera entrada de relación en peso de la primera línea de la Tabla C8 describe específicamente la mezcla del Compuesto 54 con abamectina aplicada en una relación en peso de 100 partes de Compuesto 1 a 1 parte de abamectina.

Tabla C9

La tabla C9 es idéntica a la Tabla C1, excepto que cada referencia al compuesto 8 en la columna encabezada "Comp. Núm." se sustituye por una referencia al compuesto 55. Por ejemplo, la primera entrada de relación en peso de la primera línea de la Tabla C9 describe específicamente la mezcla del Compuesto 55 con abamectina aplicada en una relación en peso de 100 partes de Compuesto 1 a 1 parte de abamectina.

Tabla C10

La tabla C10 es idéntica a la Tabla C1, excepto que cada referencia al compuesto 8 en la columna encabezada "Comp. Núm." se sustituye por una referencia al compuesto 76. Por ejemplo, la primera entrada de relación en peso

de la primera línea de la Tabla C10 describe específicamente la mezcla del Compuesto 76 con abamectina aplicada en una relación en peso de 100 partes de Compuesto 1 a 1 parte de abamectina.

Se enumeran a continuación en las Tablas D1 a D10 las realizaciones de composiciones específicas que comprenden un compuesto de Fórmula 1 (los números de compuesto (Comp. Núm.) se refieren a compuestos en las Tablas de índice A-N) y un fungicida adicional.

5

Tabla D1

Mezcla núm.	Comp. Núm.	y	Fungicida	Mezcla núm.	Comp. Núm.	y	fungicida
D1-1	8	y	Probenazol	D1-17	8	y	Difenoconazol
D1-2	8	y	Tiadinilo	D1-18	8	y	Ciproconazol
D1-3	8	y	Isotianilo	D1-19	8	y	Propiconazol
D1-4	8	y	Piroquilona	D1-20	8	y	Fenoxanilo
D1-5	8	y	Metominostrobin	D1-21	8	y	Ferimizona
D1-6	8	y	Flutolanilo	D1-22	8	y	Ftalida
D1-7	8	y	Validamicina	D1-23	8	y	Kasugamicina
D1-8	8	y	Furametpir	D1-24	8	y	Picoxistrobina
D1-9	8	y	Pencicurona	D1-25	8	y	Penthiopirad
D1-10	8	y	Simeconazol	D1-26	8	y	Famoxadona
D1-11	8	y	Orisastrobina	D1-27	8	y	Cimoxanilo
D1-12	8	y	Trifloxistrobina	D1-28	8	y	Proquinazid
D1-13	8	y	Isoprothiolano	D1-29	8	y	Flusilazol
D1-14	8	y	Azoxistrobina	D1-30	8	y	Mancozeb
D1-15	8	y	Triciclazol	D1-31	8	y	Hidróxido de cobre
D1-16	8	y	Hexaconazol	D1-32	8	y	(a)
(a) 1-[4-[4-[5-(2,6-difluorofenil)-4,5-dihidro-3-isoxazolil]-2-tiazolil]-1-piperidmil]-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il] etanona							

Tabla D2

La Tabla D2 es idéntica a la Tabla D1, excepto que cada referencia al compuesto 8 en la columna encabezada "Comp. Núm." se sustituye por una referencia al compuesto 14. Por ejemplo, la primera mezcla en la Tabla D2 se designa D2-1 y es una mezcla del compuesto 14 y el fungicida adicional probenazol.

10

Tabla D3

La Tabla D3 es idéntica a la Tabla D1, excepto que cada referencia al compuesto 8 en la columna encabezada "Comp. Núm." se sustituye por una referencia al compuesto 16. Por ejemplo, la primera mezcla en la Tabla D3 se designa D3-1 y es una mezcla del compuesto 16 y el fungicida adicional probenazol.

15

Tabla D4

La Tabla D4 es idéntica a la Tabla D1, excepto que cada referencia al compuesto 8 en la columna encabezada "Comp. Núm." se sustituye por una referencia al compuesto 19. Por ejemplo, la primera mezcla en la Tabla D4 se designa D4-1 y es una mezcla del compuesto 19 y el fungicida adicional probenazol.

Tabla D5

20

La Tabla D5 es idéntica a la Tabla D1, excepto que cada referencia al compuesto 8 en la columna encabezada "Comp. Núm." se sustituye por una referencia al compuesto 41. Por ejemplo, la primera mezcla en la Tabla D5 se designa D5-1 y es una mezcla del compuesto 41 y el fungicida adicional probenazol.

Tabla D6

La Tabla D6 es idéntica a la Tabla D1, excepto que cada referencia al compuesto 8 en la columna encabezada "Comp. Núm." se sustituye por una referencia al compuesto 42. Por ejemplo, la primera mezcla en la Tabla D6 se designa D6-1 y es una mezcla del compuesto 42 y el fungicida adicional probenazol.

5 Tabla D8

La Tabla D8 es idéntica a la Tabla D1, excepto que cada referencia al compuesto 8 en la columna encabezada "Comp. Núm." se sustituye por una referencia al compuesto 54. Por ejemplo, la primera mezcla en la Tabla D8 se designa D8-1 y es una mezcla de compuesto 54 y el fungicida adicional probenazol.

Tabla D9

10 La Tabla D9 es idéntica a la Tabla D1, excepto que cada referencia al compuesto 8 en la columna encabezada "Comp. Núm." se sustituye por una referencia al compuesto 55. Por ejemplo, la primera mezcla en la Tabla D9 se designa D9-1 y es una mezcla del compuesto 55 y el fungicida adicional probenazol.

Tabla D10

15 La Tabla D10 es idéntica a la Tabla D1, excepto que cada referencia al compuesto 8 en la columna encabezada "Comp. Núm." se sustituye por una referencia al compuesto 76. Por ejemplo, la primera mezcla en la Tabla D10 se designa D10-1 y es una mezcla del compuesto 76 y el fungicida adicional probenazol.

20 Las plagas de invertebrados se controlan en las aplicaciones agronómicas y no agronómicas aplicando uno o más compuestos de esta invención, típicamente en forma de una composición, en una cantidad biológicamente efectiva, al medio de las plagas, que incluyen la ubicación agronómica y/o no agronómica de la infestación, al área a proteger, o directamente en las plagas a controlar.

25 Por consiguiente la presente invención comprende un método para controlar una plaga de invertebrados en aplicaciones agronómicas y/o no agronómicas, que comprende poner en contacto la plaga de invertebrados o su medio con una cantidad biológicamente efectiva de uno o más de los compuestos de la invención, o con una composición que comprende al menos uno compuesto tal o una composición que comprende al menos un compuesto tal y una cantidad biológicamente efectiva de al menos un compuesto o agente biológicamente activo adicional. Ejemplos de composiciones adecuadas que comprenden un compuesto de la invención y una cantidad biológicamente efectiva de al menos un compuesto o agente biológicamente activo adicional incluyen composiciones granulares en las que el compuesto activo adicional está presente en el mismo gránulo como el compuesto de la invención o en gránulos separados de aquellos del compuesto de la invención.

30 Para conseguir el contacto con un compuesto o composición de la invención para proteger un cultivo extensivo de plagas de invertebrados, el compuesto o composición se aplica típicamente a la semilla del cultivo antes de plantarla, al follaje (p.ej., hojas, tallos, flores, frutos) de plantas cultivadas, o al suelo u otro medio de crecimiento antes o después de plantar el cultivo.

35 Una realización de un método de contacto es por pulverización. De forma alternativa, una composición granular que comprende un compuesto de la invención puede aplicarse al follaje de la planta o al suelo. Los compuestos de esta invención pueden también distribuirse de forma efectiva a través de la absorción de la planta poniendo en contacto la planta con una composición que comprende un compuesto de esta invención aplicado como un empapado en el suelo de una formulación líquida, una formulación granular al suelo, un tratamiento en una caja de cobertura o baño antiparasitario de los trasplantes. Es digna de mención una composición de la presente invención en forma de una formulación líquida que empapa el suelo. También es digno de mención un método para controlar una plaga de invertebrados que comprende poner en contacto la plaga de invertebrados o su medio con una cantidad biológicamente efectiva de un compuesto de la presente invención o con una composición que comprende una cantidad biológicamente efectiva de un compuesto de la presente invención. Digno de mención adicional es este método en el que el medio es el suelo y la composición se aplica al suelo como una formulación de empapado del suelo. Es digno de mención adicional que los compuestos de esta invención también son efectivos mediante la aplicación localizada en la ubicación de la infestación. Otros métodos de contacto incluyen la aplicación de un compuesto o una composición de la invención mediante pulverizados directos y residuales, pulverizados aéreos, geles, recubrimientos de semillas, microencapsulados, absorción sistémica, cebos, etiquetas de oreja, bolos, nebulizadores térmicos, fumigantes, aerosoles, polvos finos y muchos otros. Una realización de un método de contacto es un gránulo, barra o comprimido fertilizante dimensionalmente estable que comprende un compuesto o composición de la invención. Los compuestos de esta invención pueden también impregnarse en materiales para fabricar dispositivos de control de invertebrados (p.ej., redes de insectos).

50 Los compuestos de la invención son útiles en el tratamiento de plantas completas, partes de la planta y semillas. Las variedades y variedades cultivadas de plantas y semillas pueden obtenerse mediante propagación convencional y métodos de crianza o por métodos de ingeniería genética. Las plantas o semillas genéticamente modificadas (plantas o semillas transgénicas) son aquellas en que un gen heterólogo (transgén) se ha integrado de forma estable

en el genoma de la planta o semilla. Un transgén que se define por su posición particular en el genoma de la planta se denomina una transformación o suceso transgénico.

- 5 Las variedades de cultivo de plantas y semillas genéticamente modificadas que pueden tratarse según la invención incluyen aquellas que son resistentes frente a una o más tensiones bióticas (plagas tales como nematodos, insectos, ácaros, hongos, etc.) o tensiones abiótica (sequía, temperatura fría, salinidad del suelo, etc.), o las que contienen otras características deseables. Las plantas y semillas pueden modificarse genéticamente para mostrar características de, por ejemplo, tolerancia a herbicidas, resistencia a insectos, perfiles de aceite modificados o tolerancia a la sequía. Las plantas y semillas útiles modificadas genéticamente que contienen sucesos de transformación génica únicos o combinaciones de sucesos de transformación se enumeran en la Tabla Z.
- 10 Información adicional para las modificaciones genéticas enumeradas en la Tabla Z pueden obtenerse a partir de las siguientes bases de datos:

<http://www2.oecd.org/biotech/byidentifier.aspx>

<http://www.aphis.usda.gov>

<http://gmoinfo.jrc.ec.europa.eu>

- 15 Las siguientes abreviaturas se usan en la Tabla Z que sigue: tol. es tolerancia, res. es resistencia, SU es sulfonilurea, ALS es acetolactato sintasa, HPPD es 4-hidroxifenilpiruvato dioxigenasa, NA es No disponible?

Tabla Z

Cultivo	Nombre del suceso	Código del suceso	Característica(s)	Gen(es)
Alfalfa	J101	MON-00101-8	Tol. al glifosato	cp4 epsps (aroA:CP4)
Alfalfa	J163	MON-ØØ163-7	Tol. al glifosato	cp4 epsps (aroA:CP4)
Colza*	23-18-17 (Suceso 18)	CGN-89465-2	Aceite de ácido láurico alto	te
Colza*	23-198 (Suceso 23)	CGN-89465-2	Aceite de ácido láurico alto	te
Colza*	61061	DP-Ø61Ø61-7	Tol. al glifosato	gat4621
Colza*	73496	DP-Ø73496-4	Tol. al glifosato	gat4621
Colza*	GT200 (RT200)	MON-89249-2	Tol. al glifosato	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
Colza*	GT73 (RT73)	MON-ØØØ73-7	Tol. al glifosato	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
Colza*	HCN10 (Topas 19/2)	NA	Tol. al glufosinato	bar
Colza*	HCN28 (T45)	ACS-BNØØ8-2	Tol. al glufosinato	pat (syn)
Colza*	HCN92 (Topas 19/2)	ACS-BNØØ7-1	Tol. al glufosinato	bar
Colza*	MON88302	MON-883Ø2-9	Tol. al glifosato	cp4 epsps (aroA:CP4)
Colza*	MPS961	NA	Descomposición de fitato	phyA
Colza*	MPS962	NA	Descomposición de fitato	phyA
Colza*	MPS963	NA	Descomposición de fitato	phyA
Colza*	MPS964	NA	Descomposición de fitato	phyA
Colza*	MPS965	NA	Descomposición de	phyA

ES 2 707 398 T3

Cultivo	Nombre del suceso	Código del suceso	Característica(s)	Gen(es)
			fitato	
Colza*	MS1 (B91-4)	ACS-BNØØ4-7	Tol. al glufosinato	bar
Colza*	MS8	ACS-BNØØ5-8	Tol. al glufosinato	bar
Colza*	OXY-235	ACS-BNØ11-5	Tol. al oxinilo	bxn
Colza*	PHY14	NA	Tol. al glufosinato	bar
Colza*	PHY23	NA	Tol. al glufosinato	bar
Colza*	PHY35	NA	Tol. al glufosinato	bar
Colza*	PHY36	NA	Tol. al glufosinato	bar
Colza*	RF1 (B93-101)	ACS-BNØØ1-4	Tol. al glufosinato	bar
Colza*	RF2 (B94-2)	ACS-BNØØ2-5	Tol. al glufosinato	bar
Colza*	RF3	ACS-BNØØ3-6	Tol. al glufosinato	bar
Judía	EMBRAPA 5.1	EMB-PV051-1	Res. a la enfermedad	ac1 (sentido y antisentido)
Berenjena	EE-1		Res. a insectos	cryIAc
Clavel	11 (7442)	FLO-07442-4	Tol. a SU.; color de la flor modificado	surB; dfr; hfl (f3'5'h)
Clavel	11363 (1363A)	FLO-11363-1	Tol. a SU; color de la flor modificado	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)
Clavel	1226A (11226)	FLO-11226-8	Tol. a SU; color de la flor modificado	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)
Clavel	123.2.2 (40619)	FLO-4Ø619-7	Tol. a SU; color de la flor modificado	surB; dfr; hfl (f3'5'h)
Clavel	123.2.38 (40644)	FLO-4Ø644-4	Tol. a SU; color de la flor modificado	surB; dfr; hfl (f3'5'h)
Clavel	123.8.12	FLO-4Ø689-6	Tol. a SU; color de la flor modificado	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)
Clavel	123.8.8 (40685)	FLO-4Ø685-1	Tol. a SU; color de la flor modificado	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)
Clavel	1351A (11351)	FLO-11351-7	Tol. a SU; color de la flor modificado	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)
Clavel	1400A (11400)	FLO-114ØØ-2	Tol. a SU; color de la flor modificado	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)
Clavel	15	FLO-ØØØ15-2	Tol. a SU; color de la flor modificado	surB; dfr; hfl (f3'5'h)
Clavel	16	FLO-ØØØ16-3	Tol. a SU; color de la flor modificado	surB; dfr; hfl (f3'5'h)
Clavel	4	FLO-ØØØØ4-9	Tol. a SU; color de la flor modificado	surB; dfr; hfl (f3'5'h)
Clavel	66	FLO-ØØØ66-8	Tol. a SU; senectud retrasada	surB; acc
Clavel	959A (11959)	FLO-11959-3	Tol. a SU; color de la flor modificado	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)

ES 2 707 398 T3

Cultivo	Nombre del suceso	Código del suceso	Característica(s)	Gen(es)
Clavel	988A (11988)	FLO-11988-7	Tol. a SU; color de la flor modificado	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)
Clavel	26407	IFD-26497-2	Tol. a SU; color de la flor modificado	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)
Clavel	25958	IFD-25958-3	Tol. a SU; color de la flor modificado	surB; dfr; bp40 (f3'5'h)
Achicoria	RM3-3	NA	Tol. al glufosinato	bar
Achicoria	RM3-4	NA	Tol. al glufosinato	bar
Achicoria	RM3-6	NA	Tol. al glufosinato	bar
Algodón	19-51a	DD-Ø1951A-7	Tol. al herbicida para ALS	S4-HrA
Algodón	281-24-236	DAS-24236-5	Tol. al glufosinato; res. a insectos	pat (syn); cry1F
Algodón	3006-210-23	DAS-21Ø23-5	Tol. al glufosinato; res. a insectos	pat (syn); cry1Ac
Algodón	31707	NA	Tol. al oxinilo; res. a insectos	bxn; cry1Ac
Algodón	31803	NA	Tol. al oxinilo; res. a insectos	bxn; cry1Ac
Algodón	31807	NA	Tol. al oxinilo; res. a insectos	bxn; cry1Ac
Algodón	31808	NA	Tol. al oxinilo; res. a insectos	bxn; cry1Ac
Algodón	42317	NA	Tol. al oxinilo; res. a insectos	bxn; cry1Ac
Algodón	BNLA-601	NA	Res. a insectos	cry1Ac
Algodón	BXN10211	BXN10211-9	Tol. al oxinilo	bxn; cry1Ac
Algodón	BXN10215	BXN10215-4	Tol. al oxinilo	bxn; cry1Ac
Algodón	BXN10222	BXN10222-2	Tol. al oxinilo	bxn; cry1Ac
Algodón	BXN10224	BXN10224-4	Tol. al oxinilo	bxn; cry1Ac
Algodón	COT102	SYN-IR102-7	Res. a insectos	vip3A(a)
Algodón	COT67B	SYN-IR67B-1	Res. a insectos	cry1Ab
Algodón	COT202		Res. a insectos	vip3A
Algodón	Suceso 1	NA	Res. a insectos	cry1Ac
Algodón	GMF Cry1A	GTL-GMF311-7	Res. a insectos	cry1Ab-Ac
Algodón	GHB119	BCS-GH005-8	Res. a insectos	cry2Ae
Algodón	GHB614	BCS-GH002-5	Tol. al glifosato	2mepsps
Algodón	GK12	NA	Res. a insectos	cry1Ab-Ac
Algodón	LLCotton25	ACS-GH001-3	Tol. al glufosinato	bar
Algodón	MLS 9124	NA	Res. a insectos	cry1C

ES 2 707 398 T3

Cultivo	Nombre del suceso	Código del suceso	Característica(s)	Gen(es)
Algodón	MON1076	MON-89924-2	Res. a insectos	cry1Ac
Algodón	MON1445	MON-01445-2	Tol. al glifosato	cp4 epsps (aroA:CP4)
Algodón	MON15985	MON-15985-7	Res. a insectos	cry1Ac; cry2Ab2
Algodón	MON1698	MON-89383-1	Tol. al glifosato	cp4 epsps (aroA:CP4)
Algodón	MON531	MON-00531-6	Res. a insectos	cry1Ac
Algodón	MON757	MON-00757-7	Res. a insectos	cry1Ac
Algodón	MON88913	MON-88913-8	Tol. al glifosato	cp4 epsps (aroA:CP4)
Algodón	Nqwe Chi 6 Bt	NA	Res. a insectos	NA?
Algodón	SKG321	NA	Res. a insectos	cry1A; CpTI
Algodón	T303-3	BCS-GH003-6	Res. a insectos; tol. al glufosinato	cry1Ab; bar
Algodón	T304-40	BCS-GH004-7	Res. a insectos; tol. al glufosinato	cry1Ab; bar
Algodón	CE43-67B		Res. a insectos	cry1Ab
Algodón	CE46-02A		Res. a insectos	cry1Ab
Algodón	CE44-69D		Res. a insectos	cry1Ab
Algodón	1143-14A		Res. a insectos	cry1Ab
Algodón	1143-51B		Res. a insectos	cry1Ab
Algodón	T342-142		Res. a insectos	cry1Ab
Algodón	PV-GHGT07 (1445)		Tol. al glifosato	cp4 epsps (aroA:CP4)
Algodón	EE-GH3		Tol. al glifosato	mepsps
Algodón	EE-GH5		Res. a insectos	cry1Ab
Algodón	MON88701	MON-88701-3	tol. al glufosinato y Dicamba	Dmo modificado; bar
Algodón	OsCr11		Anti-alérgico	Cry j modificado
Agrostis rastrera	ASR368	SMG-368ØØ-2	Tol. al glifosato	cp4 epsps (aroA:CP4)
Eucalipto	20-C		Tol. a la sal	codA
Eucalipto	12-5C		Tol. a la sal	codA
Eucalipto	12-5B		Tol. a la sal	codA
Eucalipto	107-1		Tol. a la sal	codA
Eucalipto	1/9/2001		Tol. a la sal	codA
Eucalipto	2/1/2001		Tol. a la sal	codA
Eucalipto			Tol. al frío	des9
Lino	FP967	CDC-FL001-2	Tol al herbicida para ALS	als
Lenteja	RH44		Tol. a imidazolinona	als
Maíz	3272	SYN-E3272-5	Alfa-amilasa modificada	amy797E

ES 2 707 398 T3

Cultivo	Nombre del suceso	Código del suceso	Característica(s)	Gen(es)
Maíz	5307	SYN-05307-1	Res. a insectos	ecry3.1Ab
Maíz	59122	DAS-59122-7	Res. a insectos; tol. al glufosinato	cry34Ab1; cry35Ab1; pat
Maíz	676	PH-000676-7	Tol. al glufosinato; control de polinización	pat; dam
Maíz	678	PH-000678-9	Tol. al glufosinato; control de polinización	pat; dam
Maíz	680	PH-000680-2	Tol. al glufosinato; control de polinización	pat; dam
Maíz	98140	DP-098140-6	Tol. al glifosato; Tol al herbicida para ALS	gat4621; zm-hra
Maíz	Bt10	NA	Res. a insectos; tol. al glufosinato	cry1Ab; pat
Maíz	Bt176 (176)	SYN-EV176-9	Res. a insectos; tol. al glufosinato	cry1Ab; bar
Maíz	BVLA430101	NA	Descomposición de fitato	phyA2
Maíz	CBH-351	ACS-ZM004-3	Res. a insectos; tol. al glufosinato	cry9C; bar
Maíz	DAS40278-9	DAS40278-9	Tol. a 2,4-D	aad-1
Maíz	DBT418	DKB-89614-9	Res. a insectos; tol. al glufosinato	cry1Ac; pinII; bar
Maíz	DLL25 (B16)	DKB-89790-5	Tol. al glufosinato	bar
Maíz	GA21	MON-00021-9	Tol. al glifosato	mepsps
Maíz	GG25		Tol. al glifosato	mepsps
Maíz	GJ11		Tol. al glifosato	mepsps
Maíz	F1117		Tol. al glifosato	mepsps
Maíz	GAT-ZM1		Tol. al glufosinato	pat
Maíz	LY038	REN-00038-3	Lisina aumentada	cordapA
Maíz	MIR162	SYN-IR162-4	Res. a insectos	vip3Aa20
Maíz	MIR604	SYN-IR604-5	Res. a insectos	mcry3A
Maíz	MON801 (MON80100)	MON801	Res. a insectos; tol. al glifosato	cry1Ab; cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
Maíz	MON802	MON-80200-7	Res. a insectos; tol. al glifosato	cry1Ab; cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
Maíz	MON809	PH-MON-809-2	Res. a insectos; tol. al glifosato	cry1Ab; cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
Maíz	MON810	MON-00810-6	Res. a insectos; tol. al glifosato	cry1Ab; cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
Maíz	MON832	NA	Tol. al glifosato	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
Maíz	MON863	MON-00863-5	Res. a insectos	cry3Bb1

ES 2 707 398 T3

Cultivo	Nombre del suceso	Código del suceso	Característica(s)	Gen(es)
Maíz	MON87427	MON-87427-7	Tol. al glifosato	cp4 epsps (aroA:CP4)
Maíz	MON87460	MON-87460-4	Tol. a la sequía	cspB
Maíz	MON88017	MON-88017-3	Res. a insectos; tol. al glifosato	cry3Bb1; cp4 epsps (aroA:CP4)
Maíz	MON89034	MON-89034-3	Res. a insectos	cry2Ab2; cry1A.105
Maíz	MS3	ACS-ZM001-9	Tol. al glufosinato; control de polinización	bar; barnasa
Maíz	MS6	ACS-ZM005-4	Tol. al glufosinato; control de polinización	bar; barnasa
Maíz	NK603	MON-00603-6	Tol. al glifosato	cp4 epsps (aroA:CP4)
Maíz	T14	ACS-ZM002-1	Tol. al glufosinato	pat (syn)
Maíz	T25	ACS-ZM003-2	Tol. al glufosinato	pat (syn)
Maíz	TC1507	DAS-01507-1	Res. a insectos; tol. al glufosinato	cry1Fa2; pat
Maíz	TC6275	DAS-06275-8	Res. a insectos; tol. al glufosinato	mocry1F; bar
Maíz	VIP1034		Res. a insectos; tol. al glufosinato	vip3A; pat
Maíz	43A47	DP-043A47-3	Res. a insectos; tol. al glufosinato	cry1F; cry34Ab1; cry35Ab1; pat
Maíz	40416	DP-040416-8	Res. a insectos; tol. al glufosinato	cry1F; cry34Ab1; cry35Ab1; pat
Maíz	32316	DP-032316-8	Res. a insectos; tol. al glufosinato	cry1F; cry34Ab1; cry35Ab1; pat
Maíz	4114	DP-004114-3	Res. a insectos; tol. al glufosinato	cry1F; cry34Ab1; cry35Ab1; pat
Melón	Melón A	NA	Maduración/senectud retrasada	sam-k
Melón	Melón B	NA	Maduración/senectud retrasada	sam-k
Papaya	55-1	CUH-CP551-8	Res. a la enfermedad	prsv cp
Papaya	63-1	CUH-CP631-7	Res. a la enfermedad	prsv cp
Papaya	Huanong Núm. 1	NA	Res. a la enfermedad	prsv rep
Papaya	X17-2	UFL-X17CP-6	Res. a la enfermedad	prsv cp
Petunia	Petunia-CHS	NA	Calidad de producto modificada	Supresión de CHS
Ciruela	C-5	ARS-PLMC5-6	Res. a la enfermedad	ppv cp
Colza**	ZSR500	NA	Tol. al glifosato	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
Colza**	ZSR502	NA	Tol. al glifosato	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
Colza**	ZSR503	NA	Tol. al glifosato	cp4 epsps (aroA:CP4);

ES 2 707 398 T3

Cultivo	Nombre del suceso	Código del suceso	Característica(s)	Gen(es)
Álamo	Bt Álamo	NA	Res. a insectos	goxv247 cry1Ac; API
Álamo	Clon de álamo híbrido 741	NA	Res. a insectos	cry1Ac; API
Álamo	trg300-1		Alta celulosa	AaXEG2
Álamo	trg300-2		Alta celulosa	AaXEG2
Patata	1210 amk	NA	Res. a insectos	cry3A
Patata	2904/1 kgs	NA	Res. a insectos	cry3A
Colza**	ZSR500	NA	Tol. al glifosato	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
Colza**	ZSR502	NA	Tol. al glifosato	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
Patata	ATBT04-27	NMK-89367-8	Res. a insectos	cry3A
Patata	ATBT04-30	NMK-89613-2	Res. a insectos	cry3A
Patata	ATBT04-31	NMK-89170-9	Res. a insectos	cry3A
Patata	ATBT04-36	NMK-89279-1	Res. a insectos	cry3A
Patata	ATBT04-6	NMK-89761-6	Res. a insectos	cry3A
Patata	BT06	NMK-89812-3	Res. a insectos	cry3A
Patata	BT10	NMK-89175-5	Res. a insectos	cry3A
Patata	BT12	NMK-89601-8	Res. a insectos	cry3A
Patata	BT16	NMK-89167-6	Res. a insectos	cry3A
Patata	BT17	NMK-89593-9	Res. a insectos	cry3A
Patata	BT18	NMK-89906-7	Res. a insectos	cry3A
Patata	BT23	NMK-89675-1	Res. a insectos	cry3A
Patata	EH92-527-1	BPS-25271-9	Almidón/carbohidratos modificados	gbss (antisentido)
Patata	HLMT15-15	NA	res. a la enfermedad e insectos	cry3A; pvy cp
Patata	HLMT15-3	NA	res. a la enfermedad e insectos	cry3A; pvy cp
Patata	HLMT15-46	NA	res. a la enfermedad e insectos	cry3A; pvy cp
Patata	RBMT15-101	NMK-89653-6	res. a la enfermedad e insectos	cry3A; pvy cp
Patata	RBMT21-129	NMK-89684-1	res. a la enfermedad e insectos	cry3A; plrv orf1; plrv orf2
Patata	RBMT21-152	NA	res. a la enfermedad e insectos	cry3A; plrv orf1; plrv orf2
Patata	RBMT21-350	NMK-89185-6	Res. a la enfermedad e insectos	cry3A; plrv orf1; plrv orf2
Patata	RBMT22-082	NMK-89896-6	res. a la enfermedad e	cry3A; plrv orf1; plrv orf2;

