



19



OFICINA ESPAÑOLA DE  
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA

11 Número de publicación: **2 353 159**

51 Int. Cl.:  
**C07D 283/00** (2006.01)  
**A01P 5/00** (2006.01)  
**A01P 7/04** (2006.01)  
**A01P 9/00** (2006.01)  
**A01N 43/78** (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Número de solicitud europea: **06779070 .9**  
96 Fecha de presentación : **02.08.2006**  
97 Número de publicación de la solicitud: **1919886**  
97 Fecha de publicación de la solicitud: **14.05.2008**

54 Título: **Compuestos químicos.**

30 Prioridad: **15.08.2005 GB 0516706**

45 Fecha de publicación de la mención BOPI:  
**25.02.2011**

45 Fecha de la publicación del folleto de la patente:  
**25.02.2011**

73 Titular/es: **SYNGENTA PARTICIPATIONS AG.**  
**Schwarzwaldallee 215**  
**4058 Basel, CH**  
**SYNGENTA LIMITED**

72 Inventor/es: **Luethy, Christophe;**  
**Elliott, Alison, Clare;**  
**O'Sullivan, Anthony, Cornelius;**  
**Schaetzer, Juergen, Harry y**  
**Mathews, Christopher, John**

74 Agente: **Lehmann Novo, María Isabel**

ES 2 353 159 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

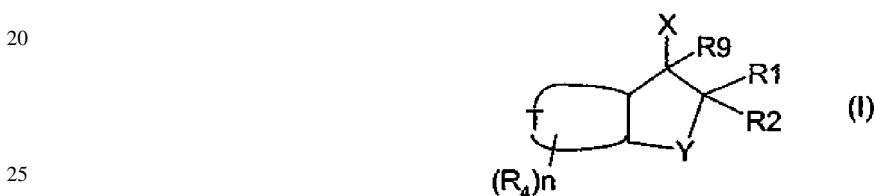
Compuestos químicos.

5 La presente invención se refiere a derivados de tiazolina, a procesos para prepararlos, a composiciones insecticidas, acaricidas, moluscicidas y nematocidas que los contienen y a métodos para usarlos en el combate y control de plagas de insectos, ácaros, moluscos y nematodos.

10 Derivados de tiazolina con propiedades farmacéuticas se dan a conocer por ejemplo en WO 2005/063724, DE 2658138, US3636219, IN 179230 y Coll. Czech Chem. Comm, 1992, 57, 415.

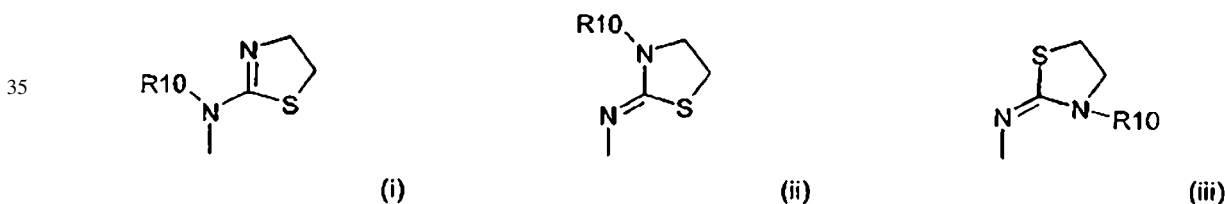
En la actualidad se encontró sorprendentemente que ciertas tiazolinas tienen buenas propiedades insecticidas.

15 Por consiguiente, la presente invención estipula un método para combatir y controlar insectos, ácaros, nematodos o moluscos que comprende aplicar a una plaga, al sitio de una plaga, o a una planta susceptible de ser atacada por una plaga una cantidad insecticidamente, acaricidamente, nematocidamente, o moluscicidamente eficaz de un compuesto de fórmula (I):



donde

30 X es (i), (ii) o (iii)



Y es O, S(O)<sub>m</sub>, NR<sup>3</sup>, CR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>, CR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>-CR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>, O-CR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>, S(O)<sub>m</sub>-CR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>, NR<sup>3</sup>-CR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>, CR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>-O, CR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>-S(O)<sub>m</sub>, CR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>-NR<sup>3</sup>, SO<sub>2</sub>-NR<sup>3</sup>, NR<sup>3</sup>-SO<sub>2</sub>, NR<sup>3</sup>-O o O-NR<sup>3</sup>;

45 m es 0, 1 o 2;

el anillo (T)



es un anillo aromático o heteroaromático de 5 o 6 miembros;

60 R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup> y R<sup>8</sup> son cada uno independientemente H, OH, halógeno, nitro, ciano, rodano, carboxi, formilo, formiloxi, G-, G-O-, G-S-, G-A-, R<sup>21</sup>R<sup>22</sup>N-, R<sup>21</sup>R<sup>22</sup>N-A-, G-O-A-, G-S-A-, G-A-O-, G-A-S-, G-A-NR<sup>23</sup>-, R<sup>21</sup>R<sup>22</sup>N-A-O-, R<sup>21</sup>R<sup>22</sup>N-A-S-, R<sup>21</sup>R<sup>22</sup>N-A-NR<sup>23</sup>-, G-O-A-O-, G-O-A-S-, G-O-A-NR<sup>23</sup>-, G-S-A-O, G-S-A-NR<sup>23</sup>- o R<sup>20</sup>S(O)(=NR<sup>17</sup>)-; o dos de los grupos R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup> y R<sup>8</sup> unidos al mismo átomo de carbono son =O, =S, =NR<sup>11</sup> o =CR<sup>12</sup>-R<sup>13</sup>, o los grupos R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup>, R<sup>5</sup> y R<sup>6</sup> o R<sup>7</sup> y R<sup>8</sup> junto con el átomo de carbono al cual están unidos forman un anillo de tres a seis miembros, que contiene al menos 2 átomos de carbono y opcionalmente uno o dos átomos de azufre y/o uno o dos átomos de oxígeno no adyacentes o un grupo NR<sup>14</sup>, donde el anillo está opcionalmente sustituido con C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>alquilo; o dos de los grupos R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup> y R<sup>8</sup> unidos a átomos diferentes junto con los átomos a los cuales están unidos forman un anillo de tres a siete miembros, que contiene opcionalmente uno o dos átomos de azufre y/o

65

## ES 2 353 159 T3

uno o dos átomos de oxígeno no adyacentes o un grupo NR<sup>14</sup>, donde el anillo está opcionalmente sustituido con C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>alquilo o dos de los grupos R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup> y R<sup>8</sup> unidos a átomos adyacentes se combinan para formar un enlace;

5 R<sup>10</sup> es H, OH, ciano, formilo, tri(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>alquil)sililo, G-, G-O-, G-S-, G-S-S-, G-A-, R<sup>24</sup>R<sup>25</sup>N-, R<sup>24</sup>R<sup>25</sup>N-S, R<sup>24</sup>R<sup>25</sup>N-A-, R<sup>18</sup>N=C(R<sup>19</sup>)-, G-A-NR<sup>69</sup>-, R<sup>70</sup>R<sup>71</sup>C=N-, G-O-A- o G-S-A-,

R<sup>11</sup> es H, OH, nitro, ciano, formilo, formiloxi, G-, G-O-, G-A-, R<sup>36</sup>R<sup>37</sup>N-, G-C(O)-O-, G-C(O)-NR<sup>26</sup>-, R<sup>36</sup>R<sup>37</sup>N-C(O)O-, G-OC(O)O-, G-OC(O)-NR<sup>26</sup>-;

10 R<sup>12</sup> y R<sup>13</sup> son cada uno independientemente H, halógeno, nitro, ciano, formilo, formiloxi, G-, G-O-, G-S-, G-A-, R<sup>40</sup>R<sup>41</sup>N-A-, G-O-A-, G-A-O-, R<sup>40</sup>R<sup>41</sup>N-A-, R<sup>40</sup>R<sup>41</sup>N-A-O-, R<sup>40</sup>R<sup>41</sup>N-A-S-, G-O-A-O-, G-O-A-S-, G-O-A-NR<sup>30</sup>-, o R<sup>12</sup> y R<sup>13</sup> junto con el átomo de carbono al cual están unidos forman un anillo carbocíclico de 3 a 6 miembros;

15 R<sup>3</sup>, R<sup>14</sup>, R<sup>15</sup> y R<sup>16</sup> son cada uno independientemente H, OH, ciano, formilo, G-, G-O-, G-S-, G-A-, R<sup>27</sup>R<sup>28</sup>N-, R<sup>27</sup>R<sup>28</sup>N-A-, G-O-A-, G-S-A-, G-A-NR<sup>29</sup>-, R<sup>27</sup>R<sup>28</sup>N-A-NR<sup>29</sup>-, G-O-A-NR<sup>29</sup>- o G-S-A-NR<sup>29</sup>-;

20 cada R<sup>4</sup> es independientemente OH, halógeno, nitro, ciano, azido, rodano, isotiocianato, carboxi, formilO, formiloxi, G-, G-O-, G-S-, G-A-, R<sup>31</sup>R<sup>32</sup>N-, R<sup>31</sup>R<sup>32</sup>N-A-, G-O-A-, G-S-A-, G-A-O-, G-A-S-, G-A-NR<sup>33</sup>-, R<sup>31</sup>R<sup>32</sup>N-A-O-, R<sup>31</sup>R<sup>32</sup>N-A-S-, R<sup>31</sup>R<sup>32</sup>N-A-NR<sup>33</sup>-, G-O-A-O-, G-O-A-S-, G-O-A-NR<sup>33</sup>-, G-S-A-O-, G-S-A-NR<sup>33</sup>-, R<sup>20</sup>S(O)(=NR<sup>17</sup>)-, R<sup>18</sup>N=C(R<sup>19</sup>)-, R<sup>44</sup>R<sup>45</sup>P(O)- o R<sup>44</sup>R<sup>45</sup>P(S)-, o 2 grupos R<sup>4</sup> adyacentes junto con los átomos de carbono a los cuales están unidos forman un anillo carbocíclico o heterocíclico de 4, 5, 6 o 7 miembros que puede estar opcionalmente sustituido con halógeno, o un grupo R<sup>4</sup> junto con un grupo R<sup>3</sup>, R<sup>5</sup> o R<sup>9</sup> y los átomos a los cuales están unidos forman un anillo de 5-7 miembros que contiene opcionalmente un grupo NR<sup>15</sup> o un átomo de S u O, donde el anillo está

25 n es 0, 1, 2, 3 o 4;

30 R<sup>9</sup> es H, formilo, G, G-A-, R<sup>34</sup>R<sup>35</sup>N-A-, G-O-A- o G-S-A-, o R<sup>9</sup> junto con un grupo R<sup>1</sup>, R<sup>5</sup> o R<sup>7</sup> y los átomos a los cuales están unidos pueden formar un anillo de tres a siete miembros, que puede contener opcionalmente uno o dos átomos de azufre y/o uno o dos átomos de oxígeno no adyacentes o un grupo NR<sup>16</sup>;

R<sup>17</sup> es H, G-, G-C(O)- o G-OC(O)-;