ES 2 707 398 T3

Cultivo	Nombre del suceso	Código del suceso	Característica(s)	Gen(es)
Patata	RBMT22-186	NA	insectos; Tol. al glifosato res. a la enfermedad e insectos; Tol. al glifosato	cp4 epsps (aroA:CP4) cry3A; plrv orf1; plrv orf2; cp4 epsps (aroA:CP4)
Patata	RBMT22-238	NA	Res. a la enfermedad e insectos; Tol. al glifosato	cry3A; plrv orf1; plrv orf2; cp4 epsps (aroA:CP4)
Patata	RBMT22-262	NA	Res. a la enfermedad e insectos; Tol. al glifosato	cry3A; plrv orf1; plrv orf2; cp4 epsps (aroA:CP4)
Patata	SEMT15-02	NMK-89935-9	Res. a la enfermedad e insectos	cry3A; pvv cp
Patata	SEMT15-07	NA	Res. a la enfermedad e insectos	cry3A; pvv cp
Patata	SEMT15-15	NMK-89930-4	Res. a la enfermedad e insectos	cry3A; pvv cp
Patata	SPBT02-5	NMK-89576-1	Res. a insectos	cry3A
Patata	SPBT02-7	NMK-89724-5	Res. a insectos	cry3A
Arroz	7Crp#242-95-7		Antialérgico	7crp
Arroz	7Crp#10	NA	Antialérgico	7crp
Arroz	GM Shanyou 63	NA	Res. a insectos	cry1Ab; cry1Ac
Arroz	Huahui-1/TT51-1	NA	Res. a insectos	cry1Ab; cry1Ac
Arroz	LLARROZ06	ACS-OS001-4	Tol. al glufosinato	bar
Arroz	LLARROZ601	BCS-OS003-7	Tol. al glufosinato	bar
Arroz	LLARROZ62	ACS-OS002-5	Tol. al glufosinato	bar
Arroz	Tarom molaii + cry1Ab	NA	Res. a insectos	cry1Ab (truncado)
Arroz	GAT-OS2		Tol. al glufosinato	bar
Arroz	GAT-OS3		Tol. al glufosinato	bar
Arroz	PE-7		Res. a insectos	Cry1Ac
Arroz	7Crp#10	NA	Antialérgico	7crp
Arroz	KPD627-8		Triptófano alto	OASA1D
Arroz	KPD722-4		Triptófano alto	OASA1D
Arroz	KA317		Triptófano alto	OASA1D
Arroz	HW5		Triptófano alto	OASA1D
Arroz	HW1		Triptófano alto	OASA1D
Arroz	B-4-1-18		Semienano de hojas erectas	Δ OsBRI1
Arroz	G-3-3-22		Semienano	OSGA2ox1
Arroz	AD77		Res. a la enfermedad	DEF

ES 2 707 398 T3

Cultivo	Nombre del suceso	Código del suceso	Característica(s)	Gen(es)
Arroz	AD51		Res. a la enfermedad	DEF
Arroz	AD48		Res. a la enfermedad	DEF
Arroz	AD41		Res. a la enfermedad	DEF
Arroz	13pNasNaatAprt1		tol. al hierro bajo	HvNAS1; HvNAAT-A; APRT
Arroz	13pAprtl		tol. al hierro bajo	APRT
Arroz	gHvNAS1-gHvNAAT-1		tol. al hierro bajo	HvNAS1; HvNAAT-A; HvNAAT-B
Arroz	gHvIDS3-1		tol. al hierro bajo	HvIDS3
Arroz	gHvNAAT1		tol. al hierro bajo	HvNAAT-A; HvNAAT-B
Arroz	gHvNAS1-1		tol. al hierro bajo	HvNAS1
Arroz	NIA-OS006-4		Res. a la enfermedad	WRKY45
Arroz	NIA-OS005-3		Res. a la enfermedad	WRKY45
Arroz	NIA-OS004-2		Res. a la enfermedad	WRKY45
Arroz	NIA-OS003-1		Res. a la enfermedad	WRKY45
Arroz	NIA-OS002-9		Res. a la enfermedad	WRKY45
Arroz	NIA-OS001-8		Res. a la enfermedad	WRKY45
Arroz	OsCr11		Antialérgico	Cry j modificado
Arroz	17053		Tol. al glifosato	cp4 epsps (aroA:CP4)
Arroz	17314		Tol. al glifosato	cp4 epsps (aroA:CP4)
Rosa	WKS82/130-4-1	IFD-52401-4	Color de la flor modificado	5AT; bp40 (f3'5'h)
Rosa	WKS92 / 130-9-1	IFD-52901-9	Color de la flor modificado	5AT; bp40 (f3'5'h)
Soja	260-05 (G94-1, G94-19, G168)	NA	Aceite/ácido graso modificado	gm-fad2-1 (ubicación de silenciamiento)
Soja	A2704-12	ACS-GM005-3	Tol. al glufosinato	pat
Soja	A2704-21	ACS-GM004-2	Tol. al glufosinato	pat
Soja	A5547-127	ACS-GM006-4	Tol. al glufosinato	pat
Soja	A5547-35	ACS-GM008-6	Tol. al glufosinato	pat
Soja	CV127	BPS-CV127-9	Tol. a imidazolinona	csrl-2
Soja	DAS68416-4	DAS68416-4	Tol. al glufosinato	pat
Soja	DP305423	DP-305423-1	Aceite/ácido graso modificado; Tol al herbicida para ALS	gm-fad2-1 (ubicación de silenciamiento); gm-hra
Soja	DP356043	DP-356043-5	Aceite/ácido graso modificado; tol. al glifosato	gm-fad2-1 (ubicación de silenciamiento); gat4601
Soja	FG72	MST-FG072-3	Tol. al glifosato y HPPD	2mepsps; hppdPF W336

ES 2 707 398 T3

Cultivo	Nombre del suceso	Código del suceso	Característica(s)	Gen(es)
Soja	GTS 40-3-2 (40-3-2)	MON-04032-6	Tol. al glifosato	cp4 epsps (aroA:CP4)
Soja	GU262	ACS-GM003-1	Tol. al glufosinato	pat
Soja	MON87701	MON-87701-2	Res. a insectos	cry1Ac
Soja	MON87705	MON-87705-6	Aceite/ácido graso modificado; tol. al glifosato	fatb1-A (sentido y antisentido); fad2-1A (sentido y antisentido); cp4 epsps (aroA:CP4)
Soja	MON87708	MON-87708-9	tol. al glifosato y Dicamba	dmo; cp4 epsps (aroA:CP4)
Soja	MON87769	MON-87769-7	Aceite/ácido graso modificado; tol. al glifosato	Pj.D6D; Nc.Fad3; cp4 epsps (aroA:CP4)
Soja	MON89788	MON-89788-1	Tol. al glifosato	cp4 epsps (aroA:CP4)
Soja	W62	ACS-GM002-9	Tol. al glufosinato	bar
Soja	W98	ACS-GM001-8	Tol. al glufosinato	bar
Soja	MON87754	MON-87754-1	Aceite alto	dgat2A
Soja	DAS21606	DAS-21606	tol. al ariloxilalcanoato y glufosinato	aad-12 modificado; pat
Soja	DAS44406	DAS-44406-6	tol. al ariloxilalcanoato, glifosato y glufosinato	aad-12 modificado; 2mepsps; pat
Soja	SYHT04R	SYN-0004R-8	tol. a mesotriona	avhppd modificado
Soja	9582.814.19.1		Res. a insectos y tol. al glufosinato	cry1Ac, cry1F, PAT
Calabaza	CZW3	SEM-ØCZW3-2	Res. a la enfermedad	cmv cp, zymv cp, wmv cp
Calabaza	ZW20	SEM-0ZW20-7	Res. a la enfermedad	zymv cp, wmv cp
Remolacha azucarera	GTSB77 (T9100152)	SY-GTSB77-8	Tol. al glifosato	cp4 epsps (aroA:CP4); goxv247
Remolacha azucarera	H7-1	KM-000H71-4	Tol. al glifosato	cp4 epsps (aroA:CP4)
Remolacha azucarera	T120-7	ACS-BV001-3	Tol. al glufosinato	pat
Remolacha azucarera	T227-1		Tol. al glifosato	cp4 epsps (aroA:CP4)
Caña de azúcar	NXI-1T		Tol. a la sequía	EcbetA
Girasol	X81359		Tol. a imidazolinona	als
Pimentón	PK-SP01	NA	Res. a la enfermedad	cmv cp
Tabaco	C/F/93/08-02	NA	Tol. al oxinilo	bxn
Tabaco	Vector 21-41	NA	Nicotina reducida	NtQPT1 (antisentido)
Tomate	1345-4	NA	Maduración/senectud	acc (truncado)

Cultivo	Nombre del suceso	Código del suceso	Característica(s)	Gen(es)
Tomate	35-1-N	NA	retrasada Maduración/senectud retrasada	sam-k
Tomate	5345	NA	Res. a insectos	cry1Ac
Tomate	8338	CGN-89322-3	Maduración/senectud retrasada	accd
Tomate	B	SYN-0000B-6	Maduración/senectud retrasada	pg (sentido o antisentido)
Tomate	Da	SYN-0000DA-9	Maduración/senectud retrasada	pg (sentido o antisentido)
Girasol	X81359		Tol. a imidazolinona	als
Tomate	Da Dong No 9	NA	Producto modificado	NA
Tomate	F (1401F, h38F, 11013F, 7913F)	SYN-0000F-1	Maduración/senectud retrasada	pg (sentido o antisentido)
Tomate	FLAVR SAVR™	CGN-89564-2	Maduración/senectud retrasada	pg (sentido o antisentido)
Tomate	Huafan No 1	NA	Maduración/senectud retrasada	anti-efe
Tomate	PK-TM8805R (8805R)	NA	Res. a la enfermedad	cmv cp
Trigo	MON71800	MON-718ØØ-3	Tol. al glifosato	cp4 epsps (aroA:CP4)
* Argentina, ** Polaco, # Berenjena				

El tratamiento de plantas y semillas genéticamente modificadas con compuestos de la invención puede dar por resultado efectos súper-aditivos o sinérgicos. Por ejemplo, la reducción en las tasas de aplicación, la ampliación del espectro de actividad, la tolerancia aumentada a las tensiones bióticas/abióticas o la estabilidad mejorada al almacenaje pueden ser mayores que las esperadas a partir de los simples efectos aditivos de la aplicación de compuestos de la invención en plantas y semillas genéticamente modificadas.

5

Los compuestos de esta invención son también útiles en los tratamientos de la semilla para proteger las semillas de plagas de invertebrados. En el contexto de la presente descripción y reivindicaciones, tratar una semilla significa poner en contacto la semilla con una cantidad biológicamente efectiva de un compuesto de esta invención, que se formula típicamente como una composición de la invención. Este tratamiento de la semilla protege la semilla de plagas del suelo de invertebrados y generalmente puede también proteger las raíces y otras partes de la planta en contacto con el suelo de la plántula que se desarrolla de la semilla en germinación. El tratamiento de la semilla puede proporcionar también protección del follaje por translocación del compuesto de esta invención o un segundo ingrediente activo en la planta en desarrollo. Los tratamientos de la semilla pueden aplicarse a todos los tipos de semillas, que incluyen aquellas de las que germinarán plantas transformadas genéticamente para expresar características especializadas. Los ejemplos representativos incluyen los que expresan proteínas tóxicas para las plagas de invertebrados, tales como toxina de *Bacillus thuringiensis* o los que expresan resistencia a herbicidas tales como glifosato acetiltransferasa, que proporciona resistencia al glifosato. Los tratamientos de semillas con compuestos de esta invención pueden aumentar también el vigor de las plantas que crecen de la semilla.

10

15

Un método de tratamiento de semilla es pulverizando o empolvando la semilla con un compuesto de la invención (es decir como una composición formulada) antes de la siembra de las semillas. Las composiciones formuladas para el tratamiento de semillas generalmente comprenden un formador de película o agente adhesivo. Por lo tanto típicamente una composición de recubrimiento de semillas de la presente invención comprende una cantidad biológicamente efectiva de un compuesto de Fórmula 1, un N-óxido o sal del mismo, y un formador de película o agente adhesivo. La semilla puede recubrirse pulverizando un concentrado de suspensión fluida directamente en un lecho mezclador de semillas y después secando las semillas. De forma alternativa, otros tipos de formulación tal como polvos húmedos, disoluciones, suspoemulsiones, concentrados emulsificables y emulsiones en agua pueden pulverizarse en la semilla. Este proceso es particularmente útil para aplicar recubrimientos de película en semillas. Varias máquinas y procesos de recubrimiento están disponibles para un experto en la técnica. Los procesos

20

25

adecuados incluyen los enumerados en P. Kusters et al., Seed Treatment: Progress and Prospects, 1994 BCPC Monografía núm. 57, y las referencias enumeradas en ella.

5 Los compuestos de Fórmula 1 y sus composiciones, tanto solas como en combinación con otros insecticidas, nematocidas y fungicidas, son particularmente útiles en el tratamiento de semillas para cultivos que incluyen, aunque no están limitados a, maíz, sojas, algodón, cereal (p.ej., trigo, avena, cebada, centeno y arroz), patatas, vegetales y colza.

10 Otros insecticidas con los que los compuestos de Fórmula 1 pueden formularse para proporcionar mezclas útiles en el tratamiento de semillas incluyen abamectina, acetamiprid, acrinatrina, amitraz, avermectina, azadiractina, bensultap, bifentrina, buprofezina, cadusafos, carbarilo, carbofurano, cartap, clorantraniliprol, clorfenapir, clorpirifos, clotianidina, ciantraniliprol, ciflutrina, beta-ciflutrina, cihalotrina, gamma-cihalotrina, lambda-cihalotrina, cipermetrina, alfa-cipermetrina, zeta-cipermetrina, ciromazina, deltametrina, dieldrina, dinotefurano, diofenolano, emamectina, endosulfano, esfenvalerato, etiprol, etofenprox, etoxazol, fenotiocarb, fenoxicarb, fenvalerato, fipronilo, flonicamid, flubendiamida, flufenoxurona, fluvalinato, formetanato, fostiazato, hexaflumurona, hidrametilnona, imidacloprid, indoxacarb, lufenurona, metaflumizona, metiocarb, metomilo, metopreno, metoxifenoza, nitenpiram, nitiazina, 15 novalurona, oxamilo, pimetrozina, piretrina, piridabeno, piridalilo, piriproxifeno, rianodina, espinetoram, espinosad, espiroclorfenol, espiromesifeno, espirotetramat, sulfoxaflor, tebufenoza, tetrametrina, tiacloprid, tiametoxam, tiodicarb, tiosultap-sodio, tralometrina, triazamato, triflumurona, delta-endotoxinas de *Bacillus thuringiensis*, todas las cepas de *Bacillus thuringiensis* y todas las cepas de virus de nucleopolihedrosis.

20 Los fungicidas con los que los compuestos de Fórmula 1 pueden formularse para proporcionar mezclas útiles en el tratamiento de semillas incluyen amisulbrom, azoxistrobina, boscalid, carbendazim, carboxina, cimoxanilo, ciproconazol, difenoconazol, dimetomorfo, fluazinam, fludioxonilo, fluquinconazol, fluopicolida, fluoxastrobina, flutriafol, fluxapiroxad, ipconazol, iprodiona, metalaxilo, mefenoxam, metconazol, miclobutanilo, paclobutrazol, penflufeno, picoxistrobina, protioconazol, piraclostrobina, sedaxano, siltiofam, tebuconazol, tiabendazol, tiofanato-metilo, tiram, trifloxistrobina y triticonazol.

25 Las composiciones que comprenden compuestos de Fórmula 1 útiles para el tratamiento de semillas pueden comprender además bacterias y hongos que tienen la capacidad de proporcionar protección de los efectos dañinos de hongos o bacterias patógenos para las plantas y/o animales nacidos del suelo tal como nematodos. Las bacterias que muestran propiedades nematocidas pueden incluir aunque no están limitadas a *Bacillus firmus*, *Bacillus cereus*, *Bacillus subtilis* y *Pasteuria penetrans*. Una cepa de *Bacillus firmus* adecuada es la cepa CNCM 1-1582 (GB-126) que está disponible comercialmente como BioNem™. Una cepa de *Bacillus cereus* adecuada es la cepa NCMM 1-1592. Ambas cepas de *Bacillus* se describen en el documento US 6.406.690. Otras bacterias adecuadas que muestran actividad nematocida son *B. amyloliquefaciens* IN937a y la cepa de *B. subtilis* GB03. Las bacterias que muestran propiedades fungicidas pueden incluir aunque no están limitadas a la cepa GB34 de *B. pumilus*. Las especies fúngicas que muestran propiedades nematocidas pueden incluir aunque no están limitadas a *Myrothecium verrucaria*, *Paecilomyces lilacinus* y *Purpureocillium lilacinum*.

30

35

Los tratamientos de semillas pueden incluir también uno o más agentes nematocidas de origen natural tal como la proteína elicitora denominada harpina que se aísla de ciertos patógenos de plantas bacterianos tales como *Erwinia amylovora*. Un ejemplo es la tecnología de tratamiento de semillas Harpin-N-Tek disponible como N-Hibit™ Gold CST.

40 Los tratamientos de semillas pueden incluir también una o más especies de bacterias que nodulan la raíz de las legumbres tal como la bacteria fijadora de nitrógeno microsimbótica *Bradyrhizobium japonicum*. Estos inoculantes pueden incluir opcionalmente uno o más lipo-chitoooligosacáridos (LCO), que son factores de nodulación (Nod) producidos por la bacteria rhizobia durante el inicio de la formación de nódulos en las raíces de las legumbres. Por ejemplo, la tecnología de tratamiento de semillas de marca Optimize® incorpora LCO Promoter Technology™ en combinación con un inoculante.

45

El tratamiento de semillas puede incluir también una o más isoflavonas que pueden aumentar el nivel de colonización de las raíces por hongos micorrizales. Los hongos micorrizales mejoran el crecimiento de la planta mejorando la absorción de la raíz de nutrientes tales como agua, sulfatos, nitratos, fosfatos y metales. Ejemplos de isoflavonas incluyen, aunque no están limitadas a genisteína, biochanina A, formononetina, daidzeína, gliciteína, hesperetina, naringenina y pratenseína. La formononetina está disponible como un ingrediente activo de productos inoculantes micorrizales tal como PHC Colonize® AG.

50

Los tratamientos de semillas pueden incluir también uno o más activadores de plantas que inducen la resistencia adquirida sistémica en las plantas después del contacto por un patógeno. Un ejemplo de activador de planta que induce dichos mecanismos protectores es acibenzolar-S-metilo.

55 La semilla tratada típicamente comprende un compuesto de la presente invención en una cantidad de aproximadamente 0,1 g a 1 kg por 100 kg de semilla (es decir de aproximadamente 0,0001 a 1% en peso de la semilla antes del tratamiento). Una suspensión fluida formulada para el tratamiento de semillas comprende típicamente de aproximadamente 0,5 a aproximadamente 70% del ingrediente activo, de aproximadamente 0,5 a

aproximadamente 30% de un adhesivo formador de película, de aproximadamente 0,5 a aproximadamente 20% de un agente de dispersión, de 0 a aproximadamente 5% de un espesante, de 0 a aproximadamente 5% de un pigmento y/o tinte, de 0 a aproximadamente 2% de un agente antiespumante, de 0 a aproximadamente 1% de un conservante, y de 0 a aproximadamente 75% de un diluyente líquido volátil.

5 Los compuestos de esta invención pueden incorporarse en una composición cebo que se consume por una plaga de invertebrados o se usa en un dispositivo tal como una trampa, estación de cebo y similares. Dicha composición cebo puede estar en forma de gránulos que comprenden (a) ingredientes activos, específicamente una cantidad biológicamente efectiva de un compuesto de Fórmula 1, un *N*-óxido o sal del mismo; (b) uno o más materiales alimenticios; opcionalmente (c) un atrayente, y opcionalmente (d) uno o más humectantes. Son dignos de mención
10 los gránulos o composiciones cebo que comprenden entre aproximadamente 0,001-5% de ingredientes activos, aproximadamente 40-99% de material alimenticio y/o atrayente; y opcionalmente aproximadamente 0,05-10% de humectantes, que son efectivos en el control de plagas de invertebrados del suelo a tasas de aplicación muy bajas, particularmente a dosis de ingrediente activo que son letales por ingestión más que por contacto directo. Algunos materiales alimenticios pueden funcionar tanto como una fuente de alimento como un atrayente. Los materiales alimenticios incluyen carbohidratos, proteínas y lípidos. Son ejemplos de materiales alimenticios la harina vegetal, azúcar, almidones, grasa animal, aceite vegetal, extractos de levadura y sólidos de leche. Ejemplos de atrayentes son odorantes y saborizantes, tales como extractos de fruta o plantas, perfume, u otros componentes animales o de plantas, feromonas u otros agentes conocidos por atraer una plaga de invertebrados diana. Ejemplos de humectantes, es decir agentes de retención de humedad, son glicoles y otros polioles, glicerina y sorbitol. Es digna
15 de mención una composición cebo (y un método que utiliza dicha composición cebo) usada para controlar al menos una plaga de invertebrados seleccionada del grupo que consiste en hormigas, termitas y cucarachas. Un dispositivo para controlar una plaga de invertebrados puede comprender la presente composición cebo y un alojamiento adaptado para recibir la composición cebo, en el que el alojamiento tiene al menos una abertura dimensionada para permitir el paso a la plaga de invertebrados a través de la abertura de manera que la plaga de invertebrados pueda tener acceso a la composición cebo desde una ubicación externa al alojamiento, y en el que el alojamiento se adapta adicionalmente a colocarse en o cerca de una ubicación de actividad potencial o conocida para la plaga de invertebrados.

Una realización de la presente invención se refiere a un método para controlar plagas de invertebrados, que comprende diluir la composición pesticida de la presente invención (un compuesto de Fórmula 1 formulado con tensioactivos, diluyentes sólidos y diluyentes líquidos o una mezcla formulada de un compuesto de Fórmula 1 y al menos un pesticida distinto) con agua, y añadir opcionalmente un adyuvante para formar una composición diluida, y poner en contacto la plaga de invertebrados o su medio con una cantidad efectiva de dicha composición diluida.

Aunque una composición de pulverización formada diluyendo con agua una concentración suficiente de la presente composición pesticida puede proporcionar suficiente eficacia para controlar las plagas de invertebrados, también
35 pueden añadirse productos adyuvantes formulados de forma separada para pulverizar mezclas de tanque. Estos adyuvantes adicionales se conocen normalmente como "adyuvantes de pulverización" o "adyuvantes de premezcla en tanque", e incluyen cualquier sustancia mezclada en un tanque de pulverización para mejorar el rendimiento de un pesticida o alterar las propiedades físicas de la mezcla de pulverización. Los adyuvantes pueden ser tensioactivos, agentes emulgentes, aceites para cultivo basados en petróleo, aceites de semillas derivados de cultivo, acidulantes, tampones, espesantes o agentes desespumantes. Los adyuvantes se usan para mejorar la eficacia (p.ej., disponibilidad biológica, adhesión, penetración, uniformidad de cobertura y durabilidad de la protección) o minimizar o eliminar los problemas de aplicación por pulverizado asociados con la incompatibilidad, formación de espuma, deriva, evaporación, volatilización y degradación. Para obtener el rendimiento óptimo, los adyuvantes se seleccionan con respecto a las propiedades del ingrediente activo, formulación y objetivo (p.ej.,
40 cultivos, plagas de insectos).

Entre los adyuvantes de pulverización, los aceites que incluyen aceites para cultivos, concentrados de aceites para cultivos, concentrados de aceites vegetales y concentrados de aceites de semillas metilados son los más comúnmente usados para mejorar la eficacia de los pesticidas, posiblemente por medio de la promoción de depósitos de pulverización más regulares y uniformes. En situaciones donde la fitotoxicidad provocada
50 potencialmente por aceites y otros líquidos inmiscibles en agua son preocupantes, las composiciones de pulverización preparadas a partir de la composición de la presente invención generalmente no contendrán adyuvantes de pulverización con base de aceite. Sin embargo, en situaciones donde la fitotoxicidad provocada por los adyuvantes de pulverización con base de aceite sea comercialmente insignificante, las composiciones de pulverización preparadas a partir de la composición de la presente composición pueden contener también adyuvantes de pulverización con base de aceite, que pueden potencialmente aumentar más el control de las plagas de invertebrados, además de la resistencia a la lluvia.

Los productos identificados como "aceite para cultivo" típicamente contienen 95 a 98% de aceite de petróleo con base de parafina o nafta y 1 a 2% de uno o más tensioactivos que funcionan como emulgentes. Los productos identificados como "concentrados de aceite para cultivos" típicamente consisten en 80 a 85% de aceite con base de petróleo emulsificable y 15 a 20% de tensioactivos no iónicos. Los productos correctamente identificados como "concentrados de aceite vegetal" típicamente consisten en 80 a 85% de aceite vegetal (es decir aceite de semilla o fruto, lo más normalmente de algodón, lino, soja o girasol) y 15 a 20% de tensioactivos no iónicos. El rendimiento del

adyuvante puede mejorarse sustituyendo el aceite vegetal con ésteres de metilo de ácidos grasos que se derivan típicamente de aceites vegetales. Ejemplos de concentrados de aceite de semillas metilados incluyen concentrado MSO® (UAP-Loveland Products, Inc.), y Aceite de pulverización metilado MSO Premium (Helena Chemical Company).

- 5 La cantidad de adyuvantes añadidos a mezclas de pulverización generalmente no exceden de aproximadamente 2,5% en volumen, y más típicamente la cantidad es de aproximadamente 0,1 a aproximadamente 1% en volumen. Las tasas de aplicación de adyuvantes añadidos a mezclas de pulverización están típicamente entre aproximadamente 1 a 5 L por hectárea. Ejemplos representativos de adyuvantes de pulverización incluyen: Adigor® (Syngenta) aceite de colza metilado al 47% en hidrocarburos líquidos, Silwet® (Helena Chemical Company) heptametiltrisiloxano modificado con polialquilenóxido y Assist® (BASF) aceite mineral con base de 17% de mezcla de tensioactivos en 83% de parafina.

Los compuestos de esta invención pueden aplicarse sin otros adyuvantes, aunque lo más a menudo la aplicación será de una formulación que comprende uno o más ingredientes activos con vehículos, diluyentes y tensioactivos adecuados y posiblemente en combinación con un alimento dependiendo del uso final contemplado. Un método de aplicación implica pulverizar una dispersión de agua o disolución de aceite refinado de un compuesto de la presente invención. Las combinaciones con aceites de pulverización, concentraciones de aceite de pulverización, etiquetas esparcidoras, adyuvantes, otros disolventes, y sinérgicos tales como butóxido de piperonilo a menudo mejoran la eficacia del compuesto. Para usos no agronómicos dichas pulverizaciones pueden aplicarse desde recipientes de pulverización tales como una lata, una botella u otro recipiente, o bien por medio de una bomba o liberándolo desde un recipiente presurizado, p.ej., una lata de pulverización de aerosol presurizada. Dichas composiciones de pulverización pueden tomar diversas formas, por ejemplo, pulverizaciones, nebulizaciones, espumas, humos o niebla. Dichas composiciones de pulverización por tanto pueden además comprender propelentes, agentes espumantes, etc. como sea el caso. Es digna de mención una composición de pulverización que comprende una cantidad biológicamente efectiva de un compuesto o una composición de la presente invención y un vehículo. Una realización de dicha composición de pulverización comprende una cantidad biológicamente efectiva de un compuesto o una composición de la presente invención y un propelente. Propelentes representativos incluyen, aunque no están limitados a, metano, etano, propano, butano, isobutano, buteno, pentano, isopentano, neopentano, penteno, hidrofluorocarbonos, clorofluorocarbonos, dimetiléter, y mezclas de los precedentes. Es digna de mención una composición de pulverización (y un método que utiliza dicha composición de pulverización dispensada desde un recipiente de pulverización) usada para controlar al menos una plaga de invertebrados seleccionada del grupo que consiste en mosquitos, moscas negras, moscas de establo, moscas de venado, moscas de caballo, avispas, avispas amarillas, avispones, garrapatas, arañas, hormigas, jejenes, y similares, que incluyen individualmente o en combinaciones.

Las siguientes pruebas demuestran la eficacia de control de los compuestos de esta invención en plagas específicas. La "eficacia de control" representa la inhibición del desarrollo de la plaga de invertebrados (incluyendo la mortalidad) que provoca la alimentación significativamente reducida. La protección del control de plagas proporcionada por los compuestos no está limitada, sin embargo, a estas especies. Véase las Tablas de índice A-N para las descripciones de compuesto. Véase la Tabla de índice O para los datos de ¹H RMN.

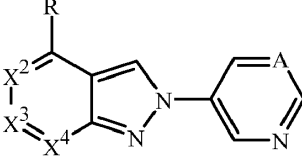
Las siguientes abreviaturas pueden usarse en las Tablas de índice que siguen: Comp. significa compuesto, t es terciario, c es ciclo, Me es metilo, Et es etilo, Pr es propilo, i-Pr es isopropilo, Bu es butilo, c-Pr es ciclopropilo, c-Pn es ciclopentilo, c-Hx es ciclohexilo, t-Bu es butilo terciario, Ph es fenilo, Ome es metoxi, SMe es metiltio, y SO₂Me significa metilsulfonilo. Una línea ondulada o "—" en un fragmento de estructura indica el punto de unión del fragmento al resto de la molécula. La abreviatura "Ej." significa "Ejemplo" y va seguida por un número que indica en qué ejemplo se prepara el compuesto.

45

Tabla de índice A

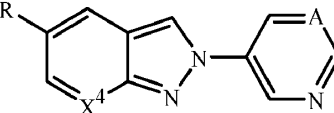
Comp. Núm.	R	X ²	X ³	X ⁴	A	Datos RMN/MS
1	-C(O)(1-pirrolidinilo)	CH	CH	CH	CH	*
2	-C(O)NH(2-pirimidinilo)	CH	CH	CH	CH	*
3	-C(O)(morfolino)	CH	CH	CH	CH	*

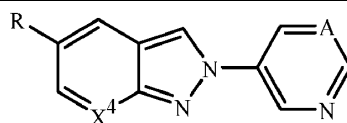
						
Comp. Núm.	R	X ²	X ³	X ⁴	A	Datos RMN/MS
4	-C(O)NH(2-piridinilo)	CH	CH	CH	CH	*
5	-C(O)NH(fenilo)	CH	CH	CH	CH	*
6	-C(O)NHCH(Me)C(O)NH(t-butilo)	CH	CH	CH	CH	*
7	-C(O)NHCH(Me)C(O)NH(isopropilo)	CH	CH	CH	CH	*
8	-C(O)NH(isopropilo)	CH	CH	CH	CH	*
9	-C(O)NHCH ₂ (2-piridinilo)	CH	CH	CH	CH	*
10	-C(O)NHCH ₂ CH(OMe) ₂	CH	CH	CH	CH	*
11	-C(O)NHCH ₂ (2-tiazolilo)	CH	CH	CH	CH	*
12	-C(O)NHCH ₂ (tetrahidro-2-furanilo)	CH	CH	CH	CH	*
13	-C(O)NHCH ₂ CH ₂ SMe	CH	CH	CH	CH	*
14	-C(O)NH(ciclopropilo)	CH	CH	CH	CH	*
15	-C(O)NH(1-piperidinilo)	CH	CH	CH	CH	*
16	-C(O)NH(ciclohexilo)	CH	CH	CH	CH	*
17	3-(trifluorometil)-1-pirazolilo	CH	CH	CH	CH	*
18	2-pirimidinilo	CH	CH	CH	CH	*
19	-C(O)NHCH ₂ CF ₃	CH	CH	CH	CH	*
20	6-(2-pirimidinil)piridin-2-ilo	CH	CH	CH	CH	*
21	-C(O)NHCH ₂ (2-pirimidinilo)	CH	CH	CH	CH	*
22	2-(2-piridinil)tiazol-4-ilo	CH	CH	CH	CH	*
23	2-(2-tiazolil)tiazol-4-ilo	CH	CH	CH	CH	*
24	-C(O)NHCH ₂ CHF ₂	CH	CH	CH	CH	*
300	-C(O)NHCH ₂ (2-pirimidinilo)	CH	CH	CH	CF	*
303	1,2,4-oxadiazol-3-ilo	CH	CH	CH	CH	*
304	5-(trifluorometil)-2-piridinilo	CH	CH	CH	CH	*
305	-C(O)NHCH ₂ (5-metil-2-pirazinilo)	CH	CH	CH	CH	*
306	-C(S)NH(ciclohexilo)	CH	CH	CH	CH	*
307	-C(O)NHCH ₂ CF ₃	CH	CH	CH	CF	*
308	-C(O)NHCH ₂ (tetrahidro-2-furanilo)	CH	CH	CH	CF	*
309	-C(O)NH(isopropilo)	CH	CH	CH	CF	*
315	2-tiometoxi-4-pirimidinilo	CH	CH	CH	CH	*
316	-C(S)NH(isopropilo)	CH	CH	CH	CH	*

						
Comp. Núm.	R	X ²	X ³	X ⁴	A	Datos RMN/MS
500	-C(O)NH(isopropilo)	CF	CH	CH	CH	299
501	-C(O)NH(isopropilo)	CH	CH	CF	CH	299
502	-C(O)NHCH ₂ CH ₂ SMe	CH	CH	CF	CH	331
503	-C(O)NHCH ₂ CH ₂ SMe	CF	CH	CH	CH	331
504	-C(O)NHCH ₂ CH(OMe) ₂	CH	CH	CH	CF	*

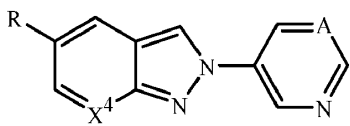
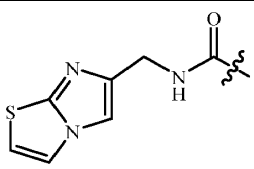
* Véase la Tabla de índice O para los datos de ¹H RMN.

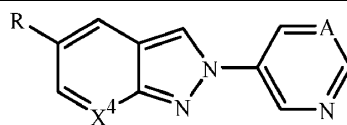
Tabla de índice B

			
X ⁴ es CH			
Comp. núm.	R	A	Datos de RMN/MS
25	-C(O)(1-pirrolidinilo)	CH	*
26	-C(O)NH(2-pirimidinilo)	CH	*
27	1-pirazolilo	CH	*
28	-C(O)NH(2-piridinilo)	CH	*
29	-C(O)NH(fenilo)	CH	*
30	-NHC(O)(fenilo)	CH	*
31	-NHC(O)(2-piridinilo)	CH	*
32	- (R)-C(O)NHCH(Me)C(O)NH(t-butilo)	CH	*
33	-C(O)NMe ₂	CH	*
34	-C(O)NHCH ₂ CF ₃	CH	*
35	-C(O)NH(isopropilo)	CH	*
36	-C(O)(1-piperidinilo)	CH	*
37	-C(O)NH(ciclopropilo)	CH	*
38	-C(O)NHCH ₂ CH(-OCH ₂ CH ₂ O-)	CH	*
39	-C(O)NHCH ₂ CH(OMe) ₂	CH	*
40	-C(O)NHCH ₂ (2-tiazolilo)	CH	*
41	-C(O)NHCH ₂ (tetrahidro-2-furanilo)	CH	*
42	-C(O)NHNHCO ₂ Me	CH	*

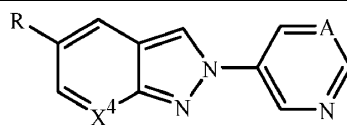
X⁴ es CH

Comp. núm.	R	A	Datos de RMN/MS
43	-C(O)(4-metil-1-piperazinilo)	CH	*
44	-C(O)(morfolino)	CH	*
45	-C(O)NHOCH ₂ CH=CH ₂	CH	*
46	-C(O)NHCH ₂ CH ₂ SEt	CH	*
47	-C(O)NHOCH ₂ (ciclopropilo)	CH	*
48	-C(O)NHS(O) ₂ (4-clorofenilo)	CH	*
49	-C(O)NHCH ₂ CN	CH	*
50	-C(O)N(-CH ₂ CH(CF ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₂ -)	CH	*
51(no reivindicado)	-C(O)NHCH ₂ (2,2-difluorociclopropilo)	CH	*
52	-C(O)NHCH ₂ CH ₂ CF ₃	CH	*
53	-C(O)NHCH ₂ (ciclopropilo)	CH	*
54	-C(O)NHCH ₂ C(Me)F ₂	CH	*
55	-C(O)NHCH ₂ (2-pirimidinilo)	CH	*
56	-C(O)NHCH ₂ (6-bromo-2-piridinilo)	CH	*
57	-C(O)NHCH ₂ CH ₂ SMe	CH	*
58	-C(O)N(CH ₂ CH ₂ SMe)(CH ₂ OEt)	CH	*
59	-C(O)NHCH ₂ CH ₂ CH ₂ (1-imidazolilo)	CH	*
60	-C(O)NHCH ₂ (2-furanilo)	CH	*
61	-C(O)N(Et)(ciclohexilo)	CH	*
62	-C(O)NH(3,3-difluorociclobutilo)	CH	*
63	-C(O)NHCH(isopropil)CO ₂ Me	CH	*
64	-C(O)N(Me)CH ₂ CF ₃	CH	*
65	-C(O)NHCH ₂ (2-tienilo)	CH	*
66	-C(O)N(CH ₂ CH ₂ CN)(CH ₂ (3-piridinilo))	CH	*
67	-C(O)N(Me)(ciclopropilo)	CH	*
68	-C(O)NHCH(Me)CH ₂ OMe	CH	*
69	-C(O)N(CH ₂ CCH) ₂	CH	*
70	-C(O)NHCH ₂ CH ₂ N(isopropilo) ₂	CH	*
71	-C(O)NHCH ₂ ((3-trifluorometoxi)fenilo)	CH	*
72	-C(O)N(-CH ₂ CH ₂ N(C(O)(ciclopropil))CH ₂ CH ₂ -)	CH	*
73	-C(O)NHCH ₂ (2,2-dimetil-1,3-dioxolan-4-ilo)	CH	*

			
X ⁴ es CH			
Comp. núm.	R	A	Datos de RMN/MS
74	-C(O)N(-CH=NC(Me) ₂ CH ₂ -)	CH	*
75	-C(O)(tiomorfolino)	CH	*
76	-C(O)NHCH ₂ (5-metil-2-pirazinilo)	CH	*
131	-C(O)NHCH ₂ (tetrahidro-2-furanilo)	CF	*
132	-C(O)NHCH ₂ C(Me)F ₂	CF	*
133	-C(O)NHCH ₂ CH(OMe) ₂	CF	*
134		CH	*
320	2-pirimidinilo	CH	*
321	2-oxazolilo	CH	*
322	5-(3-piridinil)-1,2,4-oxadiazol-3-ilo	CH	*
323	-C(O)NHCH ₂ CH ₂ OH	CH	*
324	2-pirazinilo	CH	*
325	3-piridinilo	CH	*
326	2-tiometoxi-4-pirimidinilo	CH	*
327	6-cloro-2-(SCH ₂ CO ₂ Et)-4-pirimidinilo	CH	*
328	-C(O)NHCH ₂ CO ₂ Me	CH	*
329	-C(O)N(Me)CH ₂ (2,2-difluorociclopropilo)	CH	343
330	-C(O)N(Me)CH ₂ CH(OMe) ₂	CH	341
331	-C(O)NHCH ₂ CH ₂ OMe	CH	297
332	-C(O)NHCH ₂ CH ₂ OEt	CH	311
333	-C(O)NHCH ₂ CH ₂ O(isopropilo)	CH	325
334	-C(O)NHCH ₂ CH(Me)OMe	CH	311
335	-C(O)NHCH ₂ CH ₂ CH ₂ OMe	CH	311
336	-C(O)NH(3-metoxiciclobutilo)	CH	323
338	-C(O)N(-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -)	CH	279
339	-C(O)NHCH ₂ CH ₂ N(Me) ₂	CH	310
340	1,3,4-oxadiazol-2-ilo	CH	*
341	2-(SCH ₂ CO ₂ Et)-4-pirimidinilo	CH	*
342	-C(O)NHNHCO ₂ (t-butilo)	CH	*

X⁴ es CH

Comp. núm.	R	A	Datos de RMN/MS
343	-C(O)NHCH ₂ CHF ₂	CH	303
344	-C(O)NHCH ₂ CH ₂ F	CH	285
345	-C(O)N(Me)Et	CH	281
346	-C(O)N(Me)Pr	CH	295
347	-C(O)NHCH ₂ (tetrahidro-2-furanilo)	CH	*
348	5-(trifluorometil)-2-piridinilo	CH	*
349	-C(S)NH ₂	CH	*
350	-C(O)NHMe	CH	253
351	-C(O)NHEt	CH	267
352	-C(O)NHPr	CH	281
353	-C(O)N(-CH ₂ CH ₂ CF ₂ CH ₂ CH ₂ -)	CH	343
354	-C(O)NHBu	CH	295
355	2-tiazolinilo	CH	*
356	-NHC(O)(2-furanilo)	CH	*
357	-NHC(O)CH ₂ SPh	CH	*
358	-NHC(O)(ciclopropilo)	CH	*
359	-NHC(O)CH ₂ Ph	CH	*
360	-NHC(O)CH(Me)Et	CH	*
361	-C(O)NHCH ₂ (5-pirimidinilo)	CH	*
362	-NHC(O)CH ₂ CH(Me) ₂	CH	*
363	-C(O)NHNH(ciclohexilo)	CH	*
364	-C(O)NHCH ₂ (2-pirimidinilo)	C(OMe)	*
365	-C(O)NHCH(Me)CF ₃	CF	*
366	-C(O)NHCH(Me)(ciclopropilo)	CF	*
367	-C(O)NHCH(CH ₂ OMe) ₂	CF	*
368	-C(O)NHCH(isopropil)CF ₃	CF	*
369	-C(O)NHCH ₂ CO ₂ Et	CF	*
370	-C(O)NHCH(Me)CH ₂ OMe	CF	*
371	-C(O)NHCH ₂ CH ₂ S(t-butilo)	CH	*
372	-C(O)NHCH(Me)Et	CH	*
373	-C(O)NHNHC(O)(2-tienilo)	CH	*

X⁴ es CH

Comp. núm.	R	A	Datos de RMN/MS
374	-C(O)NHCH ₂ (5-pirimidinilo)	CF	*
375	-C(O)NHNHCO ₂ Me	CF	*
376	-C(O)NHNHC(O)(t-butilo)	CH	*
377	-C(O)NHNHC(O)(2-furanilo)	CH	*
378	-C(O)NHNHC(O)fenilo	CH	*
379	-C(O)NHNHC(O)CF ₃	CH	*
380	-C(O)NHNHCO ₂ Me	N	*
381	-C(O)NHCH(-C(O)SCH ₂ CH ₂ -)	CH	*
382	-C(O)N(-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -)	CF	*
383	-C(O)NHCH ₂ (2-benzimidazol)	CF	*
384	-C(O)NHCH ₂ CH(-CH ₂ N(CO ₂ (t-butil))CH ₂ CH ₂ CH ₂ -)	CF	*
385	-C(O)NHNHCH ₂ CF ₃	CH	*
386	-C(O)NHCH ₂ (tetrahidro-2-furanilo)	N	*
387	-C(O)NHCH ₂ CF ₃	N	*
388	-C(O)NH(ciclopropilo)	N	*
389	-C(O)NHCH ₂ (tetrahidro-2-furanilo)	CCl	*
390	-C(O)NH(ciclopropilo)	CCl	*
391	-C(O)NHCH ₂ CF ₃	CCl	*
392	-NHC(O)CH ₂ CF ₃	CH	*
393	-C(O)NHNH(ciclopropilo)	CH	*
394	-C(O)NHC(Me) ₂ C≡CH	CH	*
395	-C(O)NH(ciclobutilo)	CH	*
396	-C(O)NHCH ₂ (tetrahidro-2-furanilo)	CBr	*
397	-C(O)NHNHCO ₂ Me	CBr	*
398	-C(O)NHCH ₂ CF ₃	CBr	*
399	-C(O)NH(ciclopropilo)	CBr	*
400	-C(O)NHNHC(O)(3-piridinilo)	CH	*
401	-C(O)NHCH ₂ CF ₃	CF	*
402	-C(O)NHC(-CH ₂ CH ₂ -)CO ₂ Me	CH	*
403	-C(O)NHCH(Et)CH ₂ OMe	CH	*
404	-C(O)NHCH ₂ C≡CH	CH	*

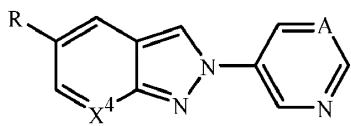
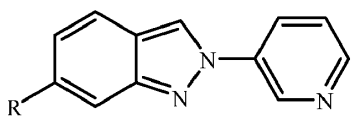
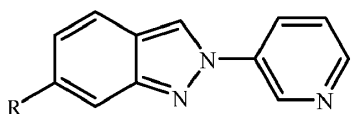
			
X ⁴ es CH			
Comp. núm.	R	A	Datos de RMN/MS
405	-C(O)NHCH ₂ CF ₃	C(OMe)	*
406	-C(O)NHCH ₂ (tetrahidro-2-furanilo)	C(OMe)	*
407	-C(O)NH(ciclopropilo)	C(OMe)	*
408	-C(O)NHNHCO ₂ Me	C(OMe)	*
409	-C(O)NHCH ₂ (5-pirimidinilo)	N	*
410	-C(O)NH(ciclopropilo)	CF	*
411	-C(O)NHCH(Me)CF ₃	CH	*
412	-C(O)NHCH(isopropil)CF ₃	CH	*
413	-C(O)N(Et) ₂	CH	*
414	-C(O)NHCH(ciclopropil)(4-metoxifenilo)	CH	*
415	-C(O)NHCH(Me)(ciclopropilo)	CH	*
416	-C(O)NHNHC(S)NH(isopropilo)	CH	*
417	-C(O)NHC(Me) ₂ CF ₃	CH	349
418	-C(O)NHC(-CH ₂ CH ₂ -)CF ₃	CH	347
419	-C(O)NHCH ₂ (2-piridinilo)	CH	330
420	-C(O)NHCH ₂ CH(Cl)CH ₂ CH ₂ CH ₂ Cl	CH	*
421	-C(O)NHCH ₂ (tetrahidro-2-furanilo)	C(SMe)	*
422	2-(SCH ₂ CF ₃)pirimidin-4-ilo	CH	*
423	6-(2-pirimidinil)piridin-2-ilo	CH	*
424	5-(trifluorometil)pirazin-2-ilo	CH	*
425	-C(O)NHCH ₂ CH ₂ SCH ₂ CH ₂ CF ₃	CH	395
426	-C(O)NHCH ₂ CH ₂ SCH ₂ CF ₃	CH	381
427	-C(O)NHCH ₂ CH ₂ S(O) ₂ CH ₂ CH ₂ CF ₃	CH	427

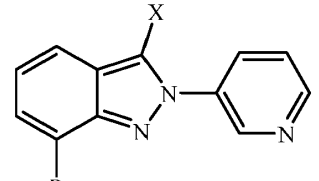
Tabla de índice C

			
Comp. Núm.	R	A	Datos de RMN/MS
428	-C(O)NHCH ₂ CF ₃	CH	*
429	-C(O)NH(ciclopropilo)	CH	*
430	-C(O)NHCH ₂ (2-pirimidinilo)	CH	*

			
Comp. Núm.	R	A	Datos de RMN/MS
431	-C(O)NHNHCO ₂ Me	CH	*
432	-C(O)NHCH ₂ CH ₂ SMe	CH	*
433	-C(O)NHCH ₂ CH(OMe) ₂	CH	*
434	-C(O)NHCH(Me)CF ₃	CH	*
435	-C(O)NHCH ₂ CHF ₂	CH	*
436	-C(O)NHCH(CH ₂ OMe) ₂	CH	*
437	-C(O)NHCH ₂ (tetrahidro-2-furanilo)	CH	*

* Véase la Tabla de índice O para los datos de ¹H RMN.

Tabla de índice D

			
Comp. Núm.	R	X	Datos de RMN/MS
135	-C(O)NHNHCO ₂ Me	Cl	*
136	-C(O)NHCH ₂ CF ₃	Cl	*
137	-C(O)NHCH ₂ (2-pirimidinilo)	Cl	*
142	-C(O)NH(ciclopropilo)	H	*
438	-C(O)NHCH ₂ (tetrahidro-2-furanilo)	Cl	*

* Véase la Tabla de índice O para los datos de ¹H RMN.

Tabla de índice E (referencia, no reivindicada)

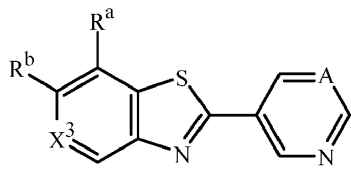
				
R ^b es H				
Comp. Núm.	R ^a	X ³	A	Datos de RMN/MS
84	-C(O)NHCH ₂ CH ₂ SMe	CH	CH	*
R ^a es H				
Comp. Núm.	R ^b	X ³	A	Datos de RMN/MS
127	-C(O)NHCH ₂ CF ₃	CH	CF	*

Tabla de índice J (referencia, no reivindicada)

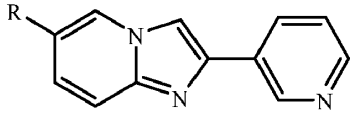
		
Comp. Núm.	R	Datos de RMN/MS
457	-C(O)NHCH ₂ CF ₃	321
* Véase la Tabla de índice O para los datos de ¹ H RMN		

Tabla de índice M (referencia, no reivindicada)

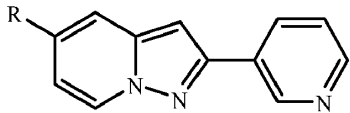
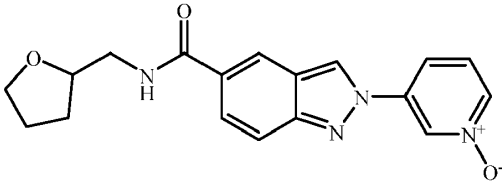
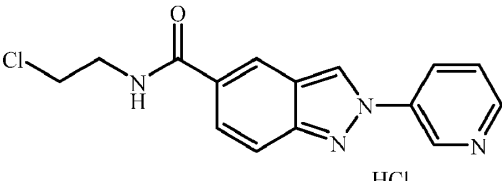
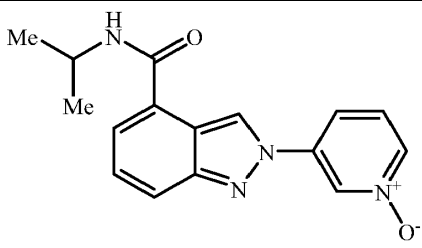
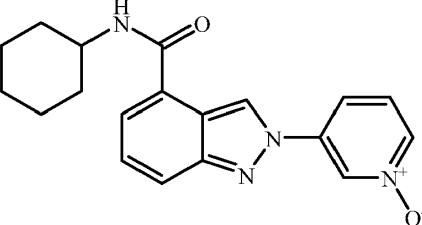
		
Comp. Núm.	R	Datos de MS
467	-C(O)NHCH ₂ (tetrahidro-2-furanilo)	*
* Véase la Tabla de índice O para los datos de ¹ H RMN.		