35 R<sup>18</sup> es H, OH, ciano, nitro, G-, G-O- o R<sup>38</sup>R<sup>39</sup>N-;

R<sup>19</sup> es H, ciano, G-, G-O-, G-S o R<sup>42</sup>R<sup>43</sup>N-;

R<sup>20</sup> es C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>alquilo, fenilo opcionalmente sustituido o bencilo opcionalmente sustituido;

40 cada uno de los grupos R<sup>21</sup> a R<sup>43</sup> inclusive son independientemente H o G-, o dos grupos R<sup>21</sup>, R<sup>22</sup>, R<sup>27</sup>, R<sup>28</sup>, R<sup>31</sup>, R<sup>32</sup>, R<sup>34</sup>, R<sup>35</sup>, R<sup>36</sup>, R<sup>37</sup>, R<sup>38</sup>, R<sup>39</sup>, R<sup>42</sup>, R<sup>43</sup>, junto con el átomo de N al cual están unidos, forman un grupo N=CR<sup>a</sup>R<sup>b</sup> (donde R<sup>a</sup> y R<sup>b</sup> son H, o C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>alquilo) o dos grupos R<sup>21</sup>, R<sup>22</sup>, R<sup>24</sup>, R<sup>25</sup>, R<sup>27</sup>, R<sup>28</sup>, R<sup>31</sup>, R<sup>32</sup>, R<sup>34</sup>, R<sup>35</sup>, R<sup>36</sup>, R<sup>37</sup>, R<sup>38</sup>, R<sup>39</sup>, R<sup>42</sup>, R<sup>43</sup>, junto con el átomo de N al cual están unidos, forman un anillo heterocíclico de cinco, seis o siete miembros que puede contener uno o dos heteroátomos más, seleccionados entre O, N o S y que puede estar opcionalmente sustituido con

45 uno a cuatro grupos C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>alquilo;

R<sup>44</sup> y R<sup>45</sup> son independientemente C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>alquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>alcoxi, fenilo o fenoxi;

50 G es C<sub>1-12</sub>alquilo opcionalmente sustituido, C<sub>2-12</sub>alquenoil opcionalmente sustituido, C<sub>2-12</sub>alquinilo opcionalmente sustituido, C<sub>3-8</sub>cicloalquilo opcionalmente sustituido, C<sub>3-8</sub>cicloalquenoil opcionalmente sustituido, arilo opcionalmente sustituido, heteroarilo opcionalmente sustituido o heterociclilo opcionalmente sustituido;

R<sup>69</sup> es H, G-, G-C(O)- o G-OC(O)-;

55 R<sup>70</sup> y R<sup>71</sup> son independientemente H, ciano, nitro, G-, G-O-, G-S-, o R<sup>70</sup> y R<sup>71</sup> junto con el átomo de carbono al cual están unidos forman un anillo heterocíclico de cinco, seis o siete miembros el cual puede contener uno o dos heteroátomos más, seleccionados entre O, N o S y el cual puede estar opcionalmente sustituido con uno a cuatro grupos C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>alquilo;

60 A es S(O), SO<sub>2</sub>, C(O) o C(S);

o sus sales o N-óxidos.

65 Los compuestos de fórmula (I) pueden existir como diferentes isómeros ópticos o geométricos, o diferentes formas tautoméricas. Puede haber presente más de un centro quiral, por ejemplo en los átomos de carbono quirales CR<sup>1</sup>R<sup>2</sup>, CR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>, CR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>, CR<sup>9</sup>, o una unidad de carbono quiral en el grupo G, o una unidad -S(O)- quiral, en cuyo caso los compuestos de fórmula (I) pueden estar presentes como enantiómeros puros, mezclas de enantiómeros, diastereoisómeros

## ES 2 353 159 T3

puros o mezclas de diastereoisómeros. Puede haber dobles enlaces presentes en la molécula, como enlaces C=C O C=N, en cuyo caso los compuestos de fórmula (I) pueden existir como isómeros individuales o mezclas de isómeros. Puede haber presentes centros de tautomerización. Esta invención cubre todos los isómeros y tautómeros y sus mezclas en todas las proporciones al igual que las formas isotópicas como los compuestos deuterados.

5 Los compuestos de fórmula (I) contienen un residuo amidina, que puede existir en dos formas tautoméricas cuando R<sup>10</sup> es hidrógeno. Una de esas formas contiene un doble enlace C=N exocíclico, y una de ellas contiene un doble enlace C=N endocíclico. Cuando el doble enlace C=N es exocíclico este doble enlace puede existir en dos formas geométricas E y Z como se muestra mediante las fórmulas (I') y (I''). Cada forma puede estar sustituida con un grupo R<sup>10</sup>. Este grupo R<sup>10</sup> se selecciona de manera de permitir su remoción mediante un proceso o una combinación de procesos bioquímicos, químicos o físicos para obtener compuestos de fórmula I en los que R<sup>10</sup> es H, antes, durante o después de la aplicación al área o las plantas tratadas. Los ejemplos de estos procesos comprenden escisión enzimática, hidrólisis química y fotólisis. Los compuestos que tienen grupos R<sup>10</sup> pueden presentar ciertas ventajas, como mejor penetración de la cutícula de las plantas tratadas, mayor tolerancia de los cultivos, mejor compatibilidad o estabilidad en las mezclas formuladas que contienen otros herbicidas, antídotos de herbicidas, reguladores del crecimiento de las plantas, fungicidas o insecticidas, mayor movimiento en los suelos o menor lixiviado de los suelos.

Las sales de adición de ácido adecuadas incluyen las formadas con un ácido inorgánico como ácidos clorhídrico, bromhídrico, sulfúrico, nítrico y fosfórico, o con un ácido orgánico carboxílico como los ácidos oxálico, tartárico, láctico, butírico, toluico, hexanoico y ftálico, o ácidos sulfónicos como ácidos metano, benceno y toluenosulfónico. Otros ejemplos de ácidos carboxílicos orgánicos incluyen haloácidos como ácido trifluoroacético.

Los N-óxidos son formas oxidadas de aminas terciarias o formas oxidadas de compuestos heteroaromáticos que contienen nitrógeno. Se describen en muchos libros por ejemplo en "Heterocyclic N-oxides" de Angelo Albini y Silvio Pietra, CRC Press, Boca Raton, Florida, 1991.

Cada residuo alquilo ya sea solo o como parte de un grupo más grande (como G o alcoxi, alcoxicarbonilo, alquilcarbonilo, alquilaminocarbonilo, dialquilaminocarbonilo) es una cadena lineal o ramificada y es, por ejemplo, metilo, etilo, n-propilo, n-butilo, n-pentilo, n-hexilo, iso-propilo, n-butilo, sec-butilo, iso-butilo, terc-butilo o neo-pentilo. Los grupos alquilo son adecuadamente grupos alquilo C<sub>1</sub> a C<sub>12</sub>, pero son preferentemente grupos alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, más preferentemente C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, aún más preferentemente C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> y muy preferentemente C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>.

Los grupos alquileo, alqueniлено y alquinileno que forman anillos o cadenas pueden estar además opcionalmente sustituidos con uno o más halógenos, grupos C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>alquilo y/o C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>alcoxi.

35 Cuando están presentes, los sustituyentes opcionales en un residuo alquilo (solos o como parte de un grupo más grande como alcoxi, alcoxicarbonilo, alquilcarbonilo, alquilaminocarbonilo, dialquilaminocarbonilo) incluyen uno o más de: halógeno, nitro, ciano, rodano, isotiocianato, C<sub>3-7</sub>cicloalquilo (él mismo opcionalmente sustituido con C<sub>1-6</sub>alquilo o halógeno), C<sub>5-7</sub>cicloalqueno (él mismo opcionalmente sustituido con C<sub>1-6</sub>alquilo o halógeno), hidroxi, C<sub>1-10</sub>alcoxi, C<sub>1-10</sub>alcoxi(C<sub>1-10</sub>)alcoxi, tri(C<sub>1-4</sub>)alquilsilil(C<sub>1-6</sub>)alcoxi, C<sub>1-6</sub>alcoxicarbonil(C<sub>1-10</sub>)alcoxi, C<sub>1-10</sub>haloalcoxi, aril(C<sub>1-4</sub>)alcoxi (donde el grupo arilo está opcionalmente sustituido), C<sub>3-7</sub>cicloalquiloxi (donde el grupo cicloalquilo está opcionalmente sustituido con C<sub>1-6</sub>alquilo o halógeno), C<sub>2-10</sub>alqueniлоxi, C<sub>2-10</sub>alquiniлоxi, SH, C<sub>1-10</sub>alquiltio, C<sub>1-10</sub>haloalquiltio, aril(C<sub>1-4</sub>)alquiltio, (donde el grupo arilo está opcionalmente sustituido), C<sub>3-7</sub>cicloalquiltio (donde el grupo cicloalquilo está opcionalmente sustituido con C<sub>1-6</sub>alquilo o halógeno), tri(C<sub>1-4</sub>)alquilsilil(C<sub>1-6</sub>)alquiltio, ariltio (donde el grupo arilo está opcionalmente sustituido), C<sub>1-6</sub>alquilsulfonilo, C<sub>1-6</sub>haloalquilsulfonilo, C<sub>1-6</sub>alquilsulfonilo, C<sub>1-6</sub>haloalquilsulfonilo, arilsulfonilo (donde el grupo arilo puede estar opcionalmente sustituido), tri(C<sub>1-4</sub>)alquilsililo, arildi(C<sub>1-4</sub>)alquilsililo, (C<sub>1-4</sub>)alquildiarilsililo, triarilsililo, formilo, C<sub>1-10</sub>alquilcarbonilo, HO<sub>2</sub>C, C<sub>1-10</sub>alcoxicarbonilo, aminocarbonilo, C<sub>1-6</sub>alquilaminocarbonilo, di(C<sub>1-6</sub>alquil)aminocarbonilo, N-(C<sub>1-3</sub>alquil)-N-(C<sub>1-3</sub>alcoxi)aminocarbonilo, C<sub>1-6</sub>alquilcarboniloxi, arilcarboniloxi (donde el grupo arilo está opcionalmente sustituido), di(C<sub>1-6</sub>)alquilaminocarboniloxi, oximas y oxímetros como =NOalquilo, =NOhaloalquilo y =NOarilo (él mismo opcionalmente sustituido), arilo (él mismo opcionalmente sustituido), heteroarilo (él mismo opcionalmente sustituido), heterociclilo (él mismo opcionalmente sustituido con C<sub>1-6</sub>alquilo o halógeno), ariloxi (donde el grupo arilo está opcionalmente sustituido), heteroariloxi, (donde el grupo heteroarilo está opcionalmente sustituido), heterocicliлоxi (donde el grupo heterociclilo está opcionalmente sustituido con C<sub>1-6</sub>alquilo o halógeno), amino, C<sub>1-6</sub>alquilamino, di(C<sub>1-6</sub>)alquilamino, C<sub>1-6</sub>alquilcarbonilamino, N-(C<sub>1-6</sub>)alquilcarbonil-N-(C<sub>1-6</sub>)alquilamino, C<sub>2-6</sub>alqueniлоcarbonilo, C<sub>2-6</sub>alquiniлоcarbonilo, C<sub>3-6</sub>alqueniлоxicarbonilo, C<sub>3-6</sub>alquiniлоxicarbonilo, ariloxicarbonilo (donde el grupo arilo está opcionalmente sustituido) y arilcarbonilo (donde el grupo arilo está opcionalmente sustituido).