Tabla de índice N

Comp. Núm.	R	Datos de RMN/MS
462		*
463	 HCl	*
464		*
465		*

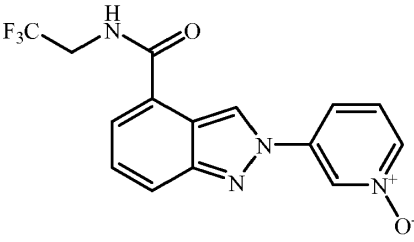
Comp. Núm.	R	Datos de RMN/MS
466		*
* Véase la Tabla de índice O para los datos de ¹ H RMN		

Tabla de índice O

Comp. núm.	Datos de ¹ H RMN ^a
1	¹ H RMN (CDCl ₃) δ: 9,23 (s, 1H), 8,74 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,66 (dd, J=4,7, 1,6 Hz, 1H), 8,28 (ddd, J=8,3, 2,6, 1,5 Hz, 1H), 7,85 (dt, J=8,7, 0,9 Hz, 1H), 7,47-7,50 (m, 1H), 7,35 (dd, J=8,7, 6,8 Hz, 1H), 7,28-7,30 (m, 1H), 3,75 (br s, 2H), 3,59 (br s, 2H), 1,97-2,04 (br s, 2H), 1,92 (brs, 2H)
2	¹ H RMN (CDCl ₃) δ: 9,27 (d, J=2,2 Hz, 1H), 9,25 (s, 1H), 9,0 (s, 1H), 8,72 (d, J=4,9 Hz, 2H), 8,69 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,28-8,33 (m, 1H), 8,05 (d, J=24,1 Hz, 1H), 7,69 (d, J=6,8 Hz, 1H), 7,52 (m, 1H), 7,44 (dd, J=8,7, 6,9 Hz, 1H), 7,12 (t, J=4,9 Hz, 1H)
3	¹ H RMN (CDCl ₃) δ: 9,22 (s, 1H), 8,69 (d, J=3,8 Hz, 1H), 8,61 (s, 1H), 8,25-8,32 (m, 1H), 7,87 (d, J=8,8 Hz, 1H), 7,50 (dd, J=8,4, 4,7 Hz, 1H), 7,36 (dd, J=8,8, 6,8 Hz, 1H), 7,17 (d, J=6,8, 1H), 3,72-3,82 (m, 4H)
4	¹ H RMN (CDCl ₃) δ: 9,28 (d, J=2,5 Hz, 1H), 9,14 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,96-9,00 (m, 1H), 8,69 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,42 (dt, J=8,4, 0,9 Hz, 1H), 8,30-8,33 (m, 1H), 8,01 (dd, J=8,7, 0,7 Hz, 1H), 7,80 (dd, J=1,9, 1,1 Hz, 1H), 7,67 (d, J=6,9 Hz, 1H), 7,49-7,52 (m, 1H), 7,42 (dd, J=8,7, 6,9 Hz, 1H), 7,08-7,12 (m, 1H)
5	¹ H RMN (CDCl ₃) δ: 9,27 (d, J=2,5 Hz, 1H), 9,12 (d, J=0,8 Hz, 1H), 8,68 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,28-8,31 (m, 1H), 8,02-8,06 (br s, 1H), 8,00 (d, J=8,7 Hz, 1H), 7,69 (d, J=8,6 Hz, 2H), 7,57 (d, J=6,8 Hz, 1H), 7,48-7,52 (m, 1H), 7,42 (dd, J=8,5, 7,3 Hz, 3H), 7,21 (t, J=24,1 Hz, 1H)
6	¹ H RMN (CDCl ₃) δ: 9,26 (d, J=2,5 Hz, 1H), 9,07 (s, 1H), 8,68 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,29-8,34 (m, 1H), 7,95 (d, J=8,7 Hz, 1H), 7,49-7,54 (m, 2H), 7,35-7,41 (m, 1H), 7,10-7,16 (m, 1H), 4,55-4,66 (m, 1H), 1,52 (d, J=6,9 Hz, 3H), 1,39 (s, 9H)
7	¹ H RMN (acetona- <i>d</i> ₆) δ: 9,35 (d, J=2,2 Hz, 1H), 9,32 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,67 (d, J=9,8 Hz, 1H), 8,51-8,57 (m, 1H), 8,48 (d, J=14,3 Hz, 1H), 7,93 (d, J=14,7 Hz, 1H), 7,79 (d, J=7,4 Hz, 1H), 7,77 (d, J=6,5 Hz, 1H), 7,62-7,69 (m, 1H), 7,44 (dd, J=8,7, 6,9 Hz, 1H), 4,49-4,58 (m, 1H), 3,83-3,92 (m, 1H), 1,37 (d, J=7,3 Hz, 3H), 1,06-1,10 (m, 6H)
8	¹ H RMN (CDCl ₃) δ: 9,26 (d, J=2,2 Hz, 1H), 9,09 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,67 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,29 (ddd, J=8,3, 2,6, 1,4 Hz, 1H), 7,92 (dt, J=8,5, 0,9 Hz, 1H), 7,48 (m, 1H), 7,31-7,41 (m, 2H), 6,15 (s, 1H), 4,31-4,41 (m, 1H), 1,33 (d, J=6,6 Hz, 6H)
9	¹ H RMN (CDCl ₃) δ: 9,27 (d, J=10,1 Hz, 1H), 9,17 (s, 1H), 8,68 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,59-8,64 (m, 1H), 8,30-8,35 (m, 1H), 7,96 (d, J=8,7 Hz, 1H), 7,81 (br. s, 1H), 7,72 (t, J=18,8 Hz, 1H), 7,62 (d, J=6,9 Hz, 1H), 7,48-7,52 (m, 1H), 7,40 (dd, J=8,8, 6,9 Hz, 1H), 7,37 (d, J=7,9 Hz, 1H), 4,85 (d, J=4,9 Hz, 2H)
10	¹ H RMN (CDCl ₃) δ: 9,26 (d, J=2,5 Hz, 1H), 9,08 (d, J=0,8 Hz, 1H), 8,68 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,26-8,36 (m, 1H), 7,95 (d, J=8,7 Hz, 1H), 7,50 (dd, J=8,3, 4,8 Hz, 1H), 7,45 (d, J=6,6 Hz, 1H), 7,37 (dd, J=8,7, 6,9 Hz, 1H), 6,51 (br. s., 1H), 4,55 (t, J=5,2 Hz, 1H), 3,69 (t, J=5,5 Hz, 2H), 3,48 (s, 6H)

ES 2 707 398 T3

Comp. núm.	Datos de ^1H RMN ^a
11	^1H RMN (CDCl_3) δ : 9,25 (d, J=2,5 Hz, 1H), 9,12 (d, J=0,6 Hz, 1H), 8,66 (dd, J=4,7, 1,3 Hz, 1H), 8,30 (d, J=20,3 Hz, 1H), 7,94 (d, J=8,7 Hz, 1H), 7,76 (d, J=3,2 Hz, 1H), 7,54 (d, J=6,9 Hz, 1H), 7,44-7,51 (m, 2H), 7,34 (d, J=3,3 Hz, 2H), 5,03 (d, J=5,5 Hz, 2H)
12	^1H RMN (CDCl_3) δ : 9,26 (d, J=2,4 Hz, 1H), 9,09 (d, J=0,8 Hz, 1H), 8,67 (dd, J=4,7, 1,3 Hz, 1H), 8,26-8,35 (m, 1H), 7,94 (d, J=8,7 Hz, 1H), 7,47 (dd, J=42,1, 6,8 Hz, 2H), 7,37 (dd, J=32,6, 8,7 Hz, 1H), 6,82 (br. s, 1H), 4,09-4,19 (m, 1H), 3,78-3,99 (m, 3H), 3,35-3,46 (m, 1H), 2,03-2,15 (m, 1H), 1,96 (t, J=7,3 Hz, 2H), 1,66 (ddd, J=59,9, 12,3, 8,2 Hz, 1H)
13	^1H RMN (CDCl_3) δ : 9,26 (d, J=2,5 Hz, 1H), 9,10 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,68 (dd, J=4,7, 1,6 Hz, 1H), 8,26-8,33 (m, 1H), 7,95 (d, J=21,0 Hz, 1H), 7,45-7,54 (m, 2H), 7,37 (dd, J=8,7, 6,9 Hz, 1H), 6,83 (br. s, 1H), 3,75 (dd, J=39,1, 33,7 Hz, 2H), 2,83 (t, J=27,4 Hz, 2H), 2,18 (s, 3H)
14	^1H RMN (CDCl_3) δ : 9,26 (d, J=2,0 Hz, 1H), 9,12 (d, J=0,6 Hz, 1H), 8,67 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,29 (ddd, J=8,3, 2,6, 1,5 Hz, 1H), 7,93 (d, J=18,0 Hz, 1H), 7,50 (ddd, J=8,3, 4,8, 0,6 Hz, 1H), 7,29-7,38 (m, 2H), 6,50 (br. s., 1H), 2,91-3,02 (m, 1H), 0,93 (dd, J=32,8, 27,3 Hz, 2H), 0,69 (d, J=27,7 Hz, 2H)
15	^1H RMN (CDCl_3) δ : 9,21 (d, J=2,4 Hz, 1H), 8,67 (dd, J=4,8, 1,3 Hz, 1H), 8,57 (d, J=0,8 Hz, 1H), 8,27 (d, J=17,5 Hz, 1H), 7,84 (d, J=8,8 Hz, 1H), 7,49 (ddd, J=8,3, 4,8, 0,6 Hz, 1H), 7,35 (dd, J=27,1, 19,9 Hz, 1H), 7,15 (d, J=21,8 Hz, 1H), 3,49 (s, 5H), 1,47-1,71 (m, 5H)
16	^1H RMN (CDCl_3) δ : 9,26 (d, J=2,2 Hz, 1H), 9,09 (d, J=0,8 Hz, 1H), 8,68 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,27-8,32 (m, 1H), 7,93 (dt, J=8,0, 1,1 Hz, 1H), 7,49 (ddd, J=8,3, 4,8, 0,6 Hz, 1H), 7,33-7,40 (m, 2H), 6,15 (br s, 1H), 4,05 (dd, J=38,3, 8,0 Hz, 1H), 2,10 (dd, J=12,5, 3,5 Hz, 2H), 1,80 (dd, J=26,8, 13,9 Hz, 2H), 1,66-1,74 (m, 1H), 1,48 (dd, J=47,4, 13,6 Hz, 2H), 1,22-1,38 (m, 3H)
17	^1H RMN (CDCl_3) δ : 9,26 (d, J=2,4 Hz, 1H), 9,05 (d, J=0,8 Hz, 1H), 8,71 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,27-8,35 (m, 1H), 8,13 (dd, J=2,4, 0,9 Hz, 1H), 7,80 (d, J=8,7 Hz, 1H), 7,52 (ddd, J=8,2, 4,8, 0,7 Hz, 1H), 7,39 (dd, J=8,7, 7,3 Hz, 1H), 7,22-7,28 (m, 1H), 6,80 (d, J=2,5 Hz, 1H)
18	^1H RMN (CDCl_3) δ : 9,47 (d, J=0,9 Hz, 1H), 9,31 (d, J=2,5 Hz, 1H), 8,90 (d, J=4,9 Hz, 2H), 8,68 (d, J=20,8 Hz, 1H), 8,44 (d, J=19,4 Hz, 1H), 8,35-8,40 (m, 1H), 7,95 (d, J=27,0 Hz, 1H), 7,51 (t, J=16,6 Hz, 2H), 7,23 (t, J=4,8 Hz, 1H)
19	^1H RMN (CDCl_3) δ : 9,28 (d, J=19,9 Hz, 1H), 9,06 (d, J=0,8 Hz, 1H), 8,65-8,75 (m, 1H), 8,25-8,35 (m, 1H), 8,02 (d, J=27,4 Hz, 1H), 7,45-7,56 (m, 2H), 7,36-7,44 (m, 1H), 6,56 (br s, 1H), 4,16-4,28 (m, 2H)
20	^1H RMN (CDCl_3) δ : 10,44 (d, J=0,9 Hz, 1H), 9,43 (d, J=2,4 Hz, 1H), 9,02 (d, J=4,7 Hz, 2H), 8,67 (d, J=12,0 Hz, 1H), 8,50-8,53 (m, 1H), 8,48 (dd, J=7,7, 0,8 Hz, 1H), 8,09 (d, J=7,4 Hz, 1H), 8,00 (t, J=21,4 Hz, 1H), 8,01 (d, J=18,0 Hz, 1H), 7,76 (d, J=6,9 Hz, 1H), 7,50-7,55 (m, 1H), 7,44-7,49 (m, 1H), 7,39 (t, J=16,9 Hz, 1H)
21	^1H RMN ($\text{DMSO}-d_6$) δ : 9,39 (d, J=0,8 Hz, 1H), 9,36 (d, J=2,2 Hz, 1H), 9,14 (t, J=5,9 Hz, 1H), 8,79 (d, J=4,9 Hz, 2H), 8,67 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,50-8,57 (m, 1H), 7,96 (d, J=8,7 Hz, 1H), 7,80 (d, J=6,5 Hz, 1H), 7,64 (ddd, J=8,4, 4,7, 0,8 Hz, 1H), 7,47 (dd, J=8,8, 6,9 Hz, 1H), 7,41 (t, J=4,9 Hz, 1H), 4,76 (d, J=6,0 Hz, 2H)
22	^1H RMN (CDCl_3) δ : 9,26-9,33 (m, 1H), 9,23 (s, 1H), 8,62-8,76 (m, 2H), 8,40 (d, J=19,7 Hz, 1H), 8,32 (d, J=18,9 Hz, 1H), 7,90 (t, J=28,4 Hz, 1H), 7,77-7,85 (m, J=32,5 Hz, 2H), 7,65 (d, J=18,1 Hz, 1H), 7,50-7,59 (m, 1H), 7,45 (t, J=27,3 Hz, 1H), 7,37-7,41 (m, 1H)
23	^1H RMN (CDCl_3) δ : 9,27 (d, J=10,6 Hz, 1H), 9,23 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,66-8,72 (m, 2H), 8,39 (d, J=19,4 Hz, 1H), 8,33 (d, J=7,7 Hz, 1H), 7,89 (dd, J=13,6, 1,4 Hz, 1H), 7,83 (d, J=8,8 Hz, 1H), 7,79 (s, 1H), 7,63 (d, J=6,5 Hz, 1H), 7,51-7,56 (m, 1H), 7,45 (dd, J=15,8, 1,7 Hz, 1H), 7,36-7,41 (m, 1H)
24	^1H RMN (CDCl_3) δ : 9,41 (d, J=2,4 Hz, 1H), 9,26 (d, J=0,8 Hz, 1H), 8,69 (dd, J=4,7, 1,3 Hz, 1H), 8,51-8,58 (m, 1H), 8,24 (br s, 1H), 7,94 (d, J=8,7 Hz, 1H), 7,74 (d, J=6,9 Hz, 1H), 7,62-7,69 (m, 1H), 7,43 (dd, J=8,7, 6,9 Hz, 1H), 6,01-6,31 (m, J=112,9 Hz, 1H), 3,80-3,96 (m, 2H)

ES 2 707 398 T3

Comp. núm.	Datos de ^1H RMN ^a
25	^1H RMN (CDCl_3) δ : 9,20 (d, J=2,5 Hz, 1H), 8,68 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,54 (s, 1H), 8,27-8,32 (m, 1H), 7,93 (s, 1H), 7,79 (d, J=21,8 Hz, 1H), 7,48-7,54 (m, 2H), 3,69 (t, J=6,8 Hz, 2H), 3,52 (t, J=6,3 Hz, 2H), 1,95-2,03 (t, J=6,2 Hz, 2H), 1,91 (t, J=6,5 Hz, 2H)
26	^1H RMN (CDCl_3) δ : 9,22 (d, J=2,2 Hz, 1H), 8,79 (s, 1H), 8,72 (dd, J=9,8, 1,0 Hz, 1H), 8,69 (d, J=4,9 Hz, 2H), 8,63 (s, 1H), 8,46 (s, 1H), 8,29-8,34 (m, 1H), 7,88 (d, J=1,3 Hz, 2H), 7,51-7,56 (m, 1H), 7,08 (t, J=4,8 Hz, 1H)
27	^1H RMN (CDCl_3) δ : 9,21 (br s, 1H), 8,69 (d, J=4,1 Hz, 1H), 8,51 (s, 1H), 8,30 (d, J=22,1 Hz, 1H), 7,97 (d, J=1,7 Hz, 2H), 7,89 (d, J=9,3 Hz, 1H), 7,78-7,82 (m, 1H), 7,78-7,82 (m, 2H), 7,51 (dd, J=8,2, 4,7 Hz, 1H), 6,50 (t, J=9,1 Hz, 1H)
28	^1H RMN (CDCl_3) δ : 9,23 (d, J=2,4 Hz, 1H), 8,72 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,65 (s, 1H), 8,44 (t, J=1,3 Hz, 1H), 8,42 (d, J=10,9 Hz, 1H), 8,31-8,34 (m, 2H), 7,88-7,90 (m, 2H), 7,75-7,83 (m, 1H), 7,50-7,58 (m, 1H), 7,10 (ddd, J=7,3, 4,9, 1,0 Hz, 1H)
29	^1H RMN (CDCl_3) δ : 9,22 (d, J=2,2 Hz, 1H), 8,71 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,62 (s, 1H), 8,39 (s, 1H), 8,29-8,35 (m, 1H), 7,88 (d, J=0,8 Hz, 2H), 7,81 (d, J=15,9 Hz, 1H), 7,68 (d, J=18,1 Hz, 2H), 7,54 (dd, J=18,8, 8,4 Hz, 1H), 7,41 (t, J=8,4 Hz, 3H), 7,18 (t, J=20,3 Hz, 2H)
30	^1H RMN ($\text{DMSO}-d_6$) δ : 9,32 (d, J=2,5 Hz, 1H), 9,14 (s, 1H), 9,09 (s, 1H), 8,64 (d, J=7,7 Hz, 1H), 8,44-8,50 (m, 1H), 8,16 (d, J=11,5 Hz, 1H), 8,05 (s, 1H), 7,95 (d, J=10,4 Hz, 1H), 7,82 (t, J=24,7 Hz, 1H), 7,72 (d, J=10,7 Hz, 1H), 7,61-7,68 (m, 2H), 7,51 (d, J=20,2 Hz, 1H), 7,28 (d, J=13,9 Hz, 1H)
31	^1H RMN ($\text{DMSO}-d_6$) δ : 9,32 (d, J=2,4 Hz, 1H), 9,29-9,31 (m, 1H), 9,28-9,31 (m, 1H), 9,08 (s, 1H), 8,63 (dd, J=4,7, 1,3 Hz, 1H), 8,45-8,50 (m, 1H), 8,10 (s, 1H), 7,68 (d, J=9,3 Hz, 1H), 7,61-7,66 (m, 2H), 7,34-7,42 (m, 1H), 7,12 (br. s, 2H)
32	^1H RMN (CDCl_3) δ : 9,26 (d, J=2,5 Hz, 1H), 8,57 (s, 1H), 8,68 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,16 (s, 1H), 7,95 (d, J=8,7 Hz, 1H), 7,49-7,54 (m, 2H), 7,35-7,41 (m, 1H), 7,10-7,16 (m, 1H), 4,55-4,66 (m, 1H), 1,52 (d, J=6,9 Hz, 3H), 1,39 (s, 9H)
33	^1H RMN (CDCl_3) δ : 9,21 (br s, 1H), 8,70 (d, J=12,0 Hz, 1H), 8,53 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,27-8,33 (m, 1H), 7,85-7,88 (m, 1H), 7,81 (d, J=15,6 Hz, 1H), 7,50-7,55 (m, 1H), 7,40 (dd, J=9,0, 1,6 Hz, 1H), 3,03-3,23 (m, 6H)
34	^1H RMN (CDCl_3) δ : 9,21 (d, J=2,4 Hz, 1H), 8,71 (dd, J=4,8, 1,5 Hz, 1H), 8,60 (s, 1H), 8,32 (dd, J=1,7, 1,0 Hz, 1H), 8,29-8,32 (m, 1H), 8,02 (s, 1H), 7,85 (d, J=9,1 Hz, 1H), 7,72 (dd, J=9,1, 1,7 Hz, 1H), 7,51-7,55 (m, 1H), 6,47 (br s, 1H), 4,12-4,26 (m, 2H)
35	^1H RMN (CDCl_3) δ : 9,21 (br s, 1H), 8,70 (d, J=3,6 Hz, 1H), 8,57 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,28-8,33 (m, 1H), 8,26 (s, 1H), 7,81 (dt, J=9,1, 0,9 Hz, 1H), 7,69 (dd, J=9,1, 1,7 Hz, 1H), 7,49-7,56 (m, 1H), 5,98 (br s, 1H), 4,26-4,44 (m, 1H), 1,31 (d, J=6,6 Hz, 6H)
36	^1H RMN (CDCl_3) δ : 9,20 (d, J=2,4 Hz, 1H), 8,69 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,53 (s, 1H), 8,27-8,32 (m, 1H), 7,83 (dd, J=9,6, 3,3 Hz, 1H), 7,79-7,82 (m, 1H), 7,52 (dd, J=19,7, 4,1 Hz, 1H), 7,37 (dd, J=9,0, 1,6 Hz, 1H), 3,45-3,74 (m, 5H), 1,51-1,70 (m, 5H)
37	^1H RMN (acetona- d_6) δ : 9,35 (d, J=2,7 Hz, 1H), 9,15 (s, 1H), 8,68 (d, J=17,7 Hz, 1H), 8,47-8,52 (m, 1H), 8,36 (s, 1H), 7,84 (d, J=13,4 Hz, 1H), 7,74 (d, J=11,7 Hz, 1H), 7,61-7,68 (m, 1H), 2,93-3,00 (m, 1H), 0,71-0,80 (m, 2H), 0,61-0,68 (m, 2H)
38	^1H RMN (acetona- d_6) δ : 9,35 (d, J=2,5 Hz, 1H), 9,16 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,68 (dd, J=4,6, 1,4 Hz, 1H), 8,47-8,52 (m, 1H), 8,44 (dd, J=1,6, 0,9 Hz, 1H), 7,88 (dd, J=9,1, 1,6 Hz, 1H), 7,77 (d, J=9,0 Hz, 1H), 7,61-7,67 (m, 1H), 5,06 (s, 1H), 3,98-4,01 (m, 1H), (m, 2H), 2,8 (br s, 4H)
39	^1H RMN (CDCl_3) δ : 9,20 (d, J=2,7 Hz, 1H), 8,70 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,58 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,29-8,32 (m, 1H), 8,28 (dd, J=1,7, 1,0 Hz, 1H), 7,82 (dt, J=9,0, 0,9 Hz, 1H), 7,71 (dd, J=9,1, 1,7 Hz, 1H), 7,50-7,54 (m, 1H), 6,40-6,45 (m, 1H), 4,54 (t, J=5,2 Hz, 1H), 3,66 (t, J=5,5 Hz, 2H), 3,47 (s, 6H)

ES 2 707 398 T3

Comp. núm.	Datos de ¹ H RMN ^a
40	¹ H RMN (acetona- <i>d</i> ₆) δ: 9,36 (d, J=2,7 Hz, 1H), 9,19 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,68 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,61 (br s, 1H), 8,50-8,52 (m, 1H), 8,49 (dd, J=2,6, 1,5 Hz, 1H), 7,93 (dd, J=9,1, 1,6 Hz, 1H), 7,80 (dt, J=9,1, 0,9 Hz, 1H), 7,71 (d, J=3,3 Hz, 1H), 7,62-7,66 (m, 1H), 7,51 (d, J=3,2 Hz, 1H), 4,92 (d, J=6,0 Hz, 2H)
41	¹ H RMN (CDCl ₃) δ: 9,21 (br s, 1H), 8,70 (d, J=2,8 Hz, 1H), 8,57 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,31 (s, 1H), 8,28-8,30 (m, 2H), 7,82 (d, J=12,6 Hz, 1H), 7,73 (dd, J=9,1, 1,7 Hz, 1H), 7,52 (dd, J=8,2, 4,7 Hz, 1H), 6,61 (br s, 1H), 3,92 (dt, J=8,4, 6,7 Hz, 1H), 3,77-3,89 (m, 2H), 3,33-3,44 (m, 1H), 2,05 (d, J=43,0 Hz, 1H), 1,90-2,01 (m, 2H), 1,72-1,79 (m, 1H), 1,60-1,71 (m, 1H)
42	¹ H RMN (acetona- <i>d</i> ₆) δ: 9,60 (s, 1H), 9,36 (d, J=2,7 Hz, 1H), 9,20 (d, J=0,8 Hz, 1H), 8,69 (d, J=11,5 Hz, 1H), 8,48-8,52 (m, 1H), 8,47 (s, 1H), 8,26 (br s, 1H), 7,87 (d, J=16,6 Hz, 1H), 7,81 (d, J=16,6 Hz, 1H), 7,62-7,67 (m, 1H), 3,70 (s, 3H)
43	¹ H RMN (CDCl ₃) δ: 9,20 (d, J=2,5 Hz, 1H), 8,69 (dd, J=4,7, 1,3 Hz, 1H), 8,54 (s, 1H), 8,29 (ddd, J=8,3, 2,6, 1,6 Hz, 1H), 7,84-7,87 (m, 1H), 7,81 (d, J=9,0 Hz, 1H), 7,49-7,55 (m, 1H), 7,38 (dd, J=9,0, 1,6 Hz, 1H), 3,66 (br s, 4H), 2,46 (br. s, 4H), 2,35 (s, 3H)
44	¹ H RMN (CDCl ₃) δ: 9,20 (d, J=2,4 Hz, 1H), 8,69 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,55 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,29 (ddd, J=8,3, 2,7, 1,5 Hz, 1H), 7,86 (s, 1H), 7,82 (dt, J=8,9, 0,9 Hz, 1H), 7,47-7,55 (m, 1H), 7,37 (dd, J=9,0, 1,6 Hz, 1H), 3,84 (br s, 4H)
45	¹ H RMN (CDCl ₃) δ: 9,20 (d, J=2,4 Hz, 1H), 8,71 (dd, J=4,7, 1,3 Hz, 1H), 8,65 (s, 1H), 8,58 (d, J=0,8 Hz, 1H), 8,28-8,33 (m, 1H), 8,25 (s, 1H), 7,83 (d, J=9,0 Hz, 1H), 7,64 (dd, J=9,1, 1,5 Hz, 1H), 7,53 (dd, J=8,0, 4,7 Hz, 1H), 6,02-6,14 (m, 1H), 5,35-5,48 (m, 2H), 4,57 (d, J=6,3 Hz, 2H)
46	¹ H RMN (CDCl ₃) δ: 9,20 (d, J=2,4 Hz, 1H), 8,70 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,58 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,31 (dd, J=2,6, 1,5 Hz, 2H), 7,82 (d, J=15,8 Hz, 1H), 7,73 (dd, J=9,1, 1,6 Hz, 1H), 7,52 (ddd, J=8,2, 4,8, 0,7 Hz, 1H), 6,71 (br s, 1H), 3,65-3,76 (m, 2H), 2,84 (t, J=18,4 Hz, 2H), 2,62 (q, J=7,4 Hz, 2H), 1,31 (t, J=7,4 Hz, 3H)
47	¹ H RMN (CDCl ₃) δ: 9,17 (d, J=2,4 Hz, 1H), 8,79 (br s, 1H), 8,69 (d, J=18,1 Hz, 1H), 8,55 (s, 1H), 8,26-8,31 (m, 1H), 8,24 (s, 1H), 7,81 (d, J=13,2 Hz, 1H), 7,66 (d, J=21,6 Hz, 1H), 7,49-7,53 (m, 1H), 4,28-4,38 (m, 1H), 1,35 (d, J=6,3 Hz, 6H)
48	¹ H RMN (acetona- <i>d</i> ₆) δ: 9,32 (s, 1H), 9,07-9,17 (m, 1H), 8,64-8,70 (m, 1H), 8,55-8,61 (m, 1H), 8,41-8,50 (m, 1H), 8,13 (d, J=8,5 Hz, 3H), 7,88 (d, J=8,2 Hz, 1H), 7,73 (d, J=9,8 Hz, 1H), 7,59-7,67 (m, 3H)
49	¹ H RMN (CDCl ₃) δ: 9,21 (d, J=2,5 Hz, 1H), 8,70-8,75 (m, 1H), 8,62 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,27-8,36 (m, 2H), 7,86 (d, J=12,9 Hz, 1H), 7,69 (dd, J=9,1, 1,7 Hz, 1H), 7,52-7,54 (m, 1H), 6,46 (s, 1H), 4,45 (d, J=5,7 Hz, 2H)
50	¹ H RMN (CDCl ₃) δ: 9,20 (d, J=2,7 Hz, 1H), 8,69 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,55 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,30 (ddd, J=8,3, 2,7, 1,5 Hz, 1H), 7,79-7,88 (m, 2H), 7,51 (ddd, J=8,3, 4,7, 0,7 Hz, 1H), 7,35 (dd, J=8,9, 1,5 Hz, 1H), 4,00-4,18 (m, 1H), 2,93-3,10 (m, 2H), 2,30-2,44 (m, 1H), 2,10-2,19 (m, 1H), 1,80-1,92 (m, 1H), 1,71-1,80 (m, 1H), 1,51-1,71 (m, 1H), 0,90-1,04 (m, 1H)
51 (Referencia, no reivindicado)	¹ H RMN (CDCl ₃) δ: 9,20 (d, J=2,5 Hz, 1H), 8,70 (dd, J=4,7, 1,2 Hz, 1H), 8,58 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,27-8,34 (m, 2H), 7,83 (dt, J=9,1, 0,9 Hz, 1H), 7,71 (dd, J=9,1, 1,7 Hz, 1H), 7,52 (dd, J=8,2, 4,7 Hz, 1H), 6,46 (br s, 1H), 3,89-4,05 (m, 1H), 3,27-3,38 (m, 1H), 1,95-2,08 (m, 1H), 1,69 (s, 3H), 1,46-1,59 (m, 1H), 1,16-1,31 (m, 2H)
52	¹ H RMN (CDCl ₃) δ: 9,20 (d, J=2,4 Hz, 1H), 8,70 (dd, J=4,7, 1,3 Hz, 1H), 8,58 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,28-8,34 (m, 1H), 8,26 (s, 1H), 7,83 (d, J=9,1 Hz, 1H), 7,69 (d, J=1,6 Hz, 1H), 7,49-7,57 (m, 1H), 6,48 (br s, 1H), 3,78 (q, J=6,3 Hz, 2H), 2,44-2,59 (m, 2H)
53	¹ H RMN (CDCl ₃) δ: 9,19 (br s, 1H), 8,69 (d, J=4,1 Hz, 1H), 8,56 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,25-8,31 (m, 2H), 7,81 (d, J=18,4 Hz, 1H), 7,72 (dd, J=9,1, 1,7 Hz, 1H), 7,51 (dd, J=8,1, 4,7 Hz, 1H), 6,41 (br s, 1H), 3,36 (dd, J=7,1, 5,4 Hz, 2H), 1,05-1,17 (m, 1H), 0,58 (d, J=26,2 Hz, 2H), 0,31 (d, J=22,4 Hz, 2H)

ES 2 707 398 T3

Comp. núm.	Datos de ¹ H RMN ^a
54	¹ H RMN (acetona- <i>d</i> ₆) δ: 9,35 (d, J=2,7 Hz, 1H), 9,19 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,69 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,46-8,52 (m, 2H), 8,13 (br s, 1H), 7,90 (dd, J=9,1, 1,6 Hz, 1H), 7,79 (d, J=9,1 Hz, 1H), 7,61-7,68 (m, 1H), 3,83-3,95 (m, 2H), 1,68 (t, J=18,8 Hz, 3H)
55	¹ H RMN (acetona- <i>d</i> ₆) δ: 9,37 (d, J=4,7 Hz, 1H), 9,20 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,78 (d, J=4,9 Hz, 2H), 8,69 (dd, J=4,6, 1,3 Hz, 1H), 8,48-8,54 (m, 2H), 8,24 (br s, 1H), 7,94 (dd, J=9,1, 1,7 Hz, 1H), 7,81 (d, J=11,3 Hz, 1H), 7,62-7,69 (m, 1H), 7,38 (t, J=4,9 Hz, 2H), 4,84 (d, J=5,5 Hz, 3H)
56	¹ H RMN (CDCl ₃) δ: 9,21 (d, J=2,5 Hz, 1H), 8,70 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,60 (d, J=0,8 Hz, 1H), 8,35 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,30 (ddd, J=8,3, 2,6, 1,6 Hz, 1H), 7,84 (d, J=23,0 Hz, 1H), 7,79 (d, J=12,5 Hz, 1H), 7,57 (t, J=17,7 Hz, 1H), 7,49-7,54 (m, 1H), 7,43 (d, J=7,4 Hz, 1H), 7,32-7,39 (m, 2H), 4,78 (d, J=5,4 Hz, 2H)
57	¹ H RMN (CDCl ₃) δ: 9,35 (d, J=2,2 Hz, 1H), 9,16 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,68 (dd, J=4,6, 1,3 Hz, 1H), 8,45-8,54 (m, 1H), 8,37-8,43 (m, 1H), 7,93 (br s, 1H), 7,86 (dd, J=9,1, 1,6 Hz, 1H), 7,77 (d, J=18,6 Hz, 1H), 7,59-7,68 (m, 1H), 3,60-3,69 (m, 2H), 2,73-2,79 (m, 2H), 2,14-2,16 (m, 3H)
58	¹ H RMN (CDCl ₃) δ: 9,20 (d, J=2,5 Hz, 1H), 8,70 (d, J=3,5 Hz, 1H), 8,54 (d, J=0,8 Hz, 1H), 8,30 (d, J=9,5 Hz, 1H), 7,96 (br s, 1H), 7,82 (d, J=9,0 Hz, 1H), 7,52 (dd, J=8,1, 4,5 Hz, 2H), 4,77 (br s, 2H), 3,80 (br s, 2H), 3,38 (br s, 2H), 2,87 (br s, 2H), 2,17-2,31 (m, 2H), 1,21 (br s, 1H)
59	¹ H RMN (acetona- <i>d</i> ₆) δ: 9,35 (d, J=2,7 Hz, 1H), 9,16 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,68 (d, J=3,3 Hz, 1H), 8,46-8,51 (m, 1H), 8,40 (s, 1H), 7,90 (br s, 1H), 7,86 (dd, J=9,1, 1,7 Hz, 1H), 7,76 (dt, J=9,1, 1,0 Hz, 1H), 7,61-7,66 (m, 2H), 7,17 (t, J=1,3 Hz, 1H), 6,93 (t, J=1,0 Hz, 1H), 4,18 (t, J=6,9 Hz, 2H), 3,47 (dd, J=19,2, 5,8 Hz, 2H), 2,14 (t, J=6,9 Hz, 2H)
60	¹ H RMN (CDCl ₃) δ: 9,20 (d, J=2,2 Hz, 1H), 8,70 (dd, J=4,8, 1,5 Hz, 1H), 8,57 (d, J=0,8 Hz, 1H), 8,27-8,34 (m, 2H), 7,82 (dt, J=9,1, 0,9 Hz, 1H), 7,72 (dd, J=9,1, 1,6 Hz, 1H), 7,52 (ddd, J=8,2, 4,7, 0,6 Hz, 1H), 7,41 (dd, J=1,8, 0,9 Hz, 1H), 6,49 (br s, 1H), 6,36 (ddd, J=14,0, 3,2, 1,3 Hz, 2H), 4,69 (d, J=5,4 Hz, 2H)
61	¹ H RMN (CDCl ₃) δ: 9,21 (d, J=2,2 Hz, 1H), 8,67 (dd, J=4,6, 1,0 Hz, 1H), 8,54 (s, 1H), 8,26-8,33 (m, 1H), 7,80 (d, J=9,0 Hz, 1H), 7,75 (s, 1H), 7,50 (dd, J=8,2, 4,7 Hz, 1H), 7,31 (dd, J=8,9, 1,3 Hz, 1H), 4,03-4,18 (m, 1H), 3,98-4,24 (m, 1H), 3,47 (br s, 3H), 2,15 (br s, 1H), 1,77 (br s, 4H), 1,47-1,69 (m, 4H), 1,21-1,36 (m, J=7,1 Hz, 3H), 1,05 (br s, 3H), 0,93 (s, 1H)
62	¹ H RMN (CDCl ₃) δ: 9,20 (d, J=2,4 Hz, 1H), 8,71 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,59 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,28-8,33 (m, 1H), 8,10-8,15 (m, 1H), 7,84 (dt, J=9,1, 0,9 Hz, 1H), 7,60 (dd, J=9,0, 1,6 Hz, 1H), 7,53 (ddd, J=8,4, 4,7, 0,6 Hz, 1H), 4,59 (t, J=12,1 Hz, 4H)
63	¹ H RMN (CDCl ₃) δ: 9,21 (d, J=2,5 Hz, 1H), 8,70 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,59 (d, J=0,8 Hz, 1H), 8,26-8,35 (m, 2H), 7,83 (d, J=9,0 Hz, 1H), 7,75 (dd, J=9,1, 1,7 Hz, 1H), 7,45-7,58 (m, 1H), 4,83 (dd, J=8,7, 4,9 Hz, 1H), 3,80 (s, 3H), 3,48 (q, J=6,9 Hz, 6H), 2,32 (d, J=5,0 Hz, 1H)
64	¹ H RMN (CDCl ₃) δ: 9,20 (d, J=2,5 Hz, 1H), 8,70 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,56 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,30 (ddd, J=8,3, 2,7, 1,5 Hz, 1H), 7,89 (s, 1H), 7,84 (d, J=9,0 Hz, 1H), 7,48-7,57 (m, 1H), 7,39 (d, J=8,7 Hz, 1H), 3,20 (s, 3H), 1,60 (s, 2H), 1,55-1,68 (m, 2H)
65	¹ H RMN (CDCl ₃) δ: 9,20 (d, J=2,4 Hz, 1H), 8,70 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,58 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,26-8,36 (m, 2H), 7,82 (dt, J=9,1, 0,9 Hz, 1H), 7,71 (dd, J=9,1, 1,7 Hz, 1H), 7,52 (ddd, J=8,3, 4,7, 0,7 Hz, 1H), 7,27 (d, J=16,9 Hz, 3H), 7,09 (dd, J=3,5, 1,1 Hz, 1H), 7,00 (dd, J=5,2, 3,5 Hz, 1H), 6,47 (br s, 1H), 4,80-4,97 (m, 2H)
66	¹ H RMN (CDCl ₃) δ: 9,19 (d, J=2,5 Hz, 1H), 8,70 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,61 (d, J=3,3 Hz, 1H), 8,55 (d, J=0,8 Hz, 2H), 8,26-8,31 (m, 1H), 7,92-7,97 (m, 1H), 7,85 (d, J=9,0 Hz, 1H), 7,56-7,64 (m, 1H), 7,49-7,55 (m, 1H), 7,43 (dd, J=9,0, 1,3 Hz, 1H), 7,34 (d, J=4,7 Hz, 1H), 4,84 (s, 2H), 3,68 (s, 1H), 2,80 (br s, 2H), 1,74 (br s, 2H)
67	¹ H RMN (CDCl ₃) δ: 9,20 (d, J=2,2 Hz, 3H), 8,69 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,53 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,27-8,34 (m, 1H), 7,95 (s, 1H), 7,77 (d, J=9,1 Hz, 1H), 7,52 (s, 2H), 3,14 (s, 3H), 2,83-2,96 (m, 1H), 0,46-0,44 (m, 4H)

ES 2 707 398 T3

Comp. núm.	Datos de ¹ H RMN ^a
68	¹ H RMN (CDCl ₃) δ: 9,20 (d, J=2,5 Hz, 1H), 8,69 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,57 (d, J=0,8 Hz, 1H), 8,28-8,33 (m, 1H), 8,27 (s, 1H), 7,82 (d, J=9,1 Hz, 1H), 7,71 (dd, J=9,1, 1,6 Hz, 1H), 7,51 (dd, J=8,2, 4,7 Hz, 1H), 6,45 (d, J=7,6 Hz, 1H), 4,36-4,49 (m, 1H), 3,45-3,60 (m, 2H), 3,42 (s, 3H), 1,34 (d, J=6,8 Hz, 3H)
69	¹ H RMN (CDCl ₃) δ: 9,21 (d, J=2,4 Hz, 1H), 8,70 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,58 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,28-8,34 (m, 1H), 8,03-8,09 (m, 1H), 7,85 (dt, J=9,0, 0,9 Hz, 1H), 7,49-7,57 (m, 2H), 4,40 (br s, 4H), 2,33-2,45 (m, 2H), 1,65 (br s, 1H), 1,61-1,71 (m, 2H)
70	¹ H RMN (CDCl ₃) δ: 9,20 (d, J=2,5 Hz, 1H), 8,69 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,58 (s, 1H), 8,25-8,41 (m, 2H), 7,81 (d, J=9,1 Hz, 1H), 7,69-7,78 (m, 1H), 7,51 (ddd, J=8,3, 4,8, 0,6 Hz, 1H), 3,52 (br s, 1H), 3,14 (br s, 1H), 2,79 (br s, 2H), 1,63-1,91 (m, 2H), 1,11 (br s, 8H)
71	¹ H RMN (CDCl ₃) δ: 9,20 (d, J=2,2 Hz, 1H), 8,70 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,58 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,32 (dd, J=1,6, 0,9 Hz, 1H), 8,28-8,31 (m, J=5,7 Hz, 1H), 7,83 (dt, J=9,1, 0,9 Hz, 1H), 7,73 (dd, J=7,4, 1,6 Hz, 1H), 7,49-7,55 (m, 1H), 7,37-7,44 (m, J=8,0 Hz, 1H), 7,34 (d, J=7,7 Hz, 1H), 7,24 (s, 1H), 7,17 (d, J=8,2 Hz, 1H), 6,55 (br s, 1H)
72	¹ H RMN (CDCl ₃) δ: 9,20 (d, J=2,4 Hz, 1H), 8,70 (d, J=3,3 Hz, 1H), 8,56 (d, J=0,8 Hz, 1H), 8,28-8,34 (m, 1H), 7,88 (s, 1H), 7,84 (d, J=8,8 Hz, 1H), 7,49-7,56 (m, 1H), 7,38 (d, J=7,4 Hz, 1H), 3,53-3,96 (m, 8H), 1,70-1,79 (m, 1H), 1,03 (dd, J=4,7, 2,9 Hz, 2H), 0,82 (dd, J=7,6, 2,9 Hz, 2H)
73	¹ H RMN (CDCl ₃) δ: 9,21 (d, J=2,4 Hz, 1H), 8,71 (d, J=3,5 Hz, 1H), 8,59 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,28-8,34 (m, 2H), 7,83 (d, J=9,1 Hz, 1H), 7,72 (d, J=7,4 Hz, 1H), 7,50-7,56 (m, 1H), 6,56 (br s, 1H), 4,32-4,51 (m, 1H), 4,05-4,19 (m, 1H), 3,68-3,89 (m, 2H), 3,51-3,62 (m, 1H), 1,32-1,72 (m, 9H)
74	¹ H RMN (CDCl ₃) δ: 9,21 (d, J=2,4 Hz, 1H), 8,72 (dd, J=4,8, 1,5 Hz, 1H), 8,62 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,28-8,33 (m, 1H), 8,06 (t, J=1,2 Hz, 1H), 7,88 (d, J=9,0 Hz, 1H), 7,55 (s, 1H), 7,52-7,54 (m, 1H), 7,47 (br s, 1H), 3,71 (s, 2H), 1,70-1,87 (m, 1H), 1,41 (s, 6H)
75	¹ H RMN (CDCl ₃) δ: 9,20 (d, J=2,4 Hz, 1H), 8,70 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,55 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,30 (ddd, J=8,3, 2,6, 1,4 Hz, 1H), 7,83 (d, J=9,8 Hz, 2H), 7,49-7,56 (m, 1H), 7,34 (d, J=10,6 Hz, 1H), 3,53-4,15 (m, 4H), 2,44-3,03 (m, 4H)
76	¹ H RMN (CDCl ₃) δ: 9,20 (d, J=2,2 Hz, 1H), 8,70 (dd, J=4,8, 1,5 Hz, 1H), 8,58-8,62 (m, 2H), 8,43 (d, J=0,8 Hz, 1H), 8,36 (t, J=1,3 Hz, 1H), 8,27-8,33 (m, 1H), 7,83 (d, J=9,3 Hz, 1H), 7,78 (d, J=7,6 Hz, 1H), 7,53 (dd, J=4,7, 0,8 Hz, 1H), 7,29-7,40 (m, 1H), 4,82 (d, J=5,0 Hz, 2H), 2,59 (s, 3H)
84 (Referencia, no reivindicado)	¹ H RMN (CDCl ₃) δ: 9,39 (d, J=1,7 Hz, 1H), 8,74 (d, J=3,3 Hz, 1H), 8,40-8,47 (dt, 1H), 8,26 (dd, J=8,0, 0,9 Hz, 1H), 7,71 (dd, J=7,6, 0,9 Hz, 1H), 7,58-7,64 (t, 1H), 7,47 (dd, J=7,2, 5,0 Hz, 1H), 6,94 (br t, 1H), 3,75-3,82 (q, 2H), 2,80-2,88 (t, 2H), 2,18 (s, 3H)
127 (Referencia, no reivindicado)	¹ H RMN (CDCl ₃) δ: 9,13 (br s, 1H), 8,64 (br s, 1H), 8,49 (d, J=1,7 Hz, 1H), 8,14-8,20 (m, 2H), 7,92 (dd, J=8,5, 1,7 Hz, 1H), 6,43 (br t, J=6,6 Hz, 1H), 4,20 (qd, J=9,0, 6,5 Hz, 2H)
129	¹ H RMN (CDCl ₃) δ: 9,49 (s, 1H), 9,19 (s, 1H), 9,13 (s, 1H), 8,80 (d, J=4,7 Hz, 2H), 8,73 (s, 1H), 8,60-8,67 (m, 1H), 8,19 (d, J=8,5 Hz, 1H), 7,84 (br s, 1H), 7,29-7,36 (m, J=9,6 Hz, 1H), 5,00 (d, J=4,3 Hz, 2H)
131	¹ H RMN (CDCl ₃) δ: 9,03 (s, 1H), 8,60 (d, J=0,6 Hz, 1H), 8,56 (d, J=2,4 Hz, 1H), 8,27 (s, 1H), 8,13 (d, J=9,1 Hz, 1H), 7,79 (d, J=9,0 Hz, 1H), 7,73 (d, J=7,6 Hz, 1H), 6,64 (br s, 1H), 4,06-4,22 (m, 1H), 3,92 (dt, J=8,3, 6,7 Hz, 1H), 3,76-3,88 (m, 2H), 3,37 (ddd, J=13,8, 7,6, 4,6 Hz, 1H), 2,03-2,13 (m, 1H), 1,91-2,00 (m, 2H), 1,81 (br s, 1H), 1,65 (dd, J=12,2, 8,1 Hz, 1H)
132	¹ H RMN (CDCl ₃) δ: 9,03 (d, J=1,9 Hz, 1H), 8,61 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,57 (d, J=2,4 Hz, 1H), 8,27-8,32 (m, J=1,6, 0,9 Hz, 1H), 8,11-8,16 (m, 1H), 7,82 (d, J=9,3 Hz, 1H), 7,74 (dd, J=7,3, 1,7 Hz, 1H), 6,50 (br s, 1H), 3,92 (td, J=13,7, 6,3 Hz, 2H), 1,66-1,79 (m, 3H), 1,71 (t, J=18,6 Hz, 4H)

ES 2 707 398 T3

Comp. núm.	Datos de ¹ H RMN ^a
133	¹ H RMN (CDCl ₃) δ: 9,03 (s, 1H), 8,60 (d, J=0,8 Hz, 1H), 8,56 (d, J=2,5 Hz, 1H), 8,27 (s, 1H), 8,13 (d, J=9,0 Hz, 1H), 7,80 (d, J=9,1 Hz, 1H), 7,72 (dd, J=9,1, 1,6 Hz, 1H), 6,50 (t, J=5,3 Hz, 1H), 4,54 (t, J=5,2 Hz, 1H), 3,66 (t, J=5,5 Hz, 2H), 3,47 (s, 6H)
134	¹ H RMN (DMSO- <i>d</i> ₆) δ: 9,41 (d, J=0,8 Hz, 1H), 9,37 (d, J=2,4 Hz, 1H), 9,01 (s, 1H), 8,66-8,72 (m, 1H), 8,50-8,57 (m, 1H), 8,44 (s, 1H), 7,85 (d, J=4,4 Hz, 2H), 7,78 (d, J=9,3 Hz, 1H), 7,65 (s, 2H), 7,21 (d, J=4,4 Hz, 1H), 4,49 (d, J=5,5 Hz, 2H)
135	¹ H RMN (acetona- <i>d</i> ₆) δ: 10,24 (br s, 1H), 9,13 (d, J=2,5 Hz, 1H), 8,86 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,51 (br. s, 1H), 8,29-8,39 (m, 2H), 8,00 (dd, J=8,4, 1,0 Hz, 1H), 7,76 (ddd, J=8,2, 4,7, 0,8 Hz, 1H), 7,45 (t, J=7,5 Hz, 1H), 3,69 (br s, 3H)
136	¹ H RMN (acetona- <i>d</i> ₆) δ: 9,25 (br s, 1H), 9,11 (d, J=2,2 Hz, 1H), 8,86 (d, J=5,4 Hz, 1H), 8,29-8,39 (m, 2H), 7,99 (d, J=8,3 Hz, 1H), 7,77 (ddd, J=8,2, 4,8, 0,7 Hz, 1H), 7,46 (t, J=7,8 Hz, 1H), 4,36 (qd, J=9,5, 6,5 Hz, 2H)
137	¹ H RMN (acetona- <i>d</i> ₆) δ: 10,06 (br s, 1H), 9,34 (d, J=2,5 Hz, 1H), 8,76-8,88 (m, 3H), 8,44-8,55 (m, 1H), 8,30 (dd, J=6,9, 1,1 Hz, 1H), 7,94 (dd, J=8,5, 1,1 Hz, 1H), 7,79 (ddd, J=8,2, 4,8, 0,8 Hz, 1H), 7,42-7,45 (m, 1H), 7,41 (s, 1H), 4,93 (d, J=4,7 Hz, 2H)
142	¹ H RMN (CDCl ₃) δ: 9,20 (d, J=2,2 Hz, 1H), 9,14 (br s, 1H), 8,73 (d, J=5,2 Hz, 1H), 8,57 (s, 1H), 8,35 (d, J=7,1 Hz, 1H), 8,20 (d, J=8,3 Hz, 1H), 7,88 (d, J=8,2 Hz, 1H), 7,56 (ddd, J=8,2, 4,8, 0,7 Hz, 1H), 7,30 (t, J=7,7 Hz, 1H), 3,08 (td, J=7,3, 3,5 Hz, 1H), 0,87-1,01 (m, 2H), 0,65-0,80 (m, 2H), 0,01 (br s, 1H), -0,01 (br s, 1H)
300	¹ H RMN (acetona- <i>d</i> ₆) δ: 9,29-9,37 (m, 1H), 8,79 (d, J=4,9 Hz, 2H), 8,62 (d, J=2,5 Hz, 1H), 8,47 (d, J=9,5 Hz, 1H), 7,93 (d, J=8,6 Hz, 1H), 7,81 (dd, J=6,9, 0,6 Hz, 1H), 7,48 (dd, J=8,7, 6,9 Hz, 1H), 7,31-7,43 (m, 1H), 4,87 (d, J=5,5 Hz, 2H)
303	¹ H RMN (CDCl ₃) δ: 9,31 (d, J=2,7 Hz, 1H), 9,13 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,83 (s, 1H), 8,70 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,26-8,46 (m, 1H), 8,09 (dd, J=6,9, 0,8 Hz, 1H), 7,99 (d, J=8,7 Hz, 1H), 7,38-7,59 (m, 2H),
304	¹ H RMN (CDCl ₃) δ: 9,33 (s, 1H), 9,29 (d, J=2,2 Hz, 1H), 9,07 (s, 1H), 8,69 (d, J=4,7 Hz, 1H), 8,35 (dd, J=8,4, 1,6 Hz, 1H), 8,05 (s, 2H), 7,94 (d, J=8,5 Hz, 1H), 7,71 (d, J=6,9 Hz, 1H), 7,44-7,61 (m, 2H)
305	¹ H RMN (CDCl ₃) δ: 9,27 (d, J=2,4 Hz, 1H), 9,08-9,14 (m, 1H), 8,68 (dd, J=4,7, 1,3 Hz, 1H), 8,61 (s, 1H), 8,44 (s, 1H), 8,21-8,38 (m, 1H), 7,97 (d, J=8,7 Hz, 1H), 7,45-7,59 (m, 2H), 7,40 (dd, J=8,7, 6,9 Hz, 2H), 4,85 (d, J=5,0 Hz, 3H) 2,53-2,67 (s, 3H)
306	¹ H RMN (CDCl ₃) δ: 9,08 (br s, 1H), 8,41 (br s, 1H), 7,85 (d, J=7,6 Hz, 3H), 7,58 (br s, 2H), 7,34 (br s, 1H), 6,94 (br s, 2H), 4,64 (br s, 1H), 3,56-3,74 (m, 3H), 2,25 (br s, 2H), 1,80 (br s, 2H), 1,73 (s, 1H), 1,70 (s, 1H), 1,50 (s, 1H), 1,40 (br s, 1H)
307	¹ H RMN (CDCl ₃) δ: 9,05-9,15 (m, 2H), 8,56 (d, J=2,5 Hz, 1H), 8,13 (dt, J=9,1, 2,3 Hz, 1H), 7,90-8,06 (m, 1H), 7,49 (d, J=6,5 Hz, 1H), 7,41 (dd, J=8,7, 6,9 Hz, 1H), 6,50 (br s, 1H), 4,21 (qd, J=9,0, 6,5 Hz, 2H)
308	¹ H RMN (CDCl ₃) δ: 9,04-9,15 (m, 2H), 8,54 (d, J=2,5 Hz, 1H), 8,13 (dt, J=9,1, 2,3 Hz, 1H), 7,92 (d, J=8,7 Hz, 1H), 7,46 (d, J=6,5 Hz, 1H), 7,38 (dd, J=8,7, 6,9 Hz, 1H), 6,69 (br s, 1H), 4,13 (qd, J=7,2, 3,2 Hz, 1H), 3,76-3,96 (m, 3H), 3,40 (ddd, J=13,8, 7,7, 4,7 Hz, 1H), 2,02-2,18 (m, 1H), 1,90-2,02 (m, 2H), 1,51-1,71 (m, 2H)
309	¹ H RMN (CDCl ₃) δ: 9,13 (s, 1H), 9,09 (s, 1H), 8,54 (d, J=2,2 Hz, 1H), 8,13 (dt, J=9,1, 2,3 Hz, 1H), 7,92 (ddd, J=7,2, 2,3, 0,9 Hz, 1H), 7,32-7,43 (m, 2H), 6,08 (d, J=6,5 Hz, 1H), 4,36 (dt, J=7,7, 6,6 Hz, 1H), 1,33 (d, J=6,5 Hz, 5H)
315	¹ H RMN (acetona- <i>d</i> ₆) δ: 9,61 (br s, 1H), 9,38 (d, J=6,1 Hz, 1H), 9,22 (s, 1H), 8,70 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,46-8,56 (m, 2H), 8,28 (br. S, 1H), 7,80-7,97 (m, 2H), 7,66 (ddd, J=8,4, 4,7, 0,6 Hz, 1H), 3,71 (s, 3H)