Los residuos alqueniло y alquiniло pueden estar en forma de cadenas lineales o ramificadas, y los residuos alqueniло, cuando corresponda, pueden tener la configuración (E)- o (Z)-. Los ejemplos son vinilo, alilo y propargilo. Los residuos alqueniло y alquiniло pueden contener uno o más enlaces dobles y/o triples en cualquier combinación. Se entiende, que aleniло y alquiniлоalqueniло están incluidos en estos términos.

65 Cuando están presentes, los sustituyentes opcionales en el alqueniло o alquiniло incluyen los sustituyentes opcionales indicados antes para un residuo alquilo.

En el contexto de esta especificación acilo es C<sub>1-6</sub>alquilcarbonilo opcionalmente sustituido (por ejemplo acetilo), C<sub>2-6</sub>alqueniлоcarbonilo opcionalmente sustituido, C<sub>3-6</sub>cicloalquilcarbonilo opcionalmente sustituido (por ejemplo ciclo-

## ES 2 353 159 T3

propilcarbonilo), C<sub>2-6</sub>alquiniarbonilo opcionalmente sustituido, arilcarbonilo opcionalmente sustituido (por ejemplo benzoilo) o heteroarilcarbonilo opcionalmente sustituido.

Halógeno es flúor, cloro, bromo o yodo.

5

Los grupos haloalquilo son grupos alquilo que están sustituidos con uno o más átomos de halógeno iguales o diferentes y son, por ejemplo, CF<sub>3</sub>, CF<sub>2</sub>Cl, CF<sub>2</sub>H, CCl<sub>2</sub>CH, FCH<sub>2</sub>, ClCH<sub>2</sub>, BrCH<sub>2</sub>, CH<sub>3</sub>CHF, CF<sub>3</sub>CH<sub>2</sub> o CHF<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>.

En el contexto de la presente especificación las expresiones “arilo”, “anillo aromático” y “sistema de anillo aromático” se refieren a sistemas de anillo que pueden ser mono, bi o tricíclicos. Los ejemplos de dichos anillos incluyen fenilo, naftalenilo, antraceno, indeno o fenantreno. Un grupo arilo preferido es fenilo. Además, las expresiones “heteroarilo”, “anillo heteroaromático” o “sistema de anillo heteroaromático” se refieren a un sistema de anillo aromático que contiene al menos un heteroátomo y que consiste en un único anillo o dos o más anillos fusionados. Preferentemente, los anillos únicos contendrán hasta tres y los sistemas bicíclicos hasta cuatro heteroátomos que se elegirán preferentemente entre nitrógeno, oxígeno y azufre. Los ejemplos de dichos grupos incluyen furilo, tienilo, pirrolilo, pirazolilo, imidazolilo, 1,2,3-triazolilo, 1,2,4-triazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, 1,2,3-oxadiazolilo, 1,2,4-oxadiazolilo, 1,3,4-oxadiazolilo, 1,2,5-oxadiazolilo, 1,2,3-tiadiazolilo, 1,2,4-tiadiazolilo, 1,3,4-tiadiazolilo, 1,2,5-tiadiazolilo, piridilo, pirimidilo, piridazino, pirazino, 1,2,3-triazinilo, 1,2,4-triazinilo, 1,3,5-triazinilo, benzofurilo, bencisofurilo, benzotienilo, bencisotienilo, indolilo, isoindolilo, indazolilo, benzotiazolilo, bencisotiazolilo, benzoxazolilo, bencisoxazolilo, bencimidazolilo, 2,1,3-benzoxadiazol, quinolinilo, isoquinolinilo, cinolinilo, ftalazino, quinazolinilo, quinoxalinilo, naftiridinilo, benzotriazinilo, purinilo, pteridinilo e indolizino. Los ejemplos preferidos de radicales heteroaromáticos incluyen piridilo, pirimidilo, triazinilo, tienilo, furilo, oxazolilo, isoxazolilo, 2,1,3-benzoxadiazol y tiazolilo.

Los términos heterociclo y heterociclilo se refieren a sistemas de anillos no aromáticos, monocíclicos o bicíclicos, que contienen hasta 10 átomos incluidos uno o más (preferentemente uno o dos) heteroátomos seleccionados entre O, S y N. Los ejemplos de dichos anillos abarcan 1,3-dioxolano, oxetano, tetrahidrofurano, morfolina, tiomorfolina y piperazina.

Cuando están presentes, los sustituyentes opcionales en el heterociclilo incluyen C<sub>1-6</sub>alquilo y C<sub>1-6</sub>haloalquilo así como los sustituyentes opcionales indicados antes para un residuo alquilo.

Cicloalquilo incluye ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo y ciclohexilo.

Cicloalqueno incluye ciclopentenilo y ciclohexenilo.

Cuando están presentes, los sustituyentes opcionales en el cicloalquilo o cicloalqueno incluyen C<sub>1-3</sub>alquilo así como los sustituyentes opcionales indicados antes para un residuo alquilo.

Los anillos carbocíclicos incluyen grupos arilo, cicloalquilo y cicloalqueno.

Cuando están presentes, los sustituyentes opcionales en arilo o heteroarilo se seleccionan independientemente entre, halógeno, nitro, ciano, rodano, isotiocianato, C<sub>1-6</sub>alquilo, C<sub>1-6</sub>haloalquilo, C<sub>1-6</sub>alcoxi-(C<sub>1-6</sub>)alquilo, C<sub>2-6</sub>alqueno, C<sub>2-6</sub>haloalqueno, C<sub>2-6</sub>alquino, C<sub>3-7</sub>cicloalquilo (él mismo opcionalmente sustituido con C<sub>1-6</sub>alquilo o halógeno), C<sub>5-7</sub>cicloalqueno (él mismo opcionalmente sustituido con C<sub>1-6</sub>alquilo o halógeno), hidroxilo, C<sub>1-10</sub>alcoxi, C<sub>1-10</sub>alcoxi(C<sub>1-10</sub>)alcoxi, tri(C<sub>1-4</sub>)alquil-silil(C<sub>1-6</sub>)alcoxi, C<sub>1-6</sub>alcoxicarbonil(C<sub>1-10</sub>)alcoxi, C<sub>1-10</sub>haloalcoxi, aril(C<sub>1-4</sub>)alcoxi (donde el grupo arilo está opcionalmente sustituido con halógeno o C<sub>1-6</sub>alquilo), C<sub>3-7</sub>cicloalquiloxilo (donde el grupo cicloalquilo está opcionalmente sustituido con C<sub>1-6</sub>alquilo o halógeno), C<sub>2-10</sub>alquenoiloxi, C<sub>2-10</sub>alquinoiloxi, SH, C<sub>1-10</sub>alquiltio, C<sub>1-10</sub>haloalquiltio, aril(C<sub>1-4</sub>)alquiltio, C<sub>3-7</sub>cicloalquiltio (donde el grupo cicloalquilo está opcionalmente sustituido con C<sub>1-6</sub>alquilo o halógeno), tri(C<sub>1-4</sub>)alquilsilil(C<sub>1-6</sub>)alquiltio, ariltio, C<sub>1-6</sub>alquilsulfonilo, C<sub>1-6</sub>haloalquilsulfonilo, C<sub>1-6</sub>alquilsulfino, C<sub>1-6</sub>haloalquilsulfino, arilsulfonilo, tri(C<sub>1-4</sub>)alquilsililo, arildi(C<sub>1-4</sub>)alquilsililo, C<sub>1-4</sub>alquildiarilsililo, triarilsililo, C<sub>1-10</sub>alquilcarbonilo, HO<sub>2</sub>C, C<sub>1-10</sub>alcoxicarbonilo, aminocarbonilo, C<sub>1-6</sub>alquilaminocarbonilo, di(C<sub>1-6</sub>alquil)-aminocarbonilo, N-(C<sub>1-3</sub>alquil)-N-(C<sub>1-3</sub>alcoxi)aminocarbonilo, C<sub>1-6</sub>alquilcarboniloxi, arilcarboniloxi, di(C<sub>1-6</sub>)alquilamino-carboniloxi, arilo (él mismo opcionalmente sustituido con C<sub>1-6</sub>alquilo o halógeno), heteroarilo (él mismo opcionalmente sustituido con C<sub>1-6</sub>alquilo o halógeno), heterociclilo (él mismo opcionalmente sustituido con C<sub>1-6</sub>alquilo o halógeno), ariloxi (donde el grupo arilo está opcionalmente sustituido con C<sub>1-6</sub>alquilo o halógeno), heteroariloxi (donde el grupo heteroarilo está opcionalmente sustituido con C<sub>1-6</sub>alquilo o halógeno), heterocicliloxi (donde el grupo heterociclilo está opcionalmente sustituido con C<sub>1-6</sub>alquilo o halógeno), amino, C<sub>1-6</sub>alquilamino, di(C<sub>1-6</sub>)alquilamino, C<sub>1-6</sub>alquilcarbonilamino, N-(C<sub>1-6</sub>)alquilcarbonilo-N-(C<sub>1-6</sub>)alquilamino, arilcarbonilo, (donde el grupo arilo está el mismo opcionalmente sustituido con halógeno o C<sub>1-6</sub>alquilo) o dos posiciones adyacentes en un sistema arilo o heteroarilo se pueden ciclar para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de 5, 6 o 7 miembros, él mismo opcionalmente sustituido con halógeno o C<sub>1-6</sub>alquilo. Otros sustituyentes para arilo o heteroarilo incluyen arilcarbonilamino (donde el grupo arilo está sustituido con C<sub>1-6</sub>alquilo o halógeno), (C<sub>1-6</sub>)alquiloxicarbonilamino(C<sub>1-6</sub>)alquilocarbonil-N-(C<sub>1-6</sub>)alquilamino, ariloxicarbonilamino (donde el grupo arilo está sustituido con C<sub>1-6</sub>alquilo o halógeno), ariloxicarbonil-N-(C<sub>1-6</sub>)alquilamino, (donde el grupo arilo está sustituido con C<sub>1-6</sub>alquilo o halógeno), arilsulfonilamino (donde el grupo arilo está sustituido con C<sub>1-6</sub>alquilo o halógeno), arilsulfonil-N-(C<sub>1-6</sub>)alquilamino (donde el grupo arilo está sustituido con C<sub>1-6</sub>alquilo o halógeno), aril-N-(C<sub>1-6</sub>)alquilamino (donde el grupo arilo está sustituido con C<sub>1-6</sub>alquilo o halógeno), arilamino (donde el grupo arilo está sustituido

## ES 2 353 159 T3

con C<sub>1-6</sub>alquilo o halógeno), heteroarilamino (donde el grupo heteroarilo está sustituido con C<sub>1-6</sub>alquilo o halógeno), heterocicilamino (donde el grupo heterocicilo está sustituido con C<sub>1-6</sub>alquilo o halógeno), aminocarbonilamino, C<sub>1-6</sub>alquilaminocarbonilamino, di(C<sub>1-6</sub>)alquilaminocarbonilamino, arilaminocarbonilamino donde el grupo arilo está sustituido con C<sub>1-6</sub>alquilo o halógeno), aril-N-(C<sub>1-6</sub>)alquilaminocarbonilamino donde el grupo arilo está sustituido con C<sub>1-6</sub>alquilo o halógeno), C<sub>1-6</sub>alquilaminocarbonil-N-(C<sub>1-6</sub>)alquilamino, di(C<sub>1-6</sub>)alquilaminocarbonil-N-(C<sub>1-6</sub>)alquilamino, arilaminocarbonil-N-(C<sub>1-6</sub>)alquilamino donde el grupo arilo está sustituido con C<sub>1-6</sub>alquilo o halógeno) y aril-N-(C<sub>1-6</sub>)alquilaminocarbonil-N-(C<sub>1-6</sub>)alquilamino donde el grupo arilo está sustituido con C<sub>1-6</sub>alquilo o halógeno).