ES 2 707 398 T3

Comp. núm.	Datos de ^1H RMN ^a
316	^1H RMN (CDCl_3) δ : 9,10 (br s, 1H), 8,40 (br s, 1H), 7,75 (br s, 2H), 7,58 (br s, 1H), 7,31 (d, J=9,3 Hz, 1H), 6,94 (br s, 1H), 1,77 (br s, 1H), 1,08 (br s, 2H), 0,84 (br s, 2H)
320	^1H RMN (acetona- d_6) δ : 9,38 (d, J=2,4 Hz, 1H), 9,18 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,95-9,07 (m, 1H), 8,89 (d, J=5,1 Hz, 2H), 8,68 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,51 (d, J=8,9 Hz, 2H), 7,83 (d, J=9,1 Hz, 1H), 7,65 (ddd, J=8,3, 4,7, 0,7 Hz, 1H), 7,37 (t, J=4,8 Hz, 1H)
321	^1H RMN (CDCl_3) δ : 9,37 (d, J=2,5 Hz, 1H), 9,18 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,69 (dd, J=4,6, 1,3 Hz, 1H), 8,44-8,57 (m, 2H), 8,02-8,09 (m, 1H), 7,77-7,96 (m, 1H), 7,65 (dd, J=8,4, 4,7 Hz, 1H), 7,32 (d, J=0,8 Hz, 1H)
322	^1H RMN (CDCl_3) δ : 9,49 (d, J=2,0 Hz, 1H), 9,24 (d, J=2,5 Hz, 1H), 8,87 (dd, J=4,8, 1,5 Hz, 1H), 8,66-8,74 (m, 1H), 8,64 (s, 1H), 8,52 (dt, J=8,0, 1,9 Hz, 1H), 8,23-8,42 (m, 1H), 8,13 (dd, J=9,2, 1,5 Hz, 1H), 7,92 (d, J=9,1 Hz, 1H), 7,40-7,57 (m, 2H)
323	^1H RMN (acetona- d_6) δ : 9,35 (d, J=2,7 Hz, 1H), 9,15 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,68 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,49 (ddd, J=8,4, 2,7, 1,4 Hz, 1H), 8,40-8,46 (m, 1H), 7,88 (dd, J=9,1, 1,7 Hz, 2H), 7,76 (dt, J=9,1, 0,9 Hz, 1H), 7,64 (ddd, J=8,3, 4,7, 0,7 Hz, 1H), 3,72 (t, J=5,6 Hz, 2H), 3,55 (q, J=5,7 Hz, 2H)
324	^1H RMN (acetona- d_6) δ : 9,10 (s, 1H), 8,45 (s, 2H), 8,09-8,15 (m, 3H), 7,75-7,85 (m, 3H), 7,62 (t, J=7,7 Hz, 3H), 7,49 (t, J=7,5 Hz, 2H)
325	^1H RMN (CDCl_3) δ : 9,22 (s, 1H), 8,93 (dd, J=7,1 Hz, 1H), 8,69 (d, J=5,1 Hz, 1H), 8,62 (d, J=5,2 Hz, 1H), 8,55 (s, 1H), 8,32 (d, J=8,2 Hz, 1H), 7,89-7,97 (m, 3H), 7,60 (d, J=8,8 Hz, 1H), 7,52 (ddd, J=8,3, 4,8, 0,6 Hz, 1H), 7,40 (ddd, J=7,9, 4,8, 0,9 Hz, 1H)
326	^1H RMN (acetona- d_6) δ : 9,37 (d, J=2,4 Hz, 1H), 9,19 (s, 1H), 8,77 (dd, J=1,7, 0,9 Hz, 1H), 8,69 (d, J=5,1 Hz, 1H), 8,63 (d, J=5,0 Hz, 1H), 8,51 (d, J=8,2 Hz, 1H), 8,21 (dd, J=5,0 Hz, 1H), 7,87 (dt, J=9,3, 0,9 Hz, 1H), 7,75 (d, J=5,5 Hz, 1H), 7,65 (ddd, J=8,3, 4,7, 0,7 Hz, 1H), 2,65 (s, 3H)
327	^1H RMN (acetona- d_6) δ : 9,37 (d, J=6,3 Hz, 1H), 9,21 (s, 1H), 8,78-8,85 (m, 1H), 8,69 (dd, J=7,5 Hz, 1H), 8,51 (d, J=8,2 Hz, 1H), 8,18 (d, J=9,0 Hz, 1H), 7,82-7,92 (m, 2H), 7,65 (dd, J=8,2, 4,7 Hz, 1H), 4,16-4,28 (m, 2H), 4,12 (s, 2H), 1,22-1,31 (m, 3H)
328	^1H RMN (acetona- d_6) δ : 9,36 (d, J=2,5 Hz, 1H), 9,19 (s, 1H), 8,69 (dd, J=4,7, 1,3 Hz, 1H), 8,50 (d, J=8,3 Hz, 1H), 8,46 (s, 1H), 8,11-8,19 (m, 1H), 7,88 (d, J=8,8 Hz, 1H), 7,79 (d, J=9,1 Hz, 1H), 7,64 (t, J=6,8 Hz, 1H), 4,18 (d, J=6,0 Hz, 2H), 3,70-3,74 (m, 3H)
340	^1H RMN (acetona- d_6) δ : 9,38 (d, J=2,5 Hz, 1H), 9,25 (s, 1H), 9,00 (s, 1H), 8,65-8,84 (m, 1H), 8,58 (s, 1H), 8,38-8,56 (m, 1H), 8,05 (dd, J=9,1, 1,6 Hz, 1H), 7,94 (d, J=9,1 Hz, 1H), 7,67 (dd, J=8,3, 4,7 Hz, 1H)
341	^1H RMN (acetona- d_6) δ : 9,37 (d, J=2,2 Hz, 1H), 9,19 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,76 (dd, J=1,7, 0,9 Hz, 1H), 8,69 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,62 (d, J=5,4 Hz, 1H), 8,51 (ddd, J=8,3, 2,7, 1,5 Hz, 1H), 8,19 (dd, J=9,2, 1,7 Hz, 1H), 7,86 (dt, J=9,1, 0,9 Hz, 1H), 7,77 (d, J=5,4 Hz, 1H), 7,64 (ddd, J=8,3, 4,7, 0,7 Hz, 1H), 4,14-4,26 (m, 1H), 4,20 (d, J=7,1 Hz, 2H), 4,10 (s, 2H), 1,20-1,27 (m, 3H)
342	^1H RMN (acetona- d_6) δ : 9,36 (d, J=2,7 Hz, 1H), 9,20 (s, 1H), 8,69 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,43-8,59 (m, 2H), 7,86 (d, J=9,0 Hz, 1H), 7,80 (d, J=9,0 Hz, 1H), 7,58-7,72 (m, 1H), 2,01-2,09 (m, 10H)
347	^1H RMN (acetona- d_6) δ : 9,38 (br s, 2H), 9,17 (br s, 1H), 8,70 (br s, 1H), 8,54 (d, J=8,0 Hz, 1H), 8,26 (s, 1H), 7,94 (dd, J=9,1, 1,4 Hz, 2H), 7,76-7,90 (m, 2H), 7,61-7,76 (m, 3H), 6,97-7,16 (m, 2H), 6,75-6,97 (m, 3H), 4,32 (qd, J=7,0, 4,5 Hz, 1H), 3,98-4,19 (m, 2H), 3,70-3,91 (m, 2H), 1,82-2,00 (m, 3H), 1,73 (ddt, 3H)
348	^1H RMN (CDCl_3) δ : 9,22 (d, J=2,4 Hz, 1H), 8,97 (s, 1H), 8,70 (d, J=3,8 Hz, 1H), 8,59 (s, 1H), 8,48 (s, 1H), 8,23-8,41 (m, 1H), 7,96-8,12 (m, 2H), 7,85-7,96 (m, 2H), 7,52 (dd, J=8,2, 4,7 Hz, 1H), 7,26 (s, 1H)
349	^1H RMN ($\text{DMSO}-d_6$) δ : 9,34 (d, J=2,4 Hz, 1H), 9,13 (d, J=6,9 Hz, 1H), 8,64 (d, J=5,3 Hz, 1H), 8,46-8,55 (m, 1H), 8,17 (d, J=6,6 Hz, 1H), 7,72 (dd, J=8,7, 1,0 Hz, 1H), 7,60-7,67 (m, 2H), 1,60 (s, 3H)

ES 2 707 398 T3

Comp. núm.	Datos de ^1H RMN ^a
355	^1H RMN (CDCl_3) δ : 9,21 (d, J=2,2 Hz, 1H), 8,70 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,59 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,34 (s, 1H), 8,30 (d, J=8,1 Hz, 1H), 7,80-7,91 (m, 1H), 7,76 (dd, J=8,8 Hz, 1H), 7,52 (ddd, J=8,2, 4,8, 0,7 Hz, 1H), 7,11 (br. s, 1H), 4,43-4,50 (m, 2H), 4,23-4,35 (m, 2H), 3,41 (t, J=8,4 Hz, 2H)
356	^1H RMN (acetona- d_6) δ : 9,47 (br s, 1H), 9,35 (d, J=2,7 Hz, 1H), 8,97 (s, 1H), 8,65 (d, J=5,0 Hz, 1H), 8,41-8,54 (m, 2H), 7,78 (s, 1H), 7,72 (d, J=9,1 Hz, 1H), 7,59-7,67 (m, 2H), 7,24 (d, J=3,5 Hz, 1H), 6,67 (dd, J=2,1 Hz, 1H)
357	^1H RMN (acetona- d_6) δ : 9,43 (br s, 1H), 9,32 (d, J=2,5 Hz, 1H), 8,93 (d, J=0,8 Hz, 1H), 8,64 (dd, J=4,7, 1,3 Hz, 1H), 8,45 (ddd, J=8,4, 2,7, 1,4 Hz, 1H), 8,34 (d, J=1,3 Hz, 1H), 7,67 (d, J=9,0 Hz, 1H), 7,59-7,63 (m, 1H), 7,49 (d, J=7,4 Hz, 2H), 7,29-7,39 (m, 3H), 7,06-7,28 (m, 1H), 3,88 (s, 2H)
358	^1H RMN (acetona- d_6) δ : 9,44 (br s, 1H), 9,32 (d, J=2,7 Hz, 1H), 8,89 (d, J=0,8 Hz, 1H), 8,63 (dd, J=4,6, 1,4 Hz, 1H), 8,44 (d, J=8,2 Hz, 1H), 8,37 (s, 1H), 7,66 (d, J=9,1 Hz, 1H), 7,58-7,62 (m, 1H), 7,38 (dd, J=9,3, 1,9 Hz, 1H), 1,79 (tt, J=7,9, 4,6 Hz, 1H), 0,86-0,99 (m, 2H), 0,73-0,86 (m, 2H)
359	^1H RMN (CDCl_3) δ : 9,14-9,21 (m, 1H), 9,15 (d, J=2,4 Hz, 1H), 8,64 (dd, J=4,7, 1,6 Hz, 1H), 8,30-8,45 (m, 1H), 8,18-8,28 (m, 1H), 7,66 (d, J=9,1 Hz, 1H), 7,32-7,50 (m, 6H), 7,17-7,23 (m, 1H), 6,90-7,02 (m, 1H), 3,78 (s, 2H)
360	^1H RMN (acetona- d_6) δ : 9,33 (d, J=2,5 Hz, 1H), 9,11 (br s, 1H), 8,91 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,63 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,41-8,53 (m, 1H), 7,59-7,77 (m, 2H), 7,37 (dd, J=8,6 Hz, 1H), 2,44 (dd, J=14,1, 6,9 Hz, 1H), 1,75 (dt, J=13,4, 7,8 Hz, 1H), 1,47 (ddd, J=13,4, 7,4, 6,0 Hz, 1H), 1,18 (d, J=6,8 Hz, 2H), 0,94 (t, J=7,4 Hz, 2H)
361	^1H RMN (CDCl_3) δ : 9,13 (d, J=2,2 Hz, 1H), 8,71-8,91 (m, 2H), 8,61 (s, 1H), 8,55 (d, J=2,0 Hz, 1H), 8,41 (s, 1H), 7,85 (s, 2H), 4,96 (d, J=4,6 Hz, 2H)
362	^1H RMN (CDCl_3) δ : 9,13 (d, J=2,2 Hz, 1H), 8,71-8,91 (m, 2H), 8,61 (s, 1H), 8,55 (d, J=2,0 Hz, 1H), 8,41 (s, 1H), 7,85 (s, 2H), 4,96 (d, J=4,6 Hz, 2H)
363	^1H RMN (CDCl_3) δ : 9,20 (d, J=2,2 Hz, 1H), 8,69 (d, J=3,8 Hz, 1H), 8,55 (s, 1H), 8,30 (d, J=8,3 Hz, 1H), 7,78-7,94 (m, 2H), 7,52 (dd, J=8,1, 4,8 Hz, 1H), 7,37 (d, J=8,4 Hz, 1H), 3,95-4,49 (m, 2H), 3,41-3,93 (m, 1H), 1,67-1,97 (m, 6H), 1,11 (br s, 3H)
364	^1H RMN (CDCl_3) δ : 8,74-8,82 (m, 2H), 8,62 (s, 1H), 8,35-8,48 (m, 1H), 7,83-7,94 (m, 2H), 7,59-7,67 (m, 1H), 7,25-7,29 (m, 3H), 4,96 (d, J=4,4 Hz, 2H), 4,00 (s, 2H)
365	^1H RMN (acetona- d_6) δ : 9,24-9,27 (m, 2H), 8,63 (s, 1H), 8,45 (s, 1H), 8,38 (d, J=10,0 Hz, 1H), 8,07-8,18 (m, 1H), 7,89 (dd, J=5,0 Hz, 1H), 7,79 (d, J=9,0 Hz, 1H), 5,02 (d, J=8,5 Hz, 1H), 1,48 (d, J=7,1 Hz, 3H)
366	^1H RMN (acetona- d_6) δ : 9,26 (br s, 1H), 9,21 (s, 1H), 8,62 (br s, 1H), 8,34-8,44 (m, 2H), 7,88 (d, J=9,1 Hz, 1H), 7,66-7,81 (m, 2H), 3,56-3,77 (m, 1H), 2,82 (d, J=16,7 Hz, 1H), 1,33 (d, J=6,5 Hz, 3H), 1,05 (d, J=6,1 Hz, 1H), 0,51 (br s, 1H), 0,37-0,48 (m, 2H), 0,28 (br s, 1H)
367	^1H RMN (acetona- d_6) δ : 9,25 (s, 1H), 9,20 (s, 1H), 8,62 (s, 1H), 8,39 (s, J=7,1, 7,1 Hz, 2H), 7,85 (d, J=8,8 Hz, 1H), 7,75 (d, J=8,8 Hz, 1H), 7,49-7,60 (m, 1H), 4,38-4,51 (m, 1H), 3,48-3,62 (m, 4H), 3,34 (s, 6H),
368	^1H RMN (acetona- d_6) δ : 9,26 (s, 2H), 8,63 (s, 1H), 8,47 (s, 1H), 8,38 (d, J=9,4 Hz, 1H), 8,01 (d, J=9,6 Hz, 1H), 7,89 (d, J=8,8 Hz, 1H), 7,79 (d, J=8,9 Hz, 1H), 4,82 (ddd, J=9,8, 8,9, 6,5 Hz, 1H), 2,25-2,36 (m, 1H), 1,12 (d, J=6,6 Hz, 6H),
369	^1H RMN (acetona- d_6) δ : 9,28 (s, 1H), 9,25 (d, J=9,5 Hz, 1H), 8,63 (d, J=2,8 Hz, 1H), 8,45 (s, 1H), 8,39 (d, J=9,5 Hz, 1H), 8,11-8,19 (m, 1H), 7,89 (d, J=8,9 Hz, 1H), 7,79 (d, J=9,0 Hz, 1H), 4,15-4,20 (m, 4H), 2,79-2,84 (m, 1H), 1,26 (t, J=7,1 Hz, 3H)
370	^1H RMN (acetona- d_6) δ : 9,26 (s, 1H), 9,21 (s, 1H), 8,62 (s, 1H), 8,32-8,43 (m, 2H), 7,87 (d, J=8,9 Hz, 1H), 7,75 (d, J=9,0 Hz, 1H), 7,49-7,59 (m, 1H), 4,29-4,44 (m, 1H), 3,52 (dd, J=9,3, 5,7 Hz, 1H), 3,40 (dd, J=9,5, 5,8 Hz, 1H), 3,34 (s, 3H), 1,26 (d, J=6,8 Hz, 3H)

ES 2 707 398 T3

Comp. núm.	Datos de ¹ H RMN ^a
371	¹ H RMN (acetona- <i>d</i> ₆) δ: 9,35 (s, 1H), 9,17 (s, 1H), 8,68 (d, J=5,0 Hz, 1H), 8,49 (d, J=8,2 Hz, 1H), 8,40 (s, 1H), 7,99 (br s, 1H), 7,86 (d, J=9,0 Hz, 1H), 7,77 (d, J=9,0 Hz, 1H), 7,64 (ddd, J=8,3, 4,7, 0,7 Hz, 1H), 3,54-3,62 (m, 2H), 2,78-2,86 (m, 3H), 1,31-1,38 (m, 9H),
372	¹ H RMN (acetona- <i>d</i> ₆) δ: 9,35 (dd, J=2,9, 0,7 Hz, 1H), 9,14 (d, J=1,0 Hz, 1H), 8,68 (dd, J=4,7, 1,5 Hz, 1H), 8,49 (ddd, J=8,3, 2,9, 1,6 Hz, 1H), 8,37-8,40 (m, 1H), 7,86 (dd, J=9,1, 1,8 Hz, 1H), 7,75 (dt, J=9,1, 1,3 Hz, 1H), 7,64 (ddd, J=8,4, 4,7, 0,9 Hz, 1H), 7,48 (d, J=7,0 Hz, 1H), 4,05-4,15 (m, 1H), 1,55-1,70 (m, 2H), 1,24 (d, J=6,6 Hz, 3H), 0,97 (t, J=7,4 Hz, 3H)
373	¹ H RMN (acetona- <i>d</i> ₆) δ: 9,78 (br s, 1H), 9,37 (d, J=2,4 Hz, 1H), 9,22 (s, 1H), 8,69 (dd, J=4,7, 1,2 Hz, 1H), 8,43-8,61 (m, 2H), 7,86-7,99 (m, 2H), 7,74-7,85 (m, 2H), 7,65 (dd, J=8,3, 4,7 Hz, 1H), 7,21 (t, J=4,2 Hz, 1H)
374	¹ H RMN (acetona- <i>d</i> ₆) δ: 9,04 (s, 1H), 8,87 (s, 1H), 8,73 (s, 1H), 8,35 (d, J=4,9 Hz, 2H), 8,29 (d, J=2,5 Hz, 1H), 8,08-8,20 (m, 1H), 8,04 (s, 1H), 7,40-7,50 (m, 1H), 7,37 (d, J=9,3 Hz, 1H), 6,97 (t, J=4,8 Hz, 1H), 4,26 (d, J=5,8 Hz, 2H)
375	¹ H RMN (acetona- <i>d</i> ₆) δ: 9,28 (s, 2H), 8,64 (d, J=2,5 Hz, 1H), 8,47 (s, 1H), 8,40 (d, J=9,8 Hz, 2H), 7,86 (d, J=1,4 Hz, 1H), 7,78-7,84 (m, 1H), 3,70 (s, 3H)
376	¹ H RMN (acetona- <i>d</i> ₆) δ: 9,37 (d, J=2,5 Hz, 2H), 9,20 (s, 2H), 8,85 (br. s, 1H), 8,69 (dd, J=4,7, 1,3 Hz, 1H), 8,40-8,58 (m, 3H), 7,87 (d, J=8,8 Hz, 1H), 7,79 (d, J=9,1 Hz, 1H), 7,65 (dd, J=8,2, 4,9 Hz, 1H), 1,29 (s, 10H)
377	¹ H RMN (acetona- <i>d</i> ₆) δ: 9,68 (br. s, 1H), 9,37 (d, J=2,2 Hz, 1H), 9,23 (s, 1H), 8,69 (dd, J=4,7, 1,3 Hz, 1H), 8,44-8,61 (m, 2H), 7,86-8,07 (m, 1H), 7,74-7,86 (m, 2H), 7,65 (dd, J=8,4, 4,3 Hz, 1H), 7,23 (d, J=3,3 Hz, 1H), 6,66 (dd, J=3,3, 1,6 Hz, 1H)
378	¹ H RMN (acetona- <i>d</i> ₆) δ: 9,74 (br. s, 1H), 9,38 (d, J=2,5 Hz, 1H), 9,23 (s, 1H), 8,70 (dd, J=4,7, 1,3 Hz, 1H), 8,45-8,61 (m, 2H), 8,02 (d, J=7,3 Hz, 2H), 7,92 (d, J=9,1 Hz, 1H), 7,83 (d, J=9,1 Hz, 1H), 7,57-7,73 (m, 2H), 7,53 (t, J=7,2 Hz, 2H)
379	¹ H RMN (acetona- <i>d</i> ₆) δ: 9,36 (d, J=2,4 Hz, 1H), 9,17 (s, 1H), 8,96-9,03 (m, 1H), 8,68 (dd, J=4,6, 1,4 Hz, 1H), 8,45-8,59 (m, 1H), 8,36-8,43 (m, 1H), 7,85 (dd, J=9,1, 1,6 Hz, 1H), 7,78 (d, J=9,3 Hz, 1H), 7,65 (dd, J=8,3, 4,5 Hz, 1H)
380	¹ H RMN (acetona- <i>d</i> ₆) δ: 9,55 (s, J=8,1 Hz, 2H), 9,34 (d, J=0,9 Hz, 1H), 9,26 (s, 1H), 8,60-8,66 (m, 1H), 7,94 (dd, J=9,1, 1,6 Hz, 1H), 7,74-7,88 (m, 1H), 3,93 (s, 3H)
381	¹ H RMN (acetona- <i>d</i> ₆) δ: 9,36 (d, J=2,2 Hz, 1H), 9,19 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,69 (dd, J=4,7, 1,3 Hz, 1H), 8,38-8,57 (m, 2H), 8,02 (d, J=8,4 Hz, 1H), 7,87 (dd, J=9,1, 1,6 Hz, 1H), 7,79 (dt, J=9,1, 0,9 Hz, 1H), 7,65 (ddd, J=8,3, 4,7, 0,7 Hz, 1H), 5,00 (ddd, J=12,9, 8,2, 7,0 Hz, 1H), 3,56 (ddd, J=12,0, 11,2, 5,4 Hz, 1H), 3,39 (ddd, J=11,2, 7,0, 1,0 Hz, 1H), 2,73 (dddd, J=12,3, 6,9, 5,4, 1,4 Hz, 1H), 2,29-2,48 (m, 1H)
382	¹ H RMN (CDCl ₃) δ: 8,97-9,11 (m, 1H), 8,52-8,63 (m, 2H), 8,13 (dt, J=9,0, 2,4 Hz, 1H), 8,00-8,09 (m, 1H), 7,78 (dt, J=9,1, 0,9 Hz, 1H), 7,63 (dd, J=9,1, 1,6 Hz, 1H), 7,26 (s, 2H), 4,38 (br s, 2H), 4,28 (br s, 2H), 2,39 (t, J=7,7 Hz, 2H)
383	¹ H RMN (DMSO- <i>d</i> ₆) δ: 9,49 (s, 1H), 9,31 (s, 2H), 8,73 (d, J=2,4 Hz, 1H), 8,46-8,62 (m, 2H), 7,91 (d, J=9,1 Hz, 1H), 7,82 (d, J=9,1 Hz, 1H), 7,42-7,59 (m, 2H), 7,10-7,18 (m, 2H), 4,74 (d, J=3,6 Hz, 2H)
384	¹ H RMN (acetona- <i>d</i> ₆) δ: 9,24-9,29 (m, 1H), 9,22 (d, J=1,0 Hz, 1H), 8,62 (d, J=2,4 Hz, 1H), 8,38 (d, J=9,8 Hz, 2H), 7,93-8,05 (m, 1H), 7,85-7,93 (m, 1H), 7,76 (d, J=9,1 Hz, 1H), 3,39-3,59 (m, 4H), 3,22-3,34 (m, 1H), 3,07-3,15 (m, 1H), 2,51-2,66 (m, 1H), 1,66-1,82 (m, 1H), 1,43 (s, 8H)
385	¹ H RMN (acetona- <i>d</i> ₆) δ: 9,60 (br s, 1H), 9,36 (d, J=2,4 Hz, 1H), 9,21 (d, J=15,9 Hz, 1H), 8,69 (dd, J=4,8 Hz, 1H), 8,49-8,52 (m, 1H), 8,46 (s, 1H), 7,86 (dd, J=9,1, 1,6 Hz, 1H), 7,80 (dt, J=8,9 Hz, 1H), 7,65 (ddd, J=8,4, 4,7, 0,8 Hz, 1H), 5,49 (d, J=4,4 Hz, 1H), 3,59-3,75 (m, 2H),

ES 2 707 398 T3

Comp. núm.	Datos de ^1H RMN ^a
386	^1H RMN (CDCl_3) δ : 9,36-9,38 (m, 2H), 9,28 (s, 1H), 8,60 (s, 1H), 8,29 (s, 1H), 7,82 (d, J=8,8 Hz, 1H), 7,75 (d, J=9,2 Hz, 1H), 6,65 (br s, 1H), 4,12 (dd, J=7,3, 3,1 Hz, 1H), 3,78-3,95 (m, 3H), 3,37 (ddd, J=13,7, 7,7, 4,7 Hz, 1H), 2,02-2,21 (m, 2H), 1,88-2,02 (m, 2H), 1,65 (dd, J=12,2, 8,1 Hz, 1H)
387	^1H RMN (CDCl_3) δ : 9,35-9,39 (m, 2H), 9,27-9,33 (m, 1H), 8,63 (s, 1H), 8,23-8,43 (m, 1H), 7,87 (dt, J=9,1, 0,9 Hz, 1H), 7,74 (dd, J=9,1, 1,6 Hz, 1H), 6,40 (br s, 1H), 4,19 (qd, J=9,0, 6,5 Hz, 2H)
388	^1H RMN (CDCl_3) δ : 9,37 (s, 2H), 9,29 (s, 1H), 8,60 (s, 1H), 8,26 (s, 1H), 7,82 (d, J=9,1 Hz, 1H), 7,68 (dd, J=9,1, 1,6 Hz, 1H), 6,30 (br s, 1H), 2,96 (dd, J=7,0, 3,9 Hz, 1H), 0,80-1,01 (m, 3H), 0,62-0,79 (m, 2H)
389	^1H RMN (CDCl_3) δ : 9,08 (s, 1H), 8,64 (s, 1H), 8,58 (s, 1H), 8,38 (s, 1H), 8,27 (s, 1H), 7,80 (dt, J=10,2 Hz, 1H), 7,73 (dd, J=8,9 Hz, 1H), 6,61 (br s, 1H), 4,03-4,19 (m, 2H), 3,78-3,95 (m, 3H), 3,37 (ddd, J=13,8, 7,6, 4,7 Hz, 1H), 2,02-2,13 (m, 2H), 1,83-2,02 (m, 3H),
390	^1H RMN (CDCl_3) δ : 9,32 (d, J=2,2 Hz, 1H), 9,21 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,67 (d, J=2,2 Hz, 1H), 8,59 (t, J=2,2 Hz, 1H), 8,33-8,41 (m, 1H), 7,85 (dd, J=9,1, 1,6 Hz, 1H), 7,60-7,79 (m, 2H), 2,72-2,85 (m, 10H), 2,13-2,20 (m, 1H), 0,70-0,81 (m, 2H), 0,49-0,69 (m, 2H)
391	^1H RMN (CDCl_3) δ : 9,08 (d, J=2,0 Hz, 1H), 8,59-8,75 (m, 2H), 8,48-8,59 (m, 1H), 8,38 (t, J=2,2 Hz, 1H), 7,97 (dd, J=9,2, 1,5 Hz, 1H), 7,79 (d, J=9,1 Hz, 1H), 3,97 (s, 2H)
392	^1H RMN (CDCl_3) δ : 9,19 (d, J=2,2 Hz, 1H), 8,55-8,74 (m, 1H), 8,43 (d, J=0,8 Hz, 1H), 8,17-8,32 (m, 1H), 7,77 (d, J=9,3 Hz, 1H), 7,50 (dd, J=8,2, 4,7 Hz, 1H), 7,40 (br s, 1H), 7,13 (d, J=9,0 Hz, 1H), 3,30 (q, J=10,5 Hz, 2H)
393	^1H RMN (CDCl_3) δ : 9,20 (d, J=2,5 Hz, 1H), 8,62-8,79 (m, 1H), 8,47-8,62 (m, 1H), 8,30 (ddd, J=8,3, 2,6, 1,6 Hz, 1H), 7,90 (br s, 1H), 7,81 (d, J=8,8 Hz, 1H), 7,52 (dd, J=8,3, 4,8 Hz, 1H), 7,43 (br s, 1H), 0,98-1,17 (m, 1H), 0,42-0,63 (m, 2H), 0,19 (br s, 2H)
394	^1H RMN (CDCl_3) δ : 9,21 (br s, 1H), 8,70 (d, J=3,9 Hz, 1H), 8,58 (s, 1H), 8,24-8,36 (m, 2H), 7,81 (d, J=9,0 Hz, 1H), 7,69 (d, J=9,1 Hz, 1H), 7,53 (dd, J=8,0, 4,7 Hz, 1H), 6,28 (br s, 1H), 2,42 (s, 1H), 1,81 (s, 6H)
395	^1H RMN (CDCl_3) δ : 9,20 (d, J=2,4 Hz, 1H), 8,67-8,85 (m, 2H), 8,57 (s, 1H), 8,22-8,44 (m, 2H), 7,76-7,93 (m, J=9,1 Hz, 1H), 7,61-7,75 (m, J=9,0 Hz, 1H), 7,52 (dd, J=8,1, 4,7 Hz, 2H), 6,27 (d, J=6,6 Hz, 2H), 4,60-4,72 (m, 1H), 2,43-2,55 (m, 2H), 1,91-2,08 (m, 2H), 1,68-1,90 (m, 2H)
396	^1H RMN (CDCl_3) δ : 9,12 (d, J=2,2 Hz, 1H), 8,74 (d, J=2,0 Hz, 1H), 8,46-8,64 (m, 2H), 8,27 (s, 1H), 7,80 (d, J=8,9 Hz, 1H), 7,73 (d, J=8,9 Hz, 1H), 6,56 (br s, 1H), 4,11 (dd, J=7,2, 3,1 Hz, 1H), 3,77-3,98 (m, 3H), 3,37 (ddd, J=13,8, 7,6, 4,6 Hz, 1H), 2,01-2,21 (m, 1H), 1,89-2,01 (m, 2H), 1,60-1,78 (m, 1H)
397	^1H RMN (acetona- d_6) δ : 9,37 (d, J=2,2 Hz, 1H), 9,32 (s, 1H), 8,75-8,83 (m, 2H), 8,56-8,65 (m, 1H), 7,93 (dd, J=9,1, 1,6 Hz, 1H), 7,81 (d, J=9,0 Hz, 1H), 3,92 (s, 3H)
398	^1H RMN (CDCl_3) δ : 9,12 (d, J=1,9 Hz, 1H), 8,76 (d, J=1,6 Hz, 1H), 8,61 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,53 (t, J=2,2 Hz, 1H), 8,31 (dd, J=1,6, 0,9 Hz, 1H), 7,80-7,93 (m, 1H), 7,72 (dd, J=9,1, 1,7 Hz, 1H), 4,19 (dd, J=9,1, 6,4 Hz, 2H)
399	^1H RMN (CDCl_3) δ : 9,11 (d, J=2,4 Hz, 1H), 8,74 (d, J=2,0 Hz, 1H), 8,46-8,61 (m, 2H), 8,12-8,31 (m, 1H), 7,79 (d, J=9,1 Hz, 1H), 7,66 (dd, J=9,1, 1,7 Hz, 1H), 6,26 (br. S, 1H), 2,95 (d, J=3,2 Hz, 1H), 0,91 (d, J=5,7 Hz, 2H), 0,61-0,77 (m, 2H)
400	^1H RMN (acetona- d_6) δ : 9,92-10,04 (m, 1H), 9,81-9,92 (m, 1H), 9,37 (d, J=2,5 Hz, 1H), 9,20-9,26 (m, 1H), 9,03-9,20 (m, 1H), 8,78 (dd, J=4,8, 1,5 Hz, 1H), 8,69 (dd, J=4,7, 1,3 Hz, 1H), 8,45-8,62 (m, 2H), 8,32 (d, J=7,9 Hz, 1H), 7,87-7,99 (m, 1H), 7,83 (d, J=8,8 Hz, 1H), 7,61-7,74 (m, 1H), 7,55 (s, 1H)
401	^1H RMN (acetona- d_6) δ : 9,25 (s, 1H), 9,23-9,28 (m, 1H), 9,21-9,32 (m, 1H), 8,63 (d, J=2,2 Hz, 1H), 8,48 (dd, J=1,6, 0,9 Hz, 1H), 8,31-8,44 (m, 1H), 7,90 (dd, J=9,1, 1,7 Hz, 1H), 7,80 (dt, J=9,1, 0,9 Hz, 1H), 4,23 (q, J=9,5 Hz, 1H), 4,22 (q, J=9,5 Hz, 2H)

ES 2 707 398 T3

Comp. núm.	Datos de ¹ H RMN ^a
402	¹ H RMN (acetona- <i>d</i> ₆) δ: 9,37 (br s, 1H), 9,18 (s, 1H), 8,61-8,83 (m, 1H), 8,51 (d, J=7,7 Hz, 1H), 8,42 (s, 1H), 8,35 (br s, 1H), 7,87 (dd, J=9,1, 1,6 Hz, 1H), 7,77 (d, J=8,9 Hz, 1H), 7,66 (t, J=7,1 Hz, 1H), 3,65 (s, 3H) 1,45-1,59 (m, 2H), 1,19-1,35 (m, 2H)
403	¹ H RMN (CDCl ₃) δ: 9,21 (d, J=2,5 Hz, 1H), 8,70 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,58 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,29-8,32 (m, 1H), 8,28 (s, 1H), 7,83 (d, J=8,9 Hz, 1H), 7,72 (d, J=8,9 Hz, 1H), 7,52 (ddd, J=8,4, 4,7, 0,6 Hz, 1H), 6,36-6,45 (m, 1H), 4,18-4,31 (m, 1H), 3,55 (dd, J=9,9, 3,5 Hz, 2H), 3,41 (s, 3H), 1,65-1,81 (m, 2H), 1,02 (t, J=7,5 Hz, 3H)
404	¹ H RMN (CDCl ₃) δ: 9,21 (d, J=2,5 Hz, 1H), 8,70 (dd, J=4,7, 1,3 Hz, 1H), 8,51-8,64 (m, 1H), 8,28-8,36 (m, 2H), 7,84 (d, J=9,1 Hz, 1H), 7,71 (dd, J=9,1, 1,7 Hz, 1H), 7,52 (dd, J=8,3, 4,8 Hz, 1H), 6,31 (br s, 1H), 4,31 (dd, J=5,1, 2,6 Hz, 2H)
405	¹ H RMN (CDCl ₃) δ: 8,74 (d, J=2,0 Hz, 1H), 8,60 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,40 (d, J=2,7 Hz, 1H), 8,31 (dd, J=1,6, 0,9 Hz, 1H), 7,81-7,92 (m, 2H), 7,72 (dd, J=9,1, 1,6 Hz, 1H), 4,19 (dd, J=9,1, 6,4 Hz, 2H), 4,00 (s, 3H)
406	¹ H RMN (CDCl ₃) δ: 8,74 (s, 1H), 8,57 (d, J=0,8 Hz, 1H), 8,38 (d, J=2,8 Hz, 1H), 8,27 (s, 1H), 7,87 (s, 1H), 7,80 (d, J=8,7 Hz, 1H), 7,73 (d, J=9,0 Hz, 1H), 6,66 (br s, 1H), 4,05-4,19 (m, 1H), 3,91-4,00 (m, 4H), 3,78-3,87 (m, 2H), 3,38 (ddd, J=13,8, 7,6, 4,8 Hz, 1H), 2,01-2,12 (m, 2H), 1,89-2,01 (m, 2H), 1,65 (dd, J=12,2, 8,3 Hz, 1H)
407	¹ H RMN (CDCl ₃) δ: 8,74 (d, J=2,0 Hz, 1H), 8,57 (d, J=0,8 Hz, 1H), 8,39 (d, J=2,7 Hz, 1H), 8,24 (d, J=0,9 Hz, 1H), 7,87 (t, J=2,4 Hz, 1H), 7,80 (d, J=9,1 Hz, 1H), 7,66 (dd, J=9,1, 1,7 Hz, 1H), 6,28 (br s, 1H), 3,99 (s, 3H), 2,95 (dd, J=6,9, 3,8 Hz, 1H), 0,91 (d, J=5,7 Hz, 2H), 0,56-0,75 (m, 2H)
408	¹ H RMN (CDCl ₃) δ: 8,75 (d, J=2,0 Hz, 1H), 8,60 (s, 1H), 8,40 (d, J=2,7 Hz, 1H), 8,34 (s, 1H), 7,79-7,98 (m, 2H), 7,72 (dd, J=9,1, 1,7 Hz, 1H), 4,00 (s, 3H), 3,83 (s, 3H)
409	¹ H RMN (CDCl ₃) δ: 9,38 (s, 2H), 9,30 (s, 1H), 8,78 (d, J=4,9 Hz, 2H), 8,64 (s, 1H), 8,43 (s, 2H), 7,87 (d, J=1,1 Hz, 2H), 7,64 (br. S, 1H), 4,97 (d, J=4,4 Hz, 2H)
410	¹ H RMN (acetona- <i>d</i> ₆) δ: 9,26 (s, 1H), 9,21 (s, 1H), 8,62 (d, J=8,3 Hz, 1H), 8,34-8,42 (m, 2H), 7,85 (dd, J=9,1, 1,6 Hz, 2H), 7,74 (dt, J=9,1, 0,9 Hz, 2H), 2,89-3,06 (m, 1H), 0,70-0,81 (m, 2H), 0,58-0,69 (m, 2H)
411	¹ H RMN (CDCl ₃) δ: 9,20 (br s, 1H), 8,71 (d, J=4,3 Hz, 1H), 8,58 (s, 1H), 8,25-8,35 (m, 2H), 7,84 (d, J=9,0 Hz, 1H), 7,71 (dd, J=9,1, 1,7 Hz, 1H), 7,53 (dd, J=8,2, 4,7 Hz, 1H), 7,27 (s, 1H), 6,25 (d, J=9,5 Hz, 1H), 4,92-5,08 (m, 1H), 1,47 (d, J=7,1 Hz, 3H)
412	¹ H RMN (CDCl ₃) δ: 9,21 (br s, 1H), 8,72 (d, J=3,8 Hz, 1H), 8,62 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,26-8,36 (m, 2H), 7,87 (dt, J=9,1, 0,9 Hz, 1H), 7,72 (dd, J=9,1, 1,7 Hz, 1H), 7,53 (dd, J=8,2, 4,7 Hz, 1H), 6,22 (s, 1H), 4,84 (ddd, J=10,2, 8,5, 4,7 Hz, 1H) 1,10 (dd, J=9,3, 7,1 Hz, 6H)
413	¹ H RMN (CDCl ₃) δ: 9,20 (d, J=2,4 Hz, 1H), 8,68 (d, J=5,1 Hz, 1H), 8,53 (s, 1H), 8,30 (d, J=8,2 Hz, 1H), 7,78-7,82 (m, 2H), 7,51 (ddd, J=8,3, 4,8, 0,6 Hz, 1H), 7,35 (d, J=8,7 Hz, 1H), 7,28 (s, 1H), 3,48 (q, J=7,1 Hz, 5H), 1,21-1,36 (m, 5H)
414	¹ H RMN (CDCl ₃) δ: 9,19 (s, 1H), 9,20 (d, J=5,2 Hz, 1H), 8,69 (dt, J=4,7, 1,7 Hz, 1H), 8,56 (dd, J=6,9, 0,8 Hz, 1H), 8,24-8,34 (m, 2H), 7,77-7,89 (m, 1H), 7,62-7,77 (m, 1H), 7,46-7,58 (m, 1H), 7,41-7,43 (m, 1H), 7,40 (d, J=7,8 Hz, 1H), 7,33 (d, J=7,7 Hz, 1H), 6,87-6,96 (m, 2H), 6,52 (d, J=7,7 Hz, 1H), 5,17 (d, J=7,7 Hz, 1H), 3,80 (s, 3H), 3,48 (q, J=7,1 Hz, 1H), 1,24-1,47 (m, 2H), 0,67 (d, J=8,7 Hz, 2H)
415	¹ H RMN (CDCl ₃) δ: 9,20 (d, J=2,5 Hz, 1H), 8,70 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,57 (d, J=0,8 Hz, 1H), 8,25-8,33 (m, 2H), 7,82 (d, J=9,0 Hz, 1H), 7,71 (dd, J=9,1, 1,6 Hz, 1H), 7,52 (dd, J=8,2, 4,7 Hz, 1H), 6,16 (d, J=7,6 Hz, 1H), 3,60-3,72 (m, 1H), 1,35 (d, J=6,6 Hz, 3H), 0,87-1,05 (m, 1H), 0,42-0,62 (m, 3H), 0,34 (dt, J=9,8, 4,7 Hz, 1H)

ES 2 707 398 T3

Comp. núm.	Datos de ¹ H RMN ^a
416	¹ H RMN (acetona- <i>d</i> ₆) δ: 9,37 (d, J=2,2 Hz, 1H), 9,18-9,31 (m, 1H), 8,69 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,36-8,56 (m, 3H), 7,88 (d, J=9,0 Hz, 1H), 7,80 (d, J=9,1 Hz, 1H), 7,65 (ddd, J=8,4, 4,7, 0,6 Hz, 2H), 4,63 (d, J=6,6 Hz, 1H), 1,19 (d, J=6,6 Hz, 6H)
420	¹ H RMN (CDCl ₃) δ: 9,21 (d, J=2,4 Hz, 1H), 8,70 (d, J=5,1 Hz, 1H), 8,59 (s, 1H), 8,25-8,35 (m, 2H), 7,84 (d, J=8,9 Hz, 1H), 7,72 (d, J=8,9 Hz, 1H), 7,52 (ddd, J=8,3, 4,8, 0,6 Hz, 1H), 6,64 (br s, 1H), 4,15-4,27 (m, 1H), 4,05 (ddd, J=14,2, 6,8, 3,5 Hz, 1H), 3,52-3,66 (m, 3H), 2,02-2,17 (m, 2H), 1,87-2,02 (m, 2H)
421	¹ H RMN (CDCl ₃) δ: 8,88 (d, J=2,2 Hz, 1H), 8,50-8,59 (m, 2H), 8,23-8,33 (m, 1H), 8,17 (t, J=2,2 Hz, 1H), 7,81 (dt, J=9,1, 0,9 Hz, 1H), 7,73 (dd, J=9,1, 1,7 Hz, 1H), 6,59 (br s, 1H), 4,03-4,19 (m, 1H), 3,77-3,95 (m, 3H), 3,38 (ddd, J=13,7, 7,6, 4,7 Hz, 1H), 2,62 (s, 3H), 2,01-2,17 (m, 1H), 1,89-2,01 (m, 2H), 1,56-1,74 (m, 3H)
422	¹ H RMN (CDCl ₃) δ: 9,22 (s, 1H), 8,71 (d, J=5,2 Hz, 1H), 8,55-8,64 (m, 3H), 8,32 (ddd, J=8,3, 2,7, 1,5 Hz, 1H), 8,03 (d, J=9,0 Hz, 1H), 7,90 (dt, J=9,1, 0,9 Hz, 1H), 7,45-7,57 (m, 2H), 4,09 (q, J=9,9 Hz, 2H)
423	¹ H RMN (CDCl ₃) δ: 9,23 (d, J=2,4 Hz, 1H), 8,98 (d, J=5,2 Hz, 2H), 8,62-8,75 (m, 1H), 8,56 (d, J=8,0 Hz, 2H), 8,44 (d, J=6,9 Hz, 1H), 8,26-8,38 (m, 1H), 8,16 (dd, J=9,1, 1,6 Hz, 1H), 7,84-8,01 (m, 3H), 7,51 (dd, J=8,2, 4,7 Hz, 1H), 7,35 (t, J=4,8 Hz, 1H)
424	¹ H RMN (CDCl ₃) δ: 9,19-9,27 (m, 8H), 8,90-9,09 (m, 5H), 8,72 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 5H), 8,64 (d, J=6,4 Hz, 4H), 8,49-8,58 (m, 4H), 8,33 (ddd, J=8,2, 2,6, 1,4 Hz, 6H), 8,10 (dd, J=9,2, 1,7 Hz, 5H), 7,96 (dt, J=9,1, 0,9 Hz, 5H), 7,54 (ddd, J=8,2, 4,8, 0,7 Hz, 5H)
428	¹ H RMN (acetona- <i>d</i> ₆) δ: 9,36 (d, J=2,7 Hz, 1H), 9,10 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,70 (dd, J=4,7, 1,3 Hz, 1H), 8,42-8,56 (m, 2H), 8,38 (d, J=1,3 Hz, 1H), 7,90 (dd, J=8,8, 0,9 Hz, 1H), 7,63-7,71 (m, 2H), 5,63 (s, 1H), 4,25 (qd, J=9,6, 6,5 Hz, 2H)
429	¹ H RMN (acetona- <i>d</i> ₆) δ: 9,34 (d, J=2,5 Hz, 1H), 9,03 (s, 1H), 8,68 (d, J=5,3 Hz, 1H), 8,48 (ddd, J=8,4, 2,7, 1,4 Hz, 1H), 8,24 (d, J=1,1 Hz, 1H), 7,83 (dd, J=8,8, 0,9 Hz, 2H), 7,58-7,65 (m, 2H), 2,99 (d, J=3,9 Hz, 1H), 0,72-0,93 (m, 3H), 0,53-0,72 (m, 2H)
430	¹ H RMN (CDCl ₃) δ: 9,22 (s, 1H), 8,77 (d, J=5,1 Hz, 2H), 8,70 (d, J=4,6 Hz, 1H), 8,52 (s, 1H), 8,38 (s, 1H), 8,31 (d, J=8,2 Hz, 1H), 7,82 (dd, J=17,3 Hz, 1H), 7,73-7,76 (m, 1H), 7,70 (d, J=8,7 Hz, 1H), 7,52 (ddd, J=8,3, 4,8, 0,8 Hz, 1H), 7,22-7,32 (m, 1H), 4,97 (d, J=4,4 Hz, 2H)
431	¹ H RMN (CDCl ₃) δ: 9,21 (d, J=2,2 Hz, 1H), 8,71 (dd, J=7,1 Hz, 1H), 8,52 (d, J=0,9 Hz, 1H), 8,12-8,34 (m, 2H), 7,82 (d, J=8,7 Hz, 2H), 7,49-7,61 (m, 2H), 3,83 (s, 3H)
432	¹ H RMN (acetona- <i>d</i> ₆) δ: 9,35 (s, 1H), 9,05 (s, 1H), 8,68 (d, J=4,9 Hz, 1H), 8,49 (d, J=8,3 Hz, 1H), 8,30 (s, 1H), 8,02 (br s, 1H), 7,85 (d, J=8,7 Hz, 1H), 7,59-7,69 (m, 2H), 3,62-3,69 (m, 2H), 2,74-2,83 (m, 3H), 2,16 (s, 3H)
433	¹ H RMN (acetona- <i>d</i> ₆) δ: 9,36 (s, 1H), 9,06 (s, 1H), 8,68 (d, J=5,1 Hz, 1H), 8,49 (d, J=8,2 Hz, 1H), 8,31 (s, 1H), 7,85 (dd, J=8,7, 0,9 Hz, 2H), 7,62-7,67 (m, 2H), 4,61 (t, J=5,5 Hz, 1H), 3,55 (t, J=5,8 Hz, 2H), 3,38-3,40 (m, 6H)
434	¹ H RMN (acetona- <i>d</i> ₆) δ: 9,36 (s, 1H), 9,08 (s, 1H), 8,69 (d, J=5,0 Hz, 1H), 8,49 (d, J=8,2 Hz, 1H), 8,36 (s, 1H), 8,18 (d, J=8,8 Hz, 1H), 7,88 (d, J=8,8 Hz, 1H), 7,63-7,68 (m, 2H), 4,96-5,14 (m, 1H), 1,51 (d, J=7,1 Hz, 3H)
435	¹ H RMN (acetona- <i>d</i> ₆) δ: 9,36 (d, J=7,1 Hz, 1H), 9,08 (s, 1H), 8,69 (d, J=5,2 Hz, 1H), 8,50 (ddd, J=8,4, 2,7, 1,4 Hz, 1H), 8,31-8,41 (m, 1H), 8,25 (br s, 1H), 7,88 (d, J=8,7 Hz, 1H), 7,63-7,69 (m, 2H), 6,14 (t, J=4,3 Hz, 1H), 3,84 (tdd, 2H)
436	¹ H RMN (acetona- <i>d</i> ₆) δ: 9,36 (d, J=7,1 Hz, 1H), 9,08 (s, 1H), 8,69 (d, J=5,2 Hz, 1H), 8,50 (ddd, J=8,4, 2,7, 1,4 Hz, 1H), 8,31-8,41 (m, 1H), 8,25 (br s, 1H), 7,88 (d, J=8,7 Hz, 1H), 7,63-7,69 (m, 2H), 6,14 (t, J=4,3 Hz, 1H), 3,84 (tdd, 2H)

Comp. núm.	Datos de ¹ H RMN ^a
437	¹ H RMN (acetona- <i>d</i> ₆) δ: 9,35 (s, 1H), 9,05 (s, 1H), 8,68 (d, J=5,0 Hz, 1H), 8,50 (s, 1H), 8,48 (d, J=8,2 Hz, 1H), 8,31 (s, 1H), 7,85 (dd, J=8,8, 0,9 Hz, 2H), 7,56-7,74 (m, 2H), 4,08 (dd, J=6,6, 5,2 Hz, 1H), 3,86 (ddd, J=8,1, 7,2, 6,1 Hz, 1H), 3,69 (td, J=7,7, 6,5 Hz, 1H), 3,40-3,58 (m, 2H), 2,00-2,08 (m, 5H), 1,83-1,94 (m, 2H), 1,70 (dd, J=12,1, 8,7 Hz, 1H)
438	¹ H RMN (CDCl ₃) δ: 9,04-9,20 (m, 2H), 8,79 (dd, J=4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,36 (dd, J=7,1, 1,1 Hz, 1H), 8,16 (ddd, J=8,2, 2,6, 1,5 Hz, 1H), 7,79 (dd, J=8,4, 1,1 Hz, 1H), 7,57 (ddd, J=8,2, 4,8, 0,8 Hz, 1H), 7,33 (dd, J=8,4, 7,0 Hz, 1H), 4,15 (dd, J=6,4, 3,9 Hz, 1H), 3,72-3,91 (m, 3H), 3,62 (dt, J=13,9, 6,0 Hz, 1H), 1,95-2,11 (m, 1H), 1,84-1,95 (m, 2H), 1,69 (dd, J=12,2, 8,7 Hz, 2H)
462	¹ H RMN (DMSO- <i>d</i> ₆) δ: 9,41 (d, J=0,9 Hz, 1H), 9,10 (t, J=1,7 Hz, 1H), 8,62 (t, J=5,8 Hz, 1H), 8,35-8,40 (m, 1H), 8,31 (ddd, J=6,5, 1,6, 0,8 Hz, 1H), 8,11 (ddd, J=8,5, 1,9, 0,8 Hz, 1H), 7,82 (dd, J=9,1, 1,6 Hz, 1H), 7,76 (dt, J=9,1, 0,9 Hz, 1H), 7,64 (dd, J=8,5, 6,5 Hz, 1H), 4,01 (t, J=6,3 Hz, 1H), 3,80 (ddd, J=8,1, 7,1, 6,1 Hz, 1H), 3,58-3,70 (m, 1H), 3,28-3,39 (m, 3H), 1,78-1,97 (m, 3H), 1,57-1,67 (m, 1H)
463	¹ H RMN (DMSO- <i>d</i> ₆) δ: 9,49 (s, 1H), 9,46 (s, 1H), 8,88 (t, J=5,5 Hz, 1H), 8,76 (d, J=5,2 Hz, 1H), 8,70-8,74 (m, 1H), 8,43 (s, 1H), 7,78-7,86 (m, 3H), 3,72-3,83 (m, 2H), 3,62 (q, J=6,2 Hz, 2H)
464	¹ H RMN (CDCl ₃) δ: 9,08 (s, 1H), 9,00 (t, J=1,7 Hz, 1H), 8,12-8,28 (m, 1H), 7,85-8,06 (m, 1H), 7,80 (dd, J=8,4, 1,1 Hz, 1H), 7,41 (dd, J=8,4, 6,5 Hz, 1H), 7,31-7,36 (m, 1H), 6,48 (br s, 1H), 2,96 (dd, J=7,1, 3,9 Hz, 1H), 0,84-0,99 (m, 2H), 0,61-0,76 (m, 2H)
465	¹ H RMN (CDCl ₃) δ: 8,99-9,09 (m, 3H), 8,21 (d, J=6,6 Hz, 2H), 7,84-7,96 (m, 2H), 7,80 (dt, J=8,4, 0,9 Hz, 2H), 7,30-7,47 (m, 5H), 6,17 (d, J=7,7 Hz, 2H), 3,98-4,19 (m, 2H), 2,09 (dd, J=12,5, 3,2 Hz, 4H), 1,80 (dt, J=13,8, 3,7 Hz, 4H), 1,69 (dt, J=13,0, 3,7 Hz, 2H), 1,41-1,55 (m, 4H), 1,23-1,36 (m, 5H)
466	¹ H RMN (CDCl ₃) δ: 8,91-9,08 (m, 2H), 8,23 (d, J=6,8 Hz, 1H), 7,95 (d, J=8,7 Hz, 2H), 7,81 (dd, J=8,4, 1,1 Hz, 2H), 7,34-7,56 (m, 4H), 6,61 (br s, 1H), 4,16-4,36 (m, 2H)
467 (Referencia, no reivindicado)	¹ H RMN (CDCl ₃) δ: 9,19 (d, 1H), 8,63 (dd, 1H), 8,51 (d, 1H), 8,26 (dt, 1H), 8,03 (s, 1H), 7,39 (dd, 1H), 7,16 (dd, 1H), 7,00 (s, 1H), 6,60 (br s, 1H), 4,10 (qd, 1H), 3,93 (dt, 1H), 3,89-3,76 (m, 2H), 3,38-3,29 (m, 1H), 2,11-2,02 (m, 1H), 2,00-1,83 (m, 3H)
504	¹ H RMN (acetona- <i>d</i> ₆) δ: 9,29-9,35 (m, 2H), 8,62 (d, J=2,4 Hz, 1H), 8,46 (d, J=9,8 Hz, 1H), 7,89 (d, J=8,8 Hz, 2H), 7,68 (d, J=6,6 Hz, 1H), 7,42 (dd, J=7,5 Hz, 1H), 4,62 (t, J=5,5 Hz, 1H), 3,57 (t, J=5,8 Hz, 2H), 3,39 (s, 6H)

^a Los datos de ¹H RMN están en ppm campo abajo del tetrametilsilano. Los acoplamientos se designan por (s)-singlete, (d)-duplete, (t)-triplete, (m)-multiplete, (dd)-duplete de dupletes, (dt)-duplete de tripletes, (br)-ancho.