Para residuos fenilo, grupos heterocicilo y heteroarilo sustituidos se prefiere que uno o más de los sustituyentes se seleccione independientemente entre halógeno, C<sub>1-6</sub>alquilo, C<sub>1-6</sub>haloalquilo, C<sub>1-6</sub>alcoxi(C<sub>1-6</sub>)alquilo, C<sub>1-6</sub>alcoxi, C<sub>1-6</sub>haloalcoxi, C<sub>1-6</sub>alquiltio, C<sub>1-6</sub>haloalquiltio, C<sub>1-6</sub>alquilsulfinilo, C<sub>1-6</sub>haloalquilsulfinilo, C<sub>1-6</sub>alquilsulfonilo, C<sub>1-6</sub>haloalquilsulfonilo, C<sub>2-6</sub>alquenilo, C<sub>2-6</sub>haloalquenilo, C<sub>2-6</sub>alquinilo, C<sub>3-7</sub>cicloalquilo, nitro, ciano, CO<sub>2</sub>H, C<sub>1-6</sub>alquilcarbonilo, C<sub>1-6</sub>alcoxycarbonilo, arilo, heteroarilo, R<sup>50</sup>R<sup>51</sup>N o R<sup>52</sup>R<sup>53</sup>NC(O); donde R<sup>50</sup>, R<sup>51</sup>, R<sup>52</sup> y R<sup>53</sup> son, independientemente, hidrógeno o C<sub>1-6</sub>alquilo.

Los grupos haloalquenilo son grupos alquenilo que están sustituidos con uno o más átomos de halógeno iguales o diferentes.

Se debe comprender que los sustituyentes dialquilamino incluyen aquellos en los que los grupos dialquilo junto con el átomo de N al cual están unidos forman un anillo heterocíclico de cinco, seis o siete miembros que puede contener uno o dos heteroátomos más seleccionados entre O, N o S y que puede estar opcionalmente sustituido con uno o dos grupos (C<sub>1-6</sub>)alquilo seleccionados independientemente. Cuando se forman anillos heterocíclicos uniendo dos grupos unidos a un átomo de N, los anillos resultantes son adecuadamente pirrolidina, piperidina, tiomorfolina y morfolina cada una de las cuales puede estar sustituida con uno o dos grupos (C<sub>1-6</sub>)alquilo seleccionados independientemente.

Preferentemente los sustituyentes opcionales en un residuo alquilo incluyen uno o más de: halógeno, nitro, ciano, HO<sub>2</sub>C, C<sub>1-10</sub>alcoxi (él mismo opcionalmente sustituido con C<sub>1-10</sub>alcoxi), aril(C<sub>1-4</sub>)alcoxi, C<sub>1-10</sub>alquiltio, C<sub>1-10</sub>alquilcarbonilo, C<sub>3-5</sub>cicloalquilcarbonilo, C<sub>1-10</sub>alcoxycarbonilo, C<sub>1-6</sub>alquilaminocarbonilo, di(C<sub>1-6</sub>)alquilaminocarbonilo, (C<sub>1-6</sub>)alquilcarbonilo, fenilo opcionalmente sustituido, heteroarilo, ariloxi, arilcarboniloxi, heteroariloxi, heterocicilo, heterociciloxi, C<sub>3-7</sub>cicloalquilo (él mismo opcionalmente sustituido con (C<sub>1-6</sub>)alquilo o halógeno), C<sub>3-7</sub>cicloalquilo, C<sub>5-7</sub>cicloalquenilo, C<sub>1-6</sub>alquilsulfinilo, C<sub>1-6</sub>alquilsulfonilo, tri(C<sub>1-4</sub>)alquilsililo, tri(C<sub>1-4</sub>)alquilsilil(C<sub>1-6</sub>)alcoxi, arildi(C<sub>1-4</sub>)alquildiarilsililo y triarilsililo.

Preferentemente los sustituyentes opcionales en alquenilo o alquinilo incluyen uno o más de: halógeno, arilo y C<sub>3-7</sub>cicloalquilo.

Un sustituyente opcional preferido para heterocicilo es C<sub>1-3</sub>alquilo.

Preferentemente los sustituyentes opcionales para cicloalquilo incluyen halógeno, ciano y C<sub>1-6</sub>alquilo.

Los sustituyentes opcionales para cicloalquenilo incluyen preferentemente C<sub>1-3</sub>alquilo, halógeno y ciano.

Los grupos preferidos para T, Y, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>9</sup> y R<sup>10</sup> en cualquiera de sus combinaciones se establecen a continuación.

Y es preferentemente O, S, S(O), SO<sub>2</sub>, NR<sup>3</sup> o CR<sup>5</sup>R<sup>6</sup> donde R<sup>3</sup>, R<sup>5</sup> y R<sup>6</sup> son los definidos antes. R<sup>3</sup> es especialmente hidrógeno, formilo, C<sub>1-6</sub>alquilcarbonilo, ciclopropilcarbonilo, C<sub>1-6</sub>alcoxycarbonilo, C<sub>1-6</sub>alquilsulfinilo, C<sub>1-6</sub>alquilo, C<sub>1-6</sub>haloalquilo, C<sub>3-4</sub>alquenilo, C<sub>3-4</sub>haloalquenilo, C<sub>3-4</sub>alquinilo o bencilo, o fenilo (donde los grupos que contienen fenilo están opcionalmente sustituidos con halógeno, C<sub>1-4</sub>alquilo, C<sub>1-4</sub>alcoxi, C<sub>1-4</sub>haloalquilo, C<sub>1-4</sub>haloalcoxi, CN o NO<sub>2</sub>). Especialmente R<sup>5</sup> y R<sup>6</sup> son independientemente hidrógeno, hidroxilo, halógeno, ciano, C<sub>1-6</sub>alquilo, C<sub>1-6</sub>haloalquilo, C<sub>1-6</sub>alcoxi(C<sub>1-6</sub>)alquilo, fenil(C<sub>1-3</sub>)alquilo (donde el grupo fenilo puede estar opcionalmente sustituido con halógeno, C<sub>1-4</sub>alquilo, C<sub>1-4</sub>alcoxi, C<sub>1-4</sub>haloalquilo, C<sub>1-4</sub>haloalcoxi, CN, NO<sub>2</sub>, arilo, heteroarilo, amino, dialquilamino, C<sub>1-6</sub>alquilsulfonilo, C<sub>1-6</sub>alcoxycarbonilo, o dos posiciones adyacentes en el anillo fenilo se pueden ciclar para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de 5, 6 o 7 miembros, (él mismo opcionalmente sustituido con halógeno), C<sub>3-5</sub>cicloalquilo, 1,3-dioxolan-2-ilo, fenilo (que puede estar opcionalmente sustituido con halógeno, C<sub>1-4</sub>alquilo, C<sub>1-4</sub>alcoxi, C<sub>1-4</sub>haloalquilo, C<sub>1-4</sub>haloalcoxi, CN, NO<sub>2</sub>, arilo, heteroarilo, amino, dialquilamino, C<sub>1-6</sub>alquilsulfonilo, C<sub>1-6</sub>alcoxycarbonilo, o dos posiciones adyacentes en el anillo fenilo se pueden ciclar para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de 5, 6 o 7 miembros, (él mismo opcionalmente sustituido con halógeno), C<sub>1-6</sub>alcoxi, C<sub>1-6</sub>haloalcoxi, C<sub>1-6</sub>alqueniloxi, C<sub>1-6</sub>alquiniloxi, C<sub>1-3</sub>alcoxi(C<sub>1-3</sub>)alcoxi, benciloxi (donde el fenilo está opcionalmente sustituido con halógeno, C<sub>1-4</sub>alquilo, C<sub>1-4</sub>alcoxi, C<sub>1-4</sub>haloalquilo, C<sub>1-4</sub>haloalcoxi, CN, NO<sub>2</sub>), C<sub>1-6</sub>alquiltio, C<sub>1-6</sub>haloalquiltio, NR<sup>54</sup>R<sup>55</sup> (donde R<sup>54</sup> y R<sup>55</sup> son independientemente hidrógeno, C<sub>1-6</sub>alquilo o C<sub>1-6</sub>haloalquilo, C<sub>1-4</sub>alcoxi(C<sub>1-4</sub>)alquilo, formilo, C<sub>2-6</sub>alquilcarbonilo, fenil carbonilo (donde el fenilo está opcionalmente sustituido con halógeno, C<sub>1-4</sub>alquilo, C<sub>1-4</sub>alcoxi, C<sub>1-4</sub>haloalquilo, C<sub>1-4</sub>haloalcoxi, CN, NO<sub>2</sub>)), o R<sup>5</sup> y R<sup>6</sup> junto con el átomo de carbono al cual están unidos forman un anillo de tres a seis miembros, que puede contener opcionalmente uno o dos átomos de azufre o uno o dos átomos de oxígeno no adyacentes o un grupo NR<sup>56</sup> (donde R<sup>56</sup> es hidrógeno, C<sub>1-6</sub>alquilo, C<sub>1-6</sub>haloalquilo, C<sub>1-4</sub>alcoxi(C<sub>1-4</sub>)alquilo, formilo, C<sub>2-6</sub>alquilcarbonilo), o cuando R<sup>5</sup> junto con R<sup>1</sup> forman un enlace, o R<sup>5</sup> o R<sup>6</sup> junto con R<sup>1</sup> o R<sup>2</sup> y el átomo de carbono al cual están unidos forman un anillo de tres a seis miembros, que puede contener opcionalmente uno o dos átomos de oxígeno no adyacentes, o cuando R<sup>5</sup> y R<sup>6</sup> forman juntos =O, =S, =NR<sup>57</sup> o =CR<sup>58</sup>R<sup>59</sup>, donde R<sup>57</sup>

## ES 2 353 159 T3

es OH, opcionalmente sustituido con C<sub>1-6</sub>alcoxi o C<sub>1-4</sub>alquilcarbonilamino, y R<sup>58</sup> y R<sup>59</sup> son independientemente H o C<sub>1-6</sub>alquilo.

Más preferentemente Y es O o CR<sup>5</sup>R<sup>6</sup> donde R<sup>5</sup> y R<sup>6</sup> son hidrógeno, hidroxilo, fluoro, cloro, C<sub>1-6</sub>alquilo, C<sub>1-6</sub>haloalquilo, C<sub>1-6</sub>alcoxi, C<sub>1-6</sub>haloalcoxi, C<sub>1-6</sub>alquenoiloxi, C<sub>1-6</sub>alquinoiloxi, C<sub>1-3</sub>alcoxi(C<sub>1-3</sub>)alcoxi o benciloxi, o R<sup>5</sup> y R<sup>6</sup> junto con el átomo de carbono al cual están unidos forman un anillo carbocíclico de tres a seis miembros, o R<sup>5</sup> y R<sup>1</sup> forman juntos un enlace, o R<sup>5</sup> junto con R<sup>1</sup> y los átomos de carbono a los cuales están unidos forman un anillo carbocíclico de tres a seis miembros.

Muy preferentemente Y es CR<sup>5</sup>R<sup>6</sup> donde R<sup>5</sup> y R<sup>6</sup> son independientemente hidrógeno o metilo, especialmente hidrógeno.

Preferentemente cada grupo R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> es independientemente hidrógeno, hidroxilo, halógeno, ciano, C<sub>1-6</sub>alquilo, C<sub>1-6</sub>haloalquilo, C<sub>1-6</sub>alcoxi(C<sub>1-6</sub>)alquilo, fenil(C<sub>1-3</sub>)alquilo (donde el grupo fenilo puede estar opcionalmente sustituido con halógeno, C<sub>1-4</sub>alquilo, C<sub>1-4</sub>alcoxi, C<sub>1-4</sub>haloalquilo, C<sub>1-4</sub>haloalcoxi, CN, NO<sub>2</sub>, arilo, heteroarilo, amino, dialquilamino, C<sub>1-6</sub>alquilsulfonilo, C<sub>1-6</sub>alcoxycarbonilo), C<sub>3-5</sub>cicloalquilo, 1,3-dioxolan-2-ilo, fenilo (que puede estar opcionalmente sustituido con halógeno, C<sub>1-4</sub>alquilo, C<sub>1-4</sub>alcoxi, C<sub>1-4</sub>haloalquilo, C<sub>1-4</sub>haloalcoxi, CN, NO<sub>2</sub>, arilo, heteroarilo, amino, dialquilamino, C<sub>1-6</sub>alquilsulfonilo, C<sub>1-6</sub>alcoxycarbonilo), C<sub>1-6</sub>alcoxi, C<sub>1-6</sub>haloalcoxi, C<sub>2-6</sub>alquenoiloxi, C<sub>2-6</sub>alquinoiloxi, C<sub>1-3</sub>alcoxi(C<sub>1-3</sub>)alcoxi, benciloxi (donde el grupo fenilo está opcionalmente sustituido con halógeno, C<sub>1-4</sub>alquilo, C<sub>1-4</sub>alcoxi, C<sub>1-4</sub>haloalquilo, C<sub>1-4</sub>haloalcoxi, CN, NO<sub>2</sub>), C<sub>1-6</sub>alquiltio, C<sub>1-6</sub>haloalquiltio, formilo, C<sub>2-6</sub>alquilcarbonilo, fenilcarbonilo (donde el fenilo está opcionalmente sustituido con halógeno, C<sub>1-4</sub>alquilo, C<sub>1-4</sub>alcoxi, C<sub>1-4</sub>haloalquilo, C<sub>1-4</sub>haloalcoxi, CN, NO<sub>2</sub>), o R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> juntos son =O, =S, =NR<sup>60</sup> o =CR<sup>61</sup>R<sup>62</sup>, donde R<sup>60</sup> es OH, C<sub>1-6</sub>alcoxi o C<sub>1-6</sub>alquilcarbonilamino, y R<sup>61</sup> y R<sup>62</sup> son independientemente H, C<sub>1-6</sub>alquilo, o C<sub>1-6</sub>haloalquilo; o R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> junto con el átomo de carbono al cual están unidos forman un anillo de tres a seis miembros, que puede contener opcionalmente uno o dos átomos de oxígeno no adyacentes; o R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> forman juntos un anillo de tres a seis miembros, que puede contener opcionalmente uno o dos átomos de oxígeno no adyacentes.

Más preferentemente cada grupo R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> es independientemente hidrógeno, hidroxilo, halógeno, C<sub>1-6</sub>alquilo, C<sub>1-6</sub>haloalquilo, C<sub>1-6</sub>alcoxi, C<sub>1-6</sub>haloalcoxi, C<sub>1-6</sub>alquenoiloxi, C<sub>1-6</sub>alquinoiloxi, C<sub>1-3</sub>alcoxi(C<sub>1-3</sub>)alcoxi o benciloxi.

Muy preferentemente cada grupo R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> es independientemente hidrógeno o metilo.

R<sup>9</sup> es preferentemente hidrógeno, C<sub>1-6</sub>alquilo, C<sub>1-6</sub>cianoalquilo, C<sub>1-6</sub>haloalquilo, C<sub>3-7</sub>cicloalquil(C<sub>1-4</sub>)alquilo, C<sub>1-6</sub>alcoxi(C<sub>1-6</sub>)alquilo, aril(C<sub>1-6</sub>)alquilo (donde el grupo arilo puede estar opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, C<sub>1-6</sub>alquilo, C<sub>1-6</sub>haloalquilo, C<sub>1-6</sub>alcoxi, C<sub>1-6</sub>haloalcoxi, C<sub>1-6</sub>alquilsulfonilo, C<sub>1-6</sub>alquilsulfonilo, C<sub>1-6</sub>alquiltio, C<sub>1-6</sub>alcoxycarbonilo, C<sub>1-6</sub>alquilcarbonilamino o arilcarbonilo), C<sub>2-6</sub>alquilcarbonilo, fenilcarbonilo (donde el grupo fenilo está opcionalmente sustituido con halógeno, C<sub>1-4</sub>alquilo, C<sub>1-4</sub>alcoxi, C<sub>1-4</sub>haloalquilo, C<sub>1-4</sub>haloalcoxi, CN, NO<sub>2</sub>, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino), C<sub>1-6</sub>alcoxycarbonilo, C(O)NR<sup>63</sup>R<sup>64</sup> (donde R<sup>63</sup> y R<sup>64</sup> son independientemente hidrógeno, C<sub>1-6</sub>alquilo o C<sub>1-6</sub>haloalquilo o C<sub>1-6</sub>alcoxi(C<sub>1-6</sub>)alquilo o R<sup>63</sup> y R<sup>64</sup> junto con el átomo de N al cual están unidos forman un anillo de cinco, seis o siete miembros que contiene un átomo de O o S), o R<sup>9</sup> y R<sup>1</sup> junto con los átomos de carbono a los cuales están unidos forman un anillo de tres a seis miembros.

Más preferentemente R<sup>9</sup> es independientemente hidrógeno, C<sub>1-6</sub>alquilo, C<sub>1-6</sub>haloalquilo, C<sub>3-7</sub>cicloalquil(C<sub>1-4</sub>)alquilo, C<sub>1-6</sub>alcoxi(C<sub>1-6</sub>)alquilo, aril(C<sub>1-6</sub>)alquilo (donde el grupo arilo puede estar opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, C<sub>1-6</sub>alquilo, C<sub>1-6</sub>haloalquilo, C<sub>1-6</sub>alcoxi), C<sub>2-6</sub>alquilcarbonilo, fenilcarbonilo (donde el grupo fenilo está opcionalmente sustituido con halógeno, C<sub>1-4</sub>alquilo, C<sub>1-4</sub>alcoxi, C<sub>1-4</sub>haloalquilo), C<sub>1-6</sub>alcoxycarbonilo, o R<sup>9</sup> y R<sup>1</sup> junto con los átomos de carbono a los cuales están unidos forman un anillo de tres a seis miembros.

Muy preferentemente R<sub>9</sub> es independientemente hidrógeno o metilo.

Preferentemente cada R<sup>4</sup> es independientemente halógeno, ciano, C<sub>1-8</sub>alquilo, C<sub>1-8</sub>haloalquilo, ciano(C<sub>1-6</sub>)alquilo, C<sub>1-3</sub>alcoxi(C<sub>1-3</sub>)alquilo, C<sub>2-6</sub>alquinoiloxi, C<sub>3-6</sub>cicloalquilo, C<sub>1-3</sub>alquil(C<sub>3-6</sub>)cicloalquilo, fenilo (opcionalmente sustituido con halógeno, C<sub>1-4</sub>alquilo, C<sub>1-4</sub>alcoxi, C<sub>1-4</sub>haloalquilo, C<sub>1-4</sub>haloalcoxi, CN, NO<sub>2</sub>, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino), heterocíclico (opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, C<sub>1-6</sub>alquilo, C<sub>1-6</sub>haloalquilo, C<sub>1-6</sub>alcoxi o C<sub>1-6</sub>haloalcoxi), formilo, C<sub>1-6</sub>alquilcarbonilo, C<sub>1-6</sub>alcoxycarbonilo, C<sub>1-6</sub>alquiltiocarbonilo, C<sub>1-6</sub>alcoxitiocarbonilo, carbamoilo, C<sub>1-6</sub>alquilaminocarbonilo, di-C<sub>1-6</sub>alquilaminocarbonilo, tiocarbamoilo, C<sub>1-6</sub>alquilaminotiocarbonilo, di-C<sub>1-6</sub>alquilaminotiocarbonilo, C<sub>1-8</sub>alcoxi, C<sub>1-6</sub>haloalcoxi, fenoxi (opcionalmente sustituido con halógeno, C<sub>1-4</sub>alquilo, C<sub>1-4</sub>alcoxi, C<sub>1-4</sub>haloalquilo, C<sub>1-4</sub>haloalcoxi, CN, NO<sub>2</sub> o fenilo), heteroariloxi, (opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, C<sub>1-3</sub>alquilo, C<sub>1-3</sub>haloalquilo, C<sub>1-3</sub>alcoxi o C<sub>1-3</sub>haloalcoxi), C<sub>1-6</sub>alquilcarboniloxi, C<sub>1-6</sub>alcoxycarboniloxi, C<sub>1-6</sub>alquilaminocarboniloxi, di-C<sub>1-6</sub>alquilaminocarboniloxi, C<sub>1-6</sub>alquilaminotiocarboniloxi, di-C<sub>1-6</sub>alquilaminotiocarboniloxi, C<sub>1-8</sub>alquiltio, C<sub>1-6</sub>haloalquiltio, ariltio o heteroariltio (donde el arilo está opcionalmente sustituido con halógeno, C<sub>1-4</sub>alquilo, C<sub>1-4</sub>alcoxi, C<sub>1-4</sub>haloalquilo, C<sub>1-4</sub>haloalcoxi, CN, NO<sub>2</sub> o fenilo), C<sub>1-6</sub>alquilcarboniltio, C<sub>1-6</sub>alquilaminocarboniltio, di-C<sub>1-6</sub>alquilaminocarboniltio, di(C<sub>1-8</sub>)alquilamino, C<sub>1-6</sub>alquilcarbonilamino, C<sub>1-6</sub>alcoxycarbonilamino, C<sub>1-6</sub>alquilaminocarbonilamino, di-C<sub>1-6</sub>alquilaminocarbonilamino, aminotiocarbonilamino, C<sub>1-6</sub>alquilaminotiocarbonilamino, di-C<sub>1-6</sub>alquilaminotiocarbonilamino, o 2 grupos R<sup>4</sup> adyacentes junto con los átomos de carbono a los cuales están unidos forman un anillo carbocíclico o heterocíclico de 4, 5, 6 o 7 miembros que puede estar opcionalmente sustituido con halógeno; n es 0, 1, 2 o 3.