Ejemplos biológicos de la invención

Formulación y metodología de pulverización para los ensayos A-F

- 5 Los compuestos de ensayo se formularon usando una disolución que contenía 10% de acetona, 90% de agua y 300 ppm de tensioactivo no iónico de Fórmula Lo-Espuma Extensora X-77® que contenía alquilarilpolioxietileno, ácidos grasos libres, glicoles e isopropanol (Loveland Industries, Inc. Greeley, Colorado, EE.UU.). Los compuestos formulados se aplicaron a 1 mL de líquido a través de una boquilla atomizadora SUJ2 con un cuerpo personalizado de 1/8 JJ (Spraying Systems Co., Wheaton, Illinois, EE.UU.) colocado 1,27 cm (0,5 pulgadas) por encima de la parte superior de cada unidad de ensayo. Los compuestos de ensayo se pulverizaron a las tasas adecuadas, y cada ensayo se replicó tres veces.
- 10 **Ensayo A**
- Para evaluar el control de la polilla de dorso negro (*Plutella xylostella* (L.)) la unidad de ensayo consistió en un pequeño recipiente abierto con una planta de mostaza de 12-14 días dentro. Esta se pre-infestó con ~50 larvas neonatas que se repartieron a la unidad de ensayo por medio de arenillas de mazorca usando un inoculador. Las larvas se movieron a la planta de ensayo después de repartirse a la unidad de ensayo.
- 15 Los compuestos de ensayo se formularon y se pulverizaron a 250 y/o 50 ppm. Después de la pulverización del

compuesto de ensayo formulado, cada unidad de ensayo se dejó secar durante 1 hora y después se colocó una tapa negra con rejilla en la parte superior. Las unidades de ensayo se dejaron durante 6 días en una cámara de crecimiento a 25°C y 70% de humedad relativa. El daño por alimentación de la planta se evaluó entonces visualmente en base a follaje consumido, y las larvas se evaluaron por mortalidad.

- 5 De los compuestos de Fórmula 1 probados a 250 ppm, los siguientes proporcionaron niveles muy buenos a excelentes de eficacia de control (40% o menos de daño por alimentación y/o 100% de mortalidad): 309, 501, 502, 344, 431 y 466.

Ensayo B

- 10 Para evaluar el control del saltahoja de la patata (*Empoasca fabae* (Harris)) a través de medios de contacto y/o sistémicos, la unidad de ensayo consistió en un pequeño recipiente abierto con una planta de judía Soleil de 5-6 días (hojas primarias salidas) dentro. Se añadió arena blanca a la parte superior del suelo, y una de las hojas primarias se cortó antes de la aplicación del compuesto de ensayo.

- 15 Los compuestos de ensayo se formularon y se pulverizaron a 250 y/o 50 ppm. Después de pulverizar el compuesto de ensayo formulado, las unidades de ensayo se dejaron secar durante 1 hora antes de post-infestarse con 5 saltahoja de la patata (adultos de 18 a 21 días). Se puso una tapa negra con rejilla en la parte superior de la unidad de ensayo, y las unidades de ensayo se dejaron durante 6 días en una cámara de crecimiento a 24°C y 70% de humedad relativa. Cada unidad de ensayo se evaluó visualmente después para la mortalidad de insectos.

De los compuestos de Fórmula 1 probados a 250 ppm, los siguientes dieron por resultado al menos 80% de mortalidad: 21, 131, 133, 300, 309, 366, 367, 368, 370, 375, 380, 382, 386, 387, 388, 409 y 466.

- 20 De los compuestos de Fórmula 1 probados a 50 ppm, los siguientes dieron por resultado al menos 80% de mortalidad: 309, 375, 380, 382, 386, 387 y 388.

Ensayo C

- 25 Para evaluar el control del pulgón del melocotón verde (*Myzus persicae* (Sulzer)) a través de medios de contacto y/o sistémicos, la unidad de ensayo consistió en un pequeño recipiente abierto con una planta de rábano de 12-15 días dentro. Esta se pre-infestó poniendo en una hoja de la planta de ensayo 30-40 pulgones en un trozo de hoja cortada de una planta cultivada (método de hoja cortada). Los pulgones se movieron a la planta de ensayo mientras el trozo de hoja se secaba. Después de la pre-infestación, el suelo de la unidad de ensayo se cubrió con una capa de arena.

- 30 Los compuestos de ensayo se formularon y se pulverizaron a 250 y/o 50 ppm. Después de la pulverización del compuesto de ensayo formulado, cada unidad de ensayo se dejó secar durante 1 hora y después se puso una tapa negra con rejilla en la parte superior. Las unidades de ensayo se dejaron durante 6 días en una cámara de crecimiento a 19-21°C y 50-70% de humedad relativa. Cada unidad de ensayo se evaluó después visualmente para la mortalidad de insectos.

- 35 De los compuestos de Fórmula 1 probados a 250 ppm, los siguientes dieron por resultado al menos 80% de mortalidad: 1, 6, 7, 8, 10, 11, 12, 13, 14, 15, 16, 17, 18, 19, 20, 21, 24, 25, 26, 27, 28, 34, 35, 36, 37, 39, 41, 42, 44, 46, 49, 52, 53, 54, 55, 56, 57, 58, 60, 61, 62, 63, 64, 66, 67, 68, 69, 70, 72, 73, 74, 75, 76, 131, 132, 133, 300, 308, 309, 320, 321, 322, 323, 324, 326, 329, 330, 331, 332, 333, 334, 335, 336, 338, 340, 341, 342, 343, 344, 345, 346, 348, 350, 351, 352, 353, 354, 363, 364, 366, 370, 372, 374, 375, 376, 377, 378, 380, 381, 382, 387, 388, 393, 400, 401, 402, 403, 404, 409, 410, 411, 412, 413, 415, 416, 419, 462, 463, 464, 500, 501, 502 y 503.

- 40 De los compuestos de Fórmula 1 probados a 50 ppm, los siguientes dieron por resultado al menos 80% de mortalidad: 6, 7, 8, 10, 11, 12, 13, 14, 16, 17, 18, 19, 21, 24, 25, 26, 27, 28, 34, 35, 36, 37, 39, 41, 42, 46, 49, 52, 53, 54, 55, 56, 57, 58, 60, 62, 63, 64, 66, 67, 68, 69, 73, 75, 76, 131, 132, 133, 300, 308, 309, 320, 322, 323, 324, 325, 326, 329, 330, 331, 332, 333, 334, 335, 336, 338, 340, 342, 343, 344, 345, 346, 348, 350, 351, 352, 353, 354, 366, 374, 375, 376, 378, 380, 382, 387, 388, 401, 402, 403, 404, 409, 410, 411, 412, 413, 415, 419, 462, 463, 464, 500, 501, 502 y 503.

45 Ensayo D

Para evaluar el control del pulgón de algodón y el melón (*Aphis gossypii* (Glover)) a través de medios de contacto y/o sistémicos, la unidad de ensayo consistió en un pequeño recipiente abierto con una planta de algodón de 6-7 días dentro. Esta se pre-infestó con 30-40 insectos en un trozo de hoja según el método de hoja cortada, y el suelo de la unidad de ensayo se cubrió con una capa de arena.

- 50 Los compuestos de ensayo se formularon y se pulverizaron a 250 y/o 50 ppm. Después de pulverizar, las unidades de ensayo se mantuvieron en una cámara de crecimiento durante 6 días a 19°C y 70% de humedad relativa. Cada unidad de ensayo se evaluó después visualmente para la mortalidad de insectos.

De los compuestos de Fórmula 1 probados a 250 ppm, los siguientes dieron por resultado al menos 80% de mortalidad: 6, 7, 8, 11, 12, 14, 16, 19, 21, 24, 25, 37, 39, 40, 41, 52, 54, 55, 58, 62, 63, 64, 66, 67, 68, 69, 70, 131,

133, 309, 323, 336, 342, 345, 348, 350, 351, 353, 366, 401, 403, 412, 419, 462, 464, 500, 501 y 503.

De los compuestos de Fórmula 1 probados a 50 ppm, los siguientes dieron por resultado al menos 80% de mortalidad: 6, 8, 14, 16, 19, 21, 24, 39, 41, 42, 52, 54, 55, 58, 67, 76, 131, 133, 323, 348, 351, 401 y 403.

Ensayo E

- 5 Para evaluar el control de los trips de las flores occidentales (*Frankliniella occidentalis* (Pergande)) a través de medios de contacto y/o sistémicos, la unidad de ensayo consistió en un pequeño recipiente abierto con una planta de judía Soleil de 5-7 días dentro.

10 Los compuestos de ensayo se formularon y pulverizaron a 250 y/o 50 ppm. Después de pulverizar, las unidades de ensayo se dejaron secar durante 1 hora, y después se añadieron 22-27 trips adultos a cada unidad. Una tapa negra con rejilla se puso en la parte superior, y las unidades de ensayo se dejaron durante 6 días a 25°C y 45-55% de humedad relativa.

De los compuestos de Fórmula 1 probados a 250 ppm, los siguientes proporcionaron niveles muy buenos a excelentes de eficacia de control (30% o menos de daño a la planta y/o 100% de mortalidad): 13, 64, 68, 70, 72, 131, 132, 133, 314, 340, 348, 367, 409, 410, 415, 464 y 504.

15 Ensayo F

20 Para evaluar el control de la mosca blanca de la batata (*Bemisia tabaci* (Gennadius)) a través de medios de contacto y/o sistémicos, la unidad de ensayo consistió en un pequeño recipiente abierto con una planta de algodón de 12-14 días dentro. Antes de la aplicación del pulverizado, ambos cotiledones se eliminaron de la planta, dejando una hoja real para el ensayo. Se dejó a las moscas blancas adultas poner huevos en la planta y después se quitaron de la unidad de ensayo. Las plantas de algodón infestadas con al menos 15 huevos se sometieron al ensayo por pulverización.

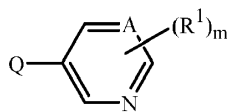
25 Los compuestos de ensayo se formularon y se pulverizaron a 250 y/o 50 ppm. Después de pulverizar, las unidades de ensayo se dejaron secar durante 1 hora. Los cilindros se quitaron entonces y las unidades se llevaron a una cámara de crecimiento y se dejaron 13 días a 28°C y 50-70% de humedad relativa. Cada unidad de ensayo se evaluó después visualmente para la mortalidad de insectos.

De los compuestos de Fórmula 1 probados a 250 ppm, los siguientes dieron por resultado al menos 50% de mortalidad: 8, 42, 58, 63, 64, 68, 72, 321, 324, 326, 330, 334, 339, 340, 348, 349, 360, 366, 368, 402, 403, 412 y 463.

30 De los compuestos de Fórmula 1 probados a 50 ppm, los siguientes dieron por resultado al menos 50% de mortalidad: 326.

REIVINDICACIONES

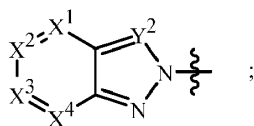
1. Un compuesto seleccionado de la Fórmula 1, un *N*-óxido o sal del mismo,



1

en el que

5 Q es



Q-2

A es CH, CR¹ o N;

cada R¹ es independientemente halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquiltio C₁-C₄ o haloalquiltio C₁-C₄;

10 m es 0, 1, 2 o 3;

X¹ es CR², y X², X³ y X⁴ son cada uno independientemente CR³; o X² es CR², y X¹, X³ y X⁴ son cada uno independientemente CR³;

R² es C(=Z)NR⁶R⁷, N(R⁸)C(=Z)R⁹, C(=NR¹⁰)R¹¹ o Q^a;

cada Z es independientemente O o S;

15 cada R³ es independientemente H, halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ o haloalcoxi C₁-C₄;

Y² es CR^{5a};

R^{5a} es H, halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ o haloalcoxi C₁-C₄;

20 R⁶ es H, NR¹⁵R¹⁶, OR¹⁷, C(=NR¹⁰)R¹¹, C(O)OR²¹, C(O)NR¹⁵R¹⁶, C(O)R²², S(O)_nR²³ o Q^b; o alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alqueno C₂-C₆ o alquino C₂-C₆, cada uno no sustituido o sustituido con al menos un R^x;

R⁷ es H, o Q^b; o alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alqueno C₂-C₆ o alquino C₂-C₆, cada uno no sustituido o sustituido con al menos un R^x; o

25 R⁶ y R se toman junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos para formar un anillo de 3 a 10 miembros que contienen miembros anulares seleccionados de átomos de carbono y hasta 2 heteroátomos seleccionados independientemente de un átomo de oxígeno, un átomo de azufre, en el que hasta 2 miembros anulares de átomo de carbono se seleccionan independientemente de C(=O) y C(=S) y el miembro anular de átomo de azufre se selecciona de S, S(O) o S(O)₂, estando dicho anillo no sustituido o sustituido con hasta 4 R^x; o

R⁶ y R⁷ se toman juntos como =S(O)_pR¹⁸R¹⁹ o =S(=NR²⁰)R¹⁸R¹⁹;

30 cada R^x es independientemente halógeno, ciano, nitro, hidroxilo, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, cicloalcoxi C₃-C₆, C(=NR¹⁰)R¹¹, C(O)OR²¹, C(O)NR¹⁵R¹⁶, OC(O)R²², NR²⁵R²⁶, NR²⁴C(O)R²², C(O)R²², S(O)_nR²³, Si(R²⁸)₃, OSi(R²⁸)₃ o Q^b;

R⁸ es H, C(O)OR²¹, C(O)NR¹⁵R¹⁶, C(O)R²², S(O)_nR²³ o Q^b; o alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alqueno C₂-C₆ o alquino C₂-C₆, cada uno no sustituido o sustituido con al menos un R^x;

35 R⁹ es H, C(=NR¹⁰)R¹¹, OR²¹ o NR¹⁵R¹⁶, o alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alqueno C₂-C₆ o alquino C₂-C₆, cada uno no sustituido o sustituido con al menos un R^x; o fenilo, fenoxi o un anillo aromático heterocíclico de 5 o 6 miembros, cada uno no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄; o un anillo no aromático heterocíclico de 3 a 6 miembros, conteniendo cada anillo miembros

- anulares seleccionados de átomos de carbono y hasta 3 heteroátomos independientemente seleccionados de un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y hasta 2 átomos de nitrógeno, en los que hasta 1 miembro anular átomo de carbono se selecciona independientemente de C(=O) y C(=S) y el miembro anular átomo de azufre se selecciona de S, S(O) o S(O)₂, estando cada anillo no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄;
- 5 cada R¹⁰ es independientemente OR¹², S(O)_nR¹³ o NHR¹⁴;
- cada R¹¹ es independientemente H; o alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alqueno C₂-C₆ o alquino C₂-C₆, cada uno no sustituido o sustituido con al menos un R^x; o alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, cicloalcoxi C₃-C₆, C(O)OR²¹, C(O)NR¹⁵R¹⁶, NR²⁵R²⁶, NR²⁴C(O)R²², C(O)R²² o Q^b;
- 10 cada R¹² es independientemente alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, C(O)R²², S(O)_nR¹³ o Q^b;
- cada R¹³ es independientemente alquilo C₁-C₄ o haloalquilo C₁-C₄;
- R¹⁴ es alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, C(O)R²² o C(O)OR²¹; o fenilo, no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente seleccionado independientemente del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄;
- 15 cada R¹⁵ es independientemente H, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₄, C(O)R²⁷ o S(O)₂R²⁷; o fenilo o un anillo aromático heterocíclico de 5 o 6 miembros, cada uno no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄;
- 20 cada R¹⁶ es independientemente H, alquilo C₁-C₆ o haloalquilo C₁-C₄; o
- R¹⁵ y R¹⁶ se toman junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos para formar un anillo de 3 a 7 miembros que contiene miembros anulares seleccionados de átomos de carbono y hasta 2 heteroátomos independientemente seleccionados de un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y hasta 2 átomos de nitrógeno, en el que hasta 2 miembros anulares átomo de carbono se seleccionan independientemente de C(=O) y C(=S) y el miembro anular átomo de azufre se selecciona de S, S(O) o S(O)₂, estando dicho anillo no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄;
- 25 R¹⁷ es alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆ o haloalquilo C₁-C₄; o fenilo, no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄;
- 30 cada R¹⁸ es independientemente alquilo C₁-C₄ o haloalquilo C₁-C₄; o fenilo, no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄;
- cada R¹⁹ es independientemente alquilo C₁-C₄ o haloalquilo C₁-C₄; o fenilo, no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄; o
- 35 R¹⁸ y R¹⁹ se toman con el átomo de azufre al que están unidos para formar un anillo;
- R²⁰ es H, ciano, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄ o C(O)R²²; o fenilo, no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄;
- 40 cada R²¹ es independientemente alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆ o halocicloalquilo C₃-C₆; o fenilo, no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄;
- cada R²² es independientemente alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆ o halocicloalquilo C₃-C₆; o fenilo, no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄;
- 45 cada R²³ es independientemente alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, cicloalquilalquilo C₃-C₆ o halocicloalquilalquilo C₃-C₆; o fenilo, no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄;
- 50 cada R²⁴ es independientemente alquilo C₁-C₄;

cada R²⁵ es independientemente H, alquilo C₁-C₄ o haloalquilo C₁-C₄; o fenilo, no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄;

5 cada R²⁶ es independientemente alquilo C₁-C₄ o haloalquilo C₁-C₄; o fenilo, no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄; o

10 R²⁵ y R²⁶ se toman independientemente junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos para formar un anillo de 3 a 7 miembros que contiene miembros anulares seleccionados de átomos de carbono y hasta 2 heteroátomos independientemente seleccionados de un átomo de oxígeno, un átomo de azufre, y hasta 2 átomos de nitrógeno, en el que hasta 2 miembros anulares átomo de carbono se seleccionan independientemente de C(=O) y C(=S) y el miembro anular átomo de azufre se selecciona de S, S(O) o S(O)₂, estando dicho anillo no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄;

15 cada R²⁷ es independientemente alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆ o NR²⁹R³⁰; o fenilo o un anillo aromático heterocíclico de 5 a 6 miembros, cada uno no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄;

cada R²⁸ es independientemente alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆ o fenilo;

20 cada R²⁹ es independientemente H o Q^b; o alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alqueno C₂-C₆ o alquino C₂-C₆, cada uno no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄;

cada R³⁰ es independientemente H o Q^b; o alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alqueno C₂-C₆ o alquino C₂-C₆, cada uno no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄; o

25 R²⁹ y R³⁰ se toman junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos para formar un anillo de 3 a 10 miembros que contiene miembros anulares seleccionados de átomos de carbono y hasta 2 heteroátomos independientemente seleccionados de un átomo de oxígeno, un átomo de azufre, y hasta 2 átomos de nitrógeno, en el que hasta 2 miembros anulares átomo de carbono se seleccionan independientemente de C(=O) y C(=S) y el miembro anular átomo de azufre se selecciona de S, S(O) o S(O)₂, estando dicho anillo no sustituido o sustituido con hasta 4 sustituyentes independientemente seleccionados del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄;

35 Q^a es un anillo o sistema anular aromático de 5 a 10 miembros, conteniendo cada anillo o sistema anular miembros anulares seleccionados de átomos de carbono y hasta 3 heteroátomos independientemente seleccionados de un átomo de oxígeno, un átomo de azufre y hasta 3 átomos de nitrógeno, en el que hasta 2 miembros anulares átomo de carbono se seleccionan independientemente de C(=O) y C(=S) y el miembro anular átomo de azufre se selecciona de S, S(O) o S(O)₂, estando cada anillo o sistema anular no sustituido o sustituido con al menos un R^x; o un anillo parcialmente saturado de 3 a 6 miembros, conteniendo cada anillo miembros anulares seleccionados de átomos de carbono y hasta 2 heteroátomos independientemente seleccionados de un átomo de oxígeno, un átomo de azufre, y hasta 2 átomos de nitrógeno, en el que hasta 2 miembros anulares átomo de carbono se seleccionan independientemente de C(=O) y C(=S) y el miembro anular átomo de azufre se selecciona de S, S(O) o S(O)₂, cada anillo no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄;

45 cada Q^b es independientemente fenilo, un anillo aromático heterocíclico de 5 o 6 miembros o un anillo no aromático heterocíclico de 3 a 6 miembros, conteniendo cada anillo miembros anulares seleccionados de átomos de carbono y hasta 2 heteroátomos independientemente seleccionados de un átomo de oxígeno, un átomo de azufre, y hasta 2 átomos de nitrógeno, en el que hasta 2 miembros anulares átomo de carbono se seleccionan independientemente de C(=O) y C(=S) y el miembro anular átomo de azufre se selecciona de S, S(O) o S(O)₂, cada anillo no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente independientemente seleccionado del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄;

cada n es independientemente 0, 1 o 2; y

p es 1 o 2.

2. El compuesto según la reivindicación 1 en el que

A es CH o CF; y

m es 0.

3. El compuesto según la reivindicación 1 que se selecciona del grupo que consiste en:

N-(1-metiletil)-2-(3-piridinil)-2*H*-indazol-4-carboxamida;

N-ciclopropil-2-(3-piridinil)-2*H*-indazol-4-carboxamida;

5 *N*-ciclohexil-2-(3-piridinil)-2*H*-indazol-4-carboxamida;

2-(3-piridinil)-*N*-(2,2,2-trifluoroetil)-2*H*-indazol-4-carboxamida;

2-(3-piridinil)-*N*-[(tetrahidro-2-furanil)metil]-2*H*-indazol-5-carboxamida;

2-[[2-(3-piridinil)-2*H*-indazol-5-il]carbonil]hidrazinacarboxilato de metilo;

N-(2,2-difluoropropil)-2-(3-piridinil)-2*H*-indazol-5-carboxamida;

10 2-(3-piridinil)-*N*-(2-pirimidinilmetil)-2*H*-indazol-5-carboxamida; y

N-[(5-metil-2-pirazinil)metil]-2-(3-piridinil)-2*H*-indazol-5-carboxamida.

4. Una composición que comprende un compuesto según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3 y al menos un componente adicional seleccionado del grupo que consiste en tensioactivos, diluyentes sólidos y diluyentes líquidos, comprendiendo dicha composición opcionalmente además al menos un compuesto o agente biológicamente activo adicional.

5. La composición según la reivindicación 4 en la que al menos un compuesto o agente biológicamente activo adicional se selecciona del grupo que consiste en abamectina, acefato, acequinocilo, acetamiprid, acrinatrina, afidopiropeno, amidoflumet, amitraz, avermectina, azadiractina, azinfos-metilo, benfuracarb, bensultap, bifentrina, bifenazato, bistriflurona, borato, buprofezina, cadusafos, carbarilo, carbofurano, cartap, carzol, clorantraniliprol, clorfenapir, clorfluazurona, clorpirifos, clorpirifos-metilo, cromarfenozida, clofentezina, clotianidina, ciantraniliprol, ciclaniliprol, cicloprotrina, cicloxaprid, ciflometofeno, ciflutrina, beta-ciflutrina, cihalotrina, gamma-cihalotrina, lambda-cihalotrina, cipermetrina, alfa-cipermetrina, zeta-cipermetrina, ciromazina, deltametrina, diafentiurona, diazinona, dieldrina, dflubenzurona, dimeflutrina, dimehipo, dimetoato, dinotefurano, diofenolano, emamectina, endosulfano, esfenvalerato, etiprol, etofenprox, etoxazol, óxido de fenbutatina, fenitrotiona, fenotiocarb, fenoxicarb, fenpropatrina, fenvalerato, fipronilo, flometoquina, flonicamid, flubendiamida, flucitrinato, flufenerim, flufenoxurona, flufenoxiestrobina, fluensulfona, flupiram, flupiradifurona, fluvalinato, tau-fluvalinato, fonofos, formetanato, fostiazato, halofenozida, heptaflutrina, hexaflumurona, hexitiazox, hidrametilnona, imidacloprid, indoxacarb, jabones insecticidas, isofenfos, lufenurona, malatión, meperflutrina, metaflumizona, metaldehído, metamidofos, metidationa, metiodicarb, metomilo, metopreno, metoxiclor, metoxifeno, metoflutrina, monocrotofos, monfluorotrina, nicotina, nitenpiram, nitiazina, novalurona, noviflumurona, oxamilo, paratión, paratión-metilo, permetrina, forato, fosalona, fosmet, fosfamidona, pirimicarb, profenofos, proflutrina, propargita, protrifenbute, piflubumida, pimetrozina, pirafuprol, piretrina, piridabeno, piridalilo, pirifluquinazona, piriminostrobina, piriprol, piriproxifeno, rotenona, rianodina, silafluofeno, espinetoram, espinosad, espirodiclofeno, espiromesifeno, espirotetramat, sulprofos, sulfoxaflor, tebufenozida, tebufenpirad, teflubenzurona, teflutrina, terbufos, tetraclorinfos, tetrametrina, tetrametilflutrina, tiacloprid, tiametoxam, tiodicarb, tiosultap-sodio, tioxafeno, tolfenpirad, tralometrina, triazamato, triclorfona, triflumezopirim, triflumurona, delta-endotoxinas de *Bacillus thuringiensis*, bacterias entomopatógenas, virus entomopatógenos y hongos entomopatógenos.

6. La composición según la reivindicación 5 en la que al menos un compuesto o agente biológicamente activo adicional se selecciona del grupo que consiste en abamectina, acetamiprid, acrinatrina, afidopiropeno, amitraz, avermectina, azadiractina, benfuracarb, bensultap, bifentrina, buprofezina, cadusafos, carbarilo, cartap, clorantraniliprol, clorfenapir, clorpirifos, clotianidina, ciantraniliprol, ciclaniliprol, cicloprotrina, ciflutrina, beta-ciflutrina, cihalotrina, gamma-cihalotrina, lambda-cihalotrina, cipermetrina, alfa-cipermetrina, zeta-cipermetrina, ciromazina, deltametrina, dieldrina, dinotefurano, diofenolano, emamectina, endosulfano, esfenvalerato, etiprol, etofenprox, etoxazol, fenitrotiona, fenotiocarb, fenoxicarb, fenvalerato, fipronilo, flometoquina, flonicamid, flubendiamida, flufenoxurona, flufenoxiestrobina, fluensulfona, flupiradifurona, fluvalinato, formetanato, fostiazato, heptaflutrina, hexaflumurona, hidrametilnona, imidacloprid, indoxacarb, lufenurona, meperflutrina, metaflumizona, metiodicarb, metomilo, metopreno, metoxifeno, metoflutrina, monfluorotrina, nitepiram, nitiazina, novalurona, oxamilo, piflubumida, pimetrozina, piretrina, piridabeno, piridalilo, piriminostrobina, piriproxifeno, rianodina, espinetoram, espinosad, espirodiclofeno, espiromesifeno, espirotetramat, sulfoxaflor, tebufenozida, tetrametrina, tetrametilflutrina, tiacloprid, tiametoxam, tiodicarb, tiosultap-sodio, tralometrina, triazamato, triflumezopirim, triflumurona, delta-endotoxinas de *Bacillus thuringiensis*, todas las cepas de *Bacillus thuringiensis* y todas las cepas de virus de nucleopolihedrosis.

7. Un método para controlar una plaga de invertebrados que comprende poner en contacto una plaga de invertebrados o su medio con una cantidad biológicamente efectiva de un compuesto según cualquiera de las

reivindicaciones 1 a 3, con la condición de que el método no sea un método de tratamiento del cuerpo humano o animal por terapia.

8. El método según la reivindicación 7 en el que el medio es una planta.

9. El método según la reivindicación 7 en el que el medio es una semilla.

5 10. El método según la reivindicación 9 en el que la semilla está recubierta con el compuesto según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3 formulado como una composición que comprende un formador de película o agente adhesivo.

10 11. Un compuesto según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, para usar en la protección de un animal de una plaga parasitaria de invertebrados o para el control de la infestación o infección de un animal por una plaga parasitaria de invertebrados.

12. Una semilla tratada que comprende un compuesto según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3 en una cantidad de 0,0001 a 1% en peso de la semilla antes de tratamiento.

15 13. Un compuesto seleccionado del grupo que consiste en ácido 2-(3-piridinil)-2*H*-indazol-5-carboxílico, cloruro de 2-(3-piridinil)-2*H*-indazol-5-carbonilo, ácido 2-(3-piridinil)-2*H*-indazol-4-carboxílico y cloruro de 2-(3-piridinil)-2*H*-indazol-4-carbonilo.