## ES 2 353 159 T3

Más preferentemente cada  $R^4$  es independientemente halógeno, ciano,  $C_{1-8}$ alquilo,  $C_{1-8}$ haloalquilo, ciano( $C_{1-6}$ )alquilo,  $C_{1-6}$ alcoxi( $C_{1-6}$ )alquilo,  $C_{2-6}$ alquinilo, heterociclilo (opcionalmente sustituido con  $C_{1-6}$ alquilo),  $C_{1-8}$ alcoxi,  $C_{1-6}$ haloalcoxi, fenoxi (opcionalmente sustituido con halo, ciano,  $C_{1-3}$ alquilo o  $C_{1-3}$ haloalquilo), heteroariloxi (opcionalmente sustituido con halo, ciano,  $C_{1-3}$ alquilo o  $C_{1-3}$ haloalquilo),  $C_{1-3}$ alcoxi,  $C_{1-3}$ haloalcoxi,  $C_{1-3}$ alquiltio,  $C_{1-3}$ haloalquiltio,  $C_{1-3}$ alquilsulfonilo, di( $C_{1-8}$ )alquilamino, o 2 grupos  $R^4$  adyacentes junto con los átomos de carbono a los cuales están unidos forman un anillo carbocíclico o heterocíclico de 4, 5, 6 o 7 miembros que puede estar opcionalmente sustituido con halógeno; n es 0, 1, 2 o 3.

Muy preferentemente cada  $R^4$  es independientemente fluoro, cloro, bromo,  $C_{1-4}$ alquilo o  $C_{1-4}$ haloalquilo; n es 1, 2 o 3, preferentemente 1 o 2.

Preferentemente al menos un grupo  $R^4$  está posicionado adyacente al grupo Y.

$R^{10}$  es preferentemente hidrógeno, hidroxilo, ciano,  $C_{1-6}$ alquilo,  $C_{1-6}$ haloalquilo,  $C_{1-6}$ alcoxi( $C_{1-6}$ )alquilo, fenilo( $C_{1-3}$ )alquilo (donde el grupo fenilo puede estar opcionalmente sustituido con halógeno,  $C_{1-4}$ alquilo,  $C_{1-4}$ alcoxi,  $C_{1-4}$ haloalquilo,  $C_{1-4}$ haloalcoxi, CN,  $NO_2$ , arilo, heteroarilo, amino, dialquilamino,  $C_{1-6}$ alquilsulfonilo,  $C_{1-6}$ alcoxycarbonilo),  $C_{1-6}$ alcoxi,  $C_{1-6}$ haloalcoxi,  $C_{2-6}$ alquinoxilo,  $C_{2-6}$ alquinoxilo,  $C_{1-3}$ alcoxi( $C_{1-3}$ )alcoxi, benciloxi (donde el grupo fenilo está opcionalmente sustituido con halógeno,  $C_{1-4}$ alquilo,  $C_{1-4}$ alcoxi,  $C_{1-4}$ haloalquilo,  $C_{1-4}$ haloalcoxi, CN,  $NO_2$ ),  $C_{1-6}$ alquiltio,  $C_{1-6}$ haloalquiltio, feniltio (donde el grupo fenilo está opcionalmente sustituido con halógeno,  $C_{1-4}$ alquilo,  $C_{1-4}$ alcoxi,  $C_{1-4}$ haloalquilo,  $C_{1-4}$ haloalcoxi, CN,  $NO_2$ ),  $NR^{65}R^{66}$  (donde  $R^{65}$  y  $R^{66}$  son independientemente hidrógeno,  $C_{1-6}$ alquilo o  $C_{1-6}$ haloalquilo,  $C_{1-6}$ alcoxi ( $C_{1-6}$ )alquilo,  $C_{1-6}$ alquilcarbonilo o  $R^{65}$  y  $R^{66}$  junto con el átomo de N al cual están unidos forman un anillo de cinco, seis o siete miembros que contiene un átomo de O o S),  $R^{65}R^{66}NS$ ,  $R^{65}R^{66}NC(O)$ ,  $R^{65}R^{66}NC(S)$ ,  $R^{67}N=C(R^{68})$ -, donde  $R^{67}$  es  $C_{1-6}$ alquilo o fenilo (opcionalmente sustituido con halógeno,  $C_{1-4}$ alquilo,  $C_{1-4}$ alcoxi,  $C_{1-4}$ haloalquilo,  $C_{1-4}$ haloalcoxi, CN,  $NO_2$ ), y  $R^{68}$  es H,  $C_{1-6}$ alquilo o  $C_{1-6}$ alquiltio.

Más preferentemente  $R^{10}$  es hidrógeno, hidroxilo, ciano,  $C_{1-6}$ alquilo,  $C_{1-6}$ alcoxi( $C_{1-6}$ )alquilo,  $C_{1-6}$ alcoxi,  $C_{1-6}$ alquiltio,  $C_{1-6}$ haloalquiltio, formilo,  $C_{2-6}$ alquilcarbonilo,  $C_{1-6}$ alcoxycarbonilo,  $NR^{65}R^{66}$  (donde  $R^{65}$  y  $R^{66}$  son independientemente hidrógeno,  $C_{1-6}$ alquilo o  $C_{1-6}$ haloalquilo,  $C_{1-6}$ alcoxi( $C_{1-6}$ )alquilo,  $C_{1-6}$ alquilcarbonilo o  $R^{65}$  y  $R^{66}$  junto con el átomo de N al cual están unidos forman un anillo de cinco, seis o siete miembros que contiene un átomo de O o S).

Muy preferentemente  $R^{10}$  hidrógeno, ciano o formilo, especialmente hidrógeno.

Se prefiere que el anillo



sea un anillo aromático de 6 miembros o un anillo heteroaromático de 5 ó 6 miembros donde los miembros del anillo sean cada uno independientemente CH, S, N,  $NR^4$ , O o  $CR^4$  siempre que no haya más de un átomo de O o S presentes en el anillo.

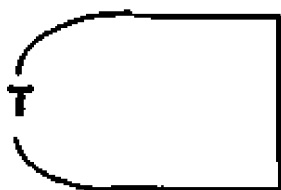
Más preferentemente el anillo



es benceno, tiofeno, furano, piridina, pirimidina, pirazina, piridazina, triazina, pirrol, imidazol, pirazol, oxazol, tiazol, isoxazol, isotiazol, [1,2,3]triazol, [1,2,3]oxadiazol o [1,2,3]tiadiazol.

Muy preferentemente el anillo

5



10

15

es un anillo benceno, piridina o tiofeno, especialmente un anillo benceno.

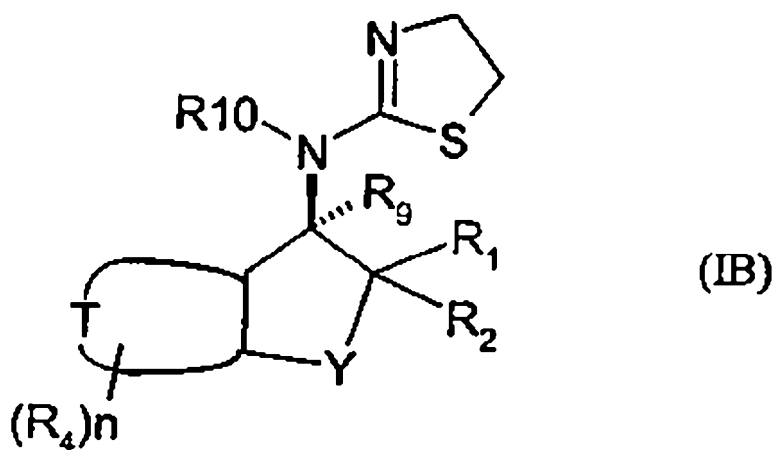
Otros grupos especialmente preferidos de compuestos son los compuestos de fórmula (IB)

20

25

30

35



40

donde la quiralidad en el átomo de carbono que tiene a  $R^9$  como sustituyente es la que se muestra en la estructura anterior y  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^4$ ,  $R^9$ ,  $R^{10}$ ,  $Y$  y  $n$  son los definidos antes en relación con la fórmula (I).

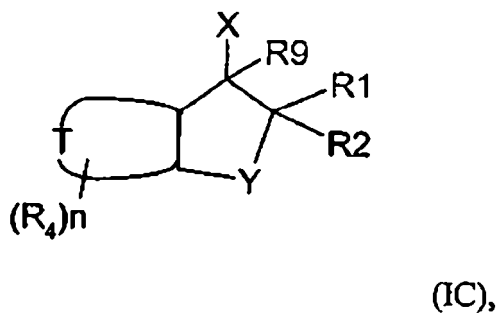
45

Algunos compuestos de fórmula (I) son nuevos y como tales forman otro aspecto de la invención. Un grupo de compuestos nuevos son los compuestos de fórmula IC

50

55

60



65

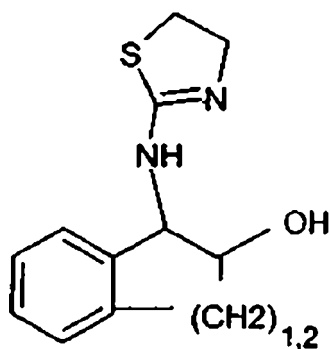
ES 2 353 159 T3

donde R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>9</sup>, T, X, Y y n son los definidos en la reivindicación 1 o sus sales o N-óxidos, con la condición de que los compuestos siguientes (IC1) a (IC3) estén excluidos:

5

10

15



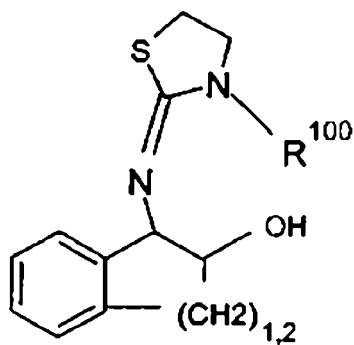
(IC1),

20

25

30

35



(IC2),

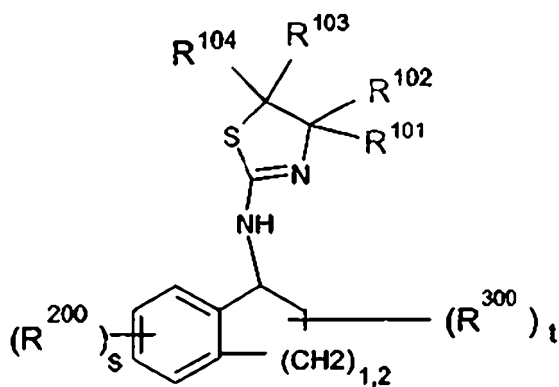
40

donde R<sup>100</sup> es hidrógeno o acetilo, y

45

50

55



(IC3),

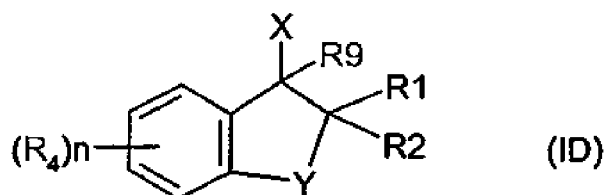
60

donde R<sup>101</sup>, R<sup>102</sup>, R<sup>103</sup> y R<sup>104</sup> son hidrógeno, R<sup>200</sup> y R<sup>300</sup> son independientemente uno de otro halógeno, C<sub>1-4</sub>alquilo, C<sub>1-4</sub>alcoxi, C<sub>1-4</sub>alquiltio, trifluorometilo o trifluorometoxi, donde s y t son independientemente uno de otro 0, 1, 2 o 3, y el total de s + t no es mayor de 3.

65

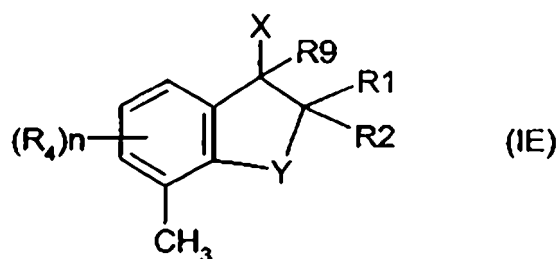
# ES 2 353 159 T3

Un grupo preferido de compuestos nuevos de fórmula IC son los compuestos de fórmula ID



15 o sus sales o N-óxidos, donde Y es CR<sup>5</sup>R<sup>6</sup> o CR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>CR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>, y R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>9</sup>, X y n son los definidos antes, donde al menos uno de R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>7</sup>, R<sup>8</sup> o R<sup>9</sup> es flúor,

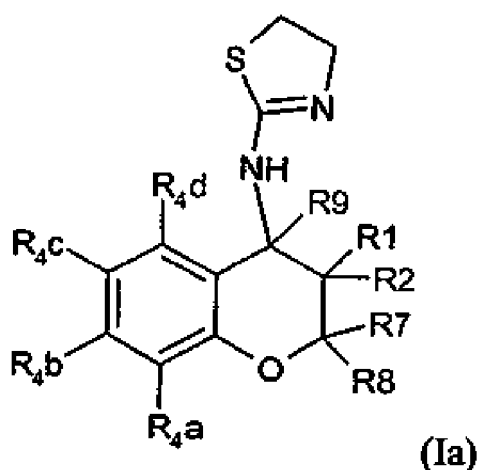
y los de fórmula IE



35 o sus sales o N-óxidos, donde Y es CR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>, y R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>9</sup> y X son los definidos antes y n es 0, 1, 2 o 3.

Los compuestos de las tablas I a LXIII siguientes ilustran los compuestos de la invención.

La tabla I estipula 612 compuestos de fórmula Ia



65 donde los valores de R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>4a</sup>, R<sup>4b</sup>, R<sup>4c</sup>, R<sup>4d</sup>, R<sup>7</sup>, R<sup>8</sup> y R<sup>9</sup> se indican en la tabla 1.

## ES 2 353 159 T3

TABLA 1

Compu esto N°	R9	R1	R2	R7	R8	R4a	R4b	R4c	R4d
I-1	Me	H	H	H	H	H	H	H	H
I-2	Et	H	H	H	H	H	H	H	H
I-3	vini lo	H	H	H	H	H	H	H	H
I-4	alilo	H	H	H	H	H	H	H	H
I-5	ciclo propi lo	H	H	H	H	H	H	H	H
I-6	CN	H	H	H	H	H	H	H	H
I-7	CONH <sub>2</sub>	H	H	H	H	H	H	H	H
I-8	CONHM e	H	H	H	H	H	H	H	H
I-9	CONMe 2	H	H	H	H	H	H	H	H
I-10	COMe	H	H	H	H	H	H	H	H
I-11	COOH	H	H	H	H	H	H	H	H
I-12	COOMe	H	H	H	H	H	H	H	H
I-13	CSNHM e	H	H	H	H	H	H	H	H
I-14	H	Me	H	H	H	H	H	H	H
I-15	H	Et	H	H	H	H	H	H	H
I-16	H	vinil o	H	H	H	H	H	H	H
I-17	H	alilo	H	H	H	H	H	H	H
I-18	H	ciclo propi lo	H	H	H	H	H	H	H
I-19	H	F	H	H	H	H	H	H	H
I-20	H	Cl	H	H	H	H	H	H	H
I-21	H	NO <sub>2</sub>	H	H	H	H	H	H	H

65

ES 2 353 159 T3

	I-22	H	CN	H	H	H	H	H	H
5	I-23	H	CONH <sub>2</sub>	H	H	H	H	H	H
	I-24	H	CONHM e	H	H	H	H	H	H
10	I-25	H	CONMe 2	H	H	H	H	H	H
	I-26	H	COMe	H	H	H	H	H	H
15	I-27	H	COOH	H	H	H	H	H	H
	I-28	H	COOMe	H	H	H	H	H	H
	I-29	H	CSOMe	H	H	H	H	H	H
20	I-30	H	CSNH <sub>2</sub>	H	H	H	H	H	H
	I-31	H	CSNMe 2	H	H	H	H	H	H
25	I-32	H	CSNHM e	H	H	H	H	H	H
	I-33	H	OMe	H	H	H	H	H	H
30	I-34	H	OEt	H	H	H	H	H	H
	I-35	H	OCOMe	H	H	H	H	H	H
35	I-36	H	OCOOM e	H	H	H	H	H	H
	I-37	H	OCONH Me	H	H	H	H	H	H
40	I-38	H	OCONM e <sub>2</sub>	H	H	H	H	H	H
45	I-39	H	OCSMe	H	H	H	H	H	H
	I-40	H	OCSNM e <sub>2</sub>	H	H	H	H	H	H
50	I-41	H	SMe	H	H	H	H	H	H
	I-42	H	SEt	H	H	H	H	H	H
55	I-43	H	SCOMe	H	H	H	H	H	H
	I-44	H	SCSNM e <sub>2</sub>	H	H	H	H	H	H
60	I-45	H	SCSNH Me	H	H	H	H	H	H
	I-46	H	NHMe	H	H	H	H	H	H
65	I-47	H	NH <sub>2</sub>	H	H	H	H	H	H

ES 2 353 159 T3

	I-48	H	NMe <sub>2</sub>	H	H	H	H	H	H	H
5	I-49	H	NHCOM e	H	H	H	H	H	H	H
	I-50	H	NHCON H <sub>2</sub>	H	H	H	H	H	H	H
10	I-51	H	NHCON HMe	H	H	H	H	H	H	H
	I-52	H	NHCON Me <sub>2</sub>	H	H	H	H	H	H	H
15	I-53	H	feni lo	H	H	H	H	H	H	H
	I-54	H	2- cloro feni lo	H	H	H	H	H	H	H
20										
25										
	I-55	H	4- nitro feni lo	H	H	H	H	H	H	H
30										
	I-56	H	2- piri dilo	H	H	H	H	H	H	H
35										
	I-57	H	3- piri dilo	H	H	H	H	H	H	H
40										
	I-58	H	4- piri dilo	H	H	H	H	H	H	H
45										
	I-59	H	2- furi lo	H	H	H	H	H	H	H
50										
	I-60	H	PhO	H	H	H	H	H	H	H
55	I-61	CH <sub>2</sub>		H	H	H	H	H	H	H
	I-62	H	=O	H	H	H	H	H	H	H
	I-63	H	=NOH	H	H	H	H	H	H	H
60	I-64	H	=NOMe	H	H	H	H	H	H	H
	I-65	H	=CH <sub>2</sub>	H	H	H	H	H	H	H
	I-66	H	=CHMe	H	H	H	H	H	H	H
65	I-67	H	H	H	H	H	H	H	H	H
	I-68	H	H	H	Me	H	H	H	H	H

## ES 2 353 159 T3

	I-69	H	H	H	Et	H	H	H	H	H
5	I-70	H	H	H	vinil o	H	H	H	H	H
	I-71	H	H	H	alilo	H	H	H	H	H
10	I-72	H	H	H	ciclo propi lo	H	H	H	H	H
	I-73	H	H	H	F	H	H	H	H	H
15	I-74	H	H	H	Cl	H	H	H	H	H
	I-75	H	H	H	NO <sub>2</sub>	H	H	H	H	H
	I-76	H	H	H	CN	H	H	H	H	H
20	I-77	H	H	H	CONH <sub>2</sub>	H	H	H	H	H
	I-78	H	H	H	CONHM e	H	H	H	H	H
25	I-79	H	H	H	CONMe 2	H	H	H	H	H
	I-80	H	H	H	COMe	H	H	H	H	H
30	I-81	H	H	H	COOH	H	H	H	H	H
	I-82	H	H	H	COOMe	H	H	H	H	H
	I-83	H	H	H	CSOMe	H	H	H	H	H
35	I-84	H	H	H	CSNH <sub>2</sub>	H	H	H	H	H
	I-85	H	H	H	CSNMe 2	H	H	H	H	H
40	I-86	H	H	H	CSNHM e	H	H	H	H	H
	I-87	H	H	H	OMe	H	H	H	H	H
45	I-88	H	H	H	OEt	H	H	H	H	H
	I-89	H	H	H	OCOMe	H	H	H	H	H
	I-90	H	H	H	OCOOM e	H	H	H	H	H
50	I-91	H	H	H	OCONH Me	H	H	H	H	H
	I-92	H	H	H	OCONM e <sub>2</sub>	H	H	H	H	H
	I-93	H	H	H	OCSMe	H	H	H	H	H
60	I-94	H	H	H	OCSNM e <sub>2</sub>	H	H	H	H	H
	I-95	H	H	H	SMe	H	H	H	H	H
65	I-96	H	H	H	SEt	H	H	H	H	H
	I-97	H	H	H	SCOMe	H	H	H	H	H

ES 2 353 159 T3

	I-98	H	H	H	SCSNM e <sub>2</sub>	H	H	H	H	H
5	I-99	H	H	H	SCSNH Me	H	H	H	H	H
	I-100	H	H	H	NHMe	H	H	H	H	H
10	I-101	H	H	H	NH <sub>2</sub>	H	H	H	H	H
	I-102	H	H	H	NMe <sub>2</sub>	H	H	H	H	H
15	I-103	H	H	H	NHCOM e	H	H	H	H	H
	I-104	H	H	H	NHCON H <sub>2</sub>	H	H	H	H	H
20	I-105	H	H	H	NHCON HMe	H	H	H	H	H
	I-106	H	H	H	NHCON Me <sub>2</sub>	H	H	H	H	H
25	I-107	H	H	H	feni lo	H	H	H	H	H
30	I-108	H	H	H	2- cloro feni lo	H	H	H	H	H
35										
40	I-109	H	H	H	4- nitro feni lo	H	H	H	H	H
45	I-110	H	H	H	2- piri dilo	H	H	H	H	H
50	I-111	H	H	H	3- piri dilo	H	H	H	H	H
55	I-112	H	H	H	4- piri dilo	H	H	H	H	H
60	I-113	H	H	H	2- furi lo	H	H	H	H	H
65	I-114	H	H	H	PhO	H	H	H	H	H
	I-115	H	H	H	=O	H	H	H	H	H
	I-116	H	H	H	=NOH	H	H	H	H	H

ES 2 353 159 T3

	I-117	H	H	H	=NOMe		H	H	H	H
	I-118	H	H	H	=CH <sub>2</sub>		H	H	H	H
5	I-119	H	H	H	=CHMe		H	H	H	H
	I-120	H	Me	H	Me	H	H	H	H	H
	I-121	H	Me	F	Me	H	H	H	H	H
10	I-122	H	Me	H	F	H	H	H	H	H
	I-123	H	Me	F	H	H	H	H	H	H
	I-124	H	Me	Me	H	H	H	H	H	H
15	I-125	H	F	H	Me	H	H	H	H	H
	I-126	H	F	H	F	H	H	H	H	H
	I-127	Me	H	H	H	H	F	H	H	H
20	I-128	Et	H	H	H	H	F	H	H	H
	I-129	vinil o	H	H	H	H	F	H	H	H
25	I-130	alilo	H	H	H	H	F	H	H	H
	I-131	ciclo propi lo	H	H	H	H	F	H	H	H
30	I-132	CN	H	H	H	H	F	H	H	H
	I-133	CONH <sub>2</sub>	H	H	H	H	F	H	H	H
35	I-134	CONHM e	H	H	H	H	F	H	H	H
	I-135	CONMe 2	H	H	H	H	F	H	H	H
40	I-136	COMe	H	H	H	H	F	H	H	H
	I-137	COOH	H	H	H	H	F	H	H	H
45	I-138	COOMe	H	H	H	H	F	H	H	H
	I-139	CSNHM e	H	H	H	H	F	H	H	H
50	I-140	H	Me	H	H	H	F	H	H	H
	I-141	H	Et	H	H	H	F	H	H	H
55	I-142	H	vinil o	H	H	H	F	H	H	H
	I-143	H	alilo	H	H	H	F	H	H	H
60	I-144	H	ciclo propi lo	H	H	H	F	H	H	H
	I-145	H	F	H	H	H	F	H	H	H
65	I-146	H	Cl	H	H	H	F	H	H	H

## ES 2 353 159 T3

	I-147	H	NO <sub>2</sub>	H	H	H	F	H	H	H
	I-148	H	CN	H	H	H	F	H	H	H
5	I-149	H	CONH <sub>2</sub>	H	H	H	F	H	H	H
	I-150	H	CONHM e	H	H	H	F	H	H	H
10	I-151	H	CONMe 2	H	H	H	F	H	H	H
	I-152	H	COMe	H	H	H	F	H	H	H
15	I-153	H	COOH	H	H	H	F	H	H	H
	I-154	H	COOMe	H	H	H	F	H	H	H
	I-155	H	CSOMe	H	H	H	F	H	H	H
20	I-156	H	CSNH <sub>2</sub>	H	H	H	F	H	H	H
	I-157	H	CSNMe 2	H	H	H	F	H	H	H
25	I-158	H	CSNHM e	H	H	H	F	H	H	H
	I-159	H	OMe	H	H	H	F	H	H	H
30	I-160	H	OEt	H	H	H	F	H	H	H
	I-161	H	OCOMe	H	H	H	F	H	H	H
	I-162	H	OCOOM e	H	H	H	F	H	H	H
35	I-163	H	OCONH Me	H	H	H	F	H	H	H
40	I-164	H	OCONM e <sub>2</sub>	H	H	H	F	H	H	H
	I-165	H	OCSMe	H	H	H	F	H	H	H
45	I-166	H	OCSNM e <sub>2</sub>	H	H	H	F	H	H	H
	I-167	H	SMe	H	H	H	F	H	H	H
50	I-168	H	SEt	H	H	H	F	H	H	H
	I-169	H	SCOMe	H	H	H	F	H	H	H
	I-170	H	SCSNM e <sub>2</sub>	H	H	H	F	H	H	H
55	I-171	H	SCSNH Me	H	H	H	F	H	H	H
60	I-172	H	NHMe	H	H	H	F	H	H	H
	I-173	H	NH <sub>2</sub>	H	H	H	F	H	H	H
	I-174	H	NMe <sub>2</sub>	H	H	H	F	H	H	H
65	I-175	H	NHCOM e	H	H	H	F	H	H	H

ES 2 353 159 T3

5	I-176	H	NHCON H <sub>2</sub>	H	H	H	F	H	H	H
	I-177	H	NHCON HMe	H	H	H	F	H	H	H
10	I-178	H	NHCON Me <sub>2</sub>	H	H	H	F	H	H	H
	I-179	H	feni lo	H	H	H	F	H	H	H
15	I-180	H	2- cloro feni lo	H	H	H	F	H	H	H
20										
25	I-181	H	4- nitro feni lo	H	H	H	F	H	H	H
	I-182	H	2- piri dilo	H	H	H	F	H	H	H
30										
35	I-183	H	3- piri dilo	H	H	H	F	H	H	H
	I-184	H	4- piri dilo	H	H	H	F	H	H	H
40										
45	I-185	H	2- furi lo	H	H	H	F	H	H	H
	I-186	H	PhO	H	H	H	F	H	H	H
50	I-187	CH <sub>2</sub>		H	H	H	F	H	H	H
	I-188	H	H	H	Me	H	F	H	H	H
55	I-190	H	H	H	vinil o	H	F	H	H	H
	I-191	H	H	H	alilo	H	F	H	H	H
60	I-192	H	H	H	ciclo propi lo	H	F	H	H	H
	I-193	H	H	H	F	H	F	H	H	H
65	I-194	H	H	H	Cl	H	F	H	H	H
	I-195	H	H	H	NO <sub>2</sub>	H	F	H	H	H

## ES 2 353 159 T3

	I-196	H	H	H	CN	H	F	H	H	H
	I-197	H	H	H	CONH <sub>2</sub>	H	F	H	H	H
5	I-198	H	H	H	CONHM e	H	F	H	H	H
10	I-199	H	H	H	CONMe 2	H	F	H	H	H
	I-200	H	H	H	COMe	H	F	H	H	H
	I-201	H	H	H	COOH	H	F	H	H	H
15	I-202	H	H	H	COOMe	H	F	H	H	H
	I-203	H	H	H	CSOMe	H	F	H	H	H
	I-204	H	H	H	CSNH <sub>2</sub>	H	F	H	H	H
20	I-205	H	H	H	CSNMe 2	H	F	H	H	H
25	I-206	H	H	H	CSNHM e	H	F	H	H	H
	I-207	H	H	H	OMe	H	F	H	H	H
	I-208	H	H	H	OEt	H	F	H	H	H
30	I-209	H	H	H	OCOMe	H	F	H	H	H
	I-210	H	H	H	OCOM e	H	F	H	H	H
35	I-211	H	H	H	OCONH Me	H	F	H	H	H
40	I-212	H	H	H	OCONM e <sub>2</sub>	H	F	H	H	H
	I-213	H	H	H	OCSMe	H	F	H	H	H
45	I-214	H	H	H	OCSNM e <sub>2</sub>	H	F	H	H	H
	I-215	H	H	H	SMe	H	F	H	H	H
	I-216	H	H	H	SEt	H	F	H	H	H
50	I-217	H	H	H	SCOMe	H	F	H	H	H
	I-218	H	H	H	SCSNM e <sub>2</sub>	H	F	H	H	H
55	I-219	H	H	H	SCSNH Me	H	F	H	H	H
	I-220	H	H	H	NHMe	H	F	H	H	H
60	I-221	H	H	H	NH <sub>2</sub>	H	F	H	H	H
	I-222	H	H	H	NMe <sub>2</sub>	H	F	H	H	H
	I-223	H	H	H	NHCOM e	H	F	H	H	H
65	I-224	H	H	H	NHCON	H	F	H	H	H

ES 2 353 159 T3

				H <sub>2</sub>						
5	I-225	H	H	H	NHCON HMe	H	F	H	H	H
10	I-226	H	H	H	NHCON Me <sub>2</sub>	H	F	H	H	H
	I-227	H	H	H	feni lo	H	F	H	H	H
15	I-228	H	H	H	2- cloro feni lo	H	F	H	H	H
20	I-229	H	H	H	4- nitro feni lo	H	F	H	H	H
25	I-230	H	H	H	2- piri dilo	H	F	H	H	H
30	I-231	H	H	H	3- piri dilo	H	F	H	H	H
35	I-232	H	H	H	4- piri dilo	H	F	H	H	H
40	I-233	H	H	H	2- furi lo	H	F	H	H	H
45	I-234	H	H	H	PhO	H	F	H	H	H
	I-235	H	Me	H	Me	H	F	H	H	H
50	I-236	H	Me	F	Me	H	F	H	H	H
	I-237	H	Me	H	F	H	F	H	H	H
	I-238	H	Me	F	H	H	F	H	H	H
55	I-239	H	Me	Me	H	H	F	H	H	H
	I-240	H	F	H	Me	H	F	H	H	H
	I-241	H	F	H	F	H	F	H	H	H
60	I-242	Me	H	H	H	H	Me	H	H	H
	I-243	Et	H	H	H	H	Me	H	H	H
	I-244	vinil o	H	H	H	H	Me	H	H	H
65	I-245	alilo	H	H	H	H	Me	H	H	H

## ES 2 353 159 T3

5	I-246	ciclo propi lo	H	H	H	H	Me	H	H	H
	I-247	CN	H	H	H	H	Me	H	H	H
10	I-248	CONH <sub>2</sub>	H	H	H	H	Me	H	H	H
	I-249	CONHM e	H	H	H	H	Me	H	H	H
15	I-250	CONMe 2	H	H	H	H	Me	H	H	H
	I-251	COMe	H	H	H	H	Me	H	H	H
20	I-252	COOH	H	H	H	H	Me	H	H	H
	I-253	COOMe	H	H	H	H	Me	H	H	H
25	I-254	CSNHM e	H	H	H	H	Me	H	H	H
	I-255	H	Me	H	H	H	Me	H	H	H
30	I-256	H	Et	H	H	H	Me	H	H	H
	I-257	H	vinil o	H	H	H	Me	H	H	H
35	I-258	H	alilo	H	H	H	Me	H	H	H
	I-259	H	ciclo propi lo	H	H	H	Me	H	H	H
40	I-260	H	F	H	H	H	Me	H	H	H
	I-261	H	Cl	H	H	H	Me	H	H	H
45	I-262	H	NO <sub>2</sub>	H	H	H	Me	H	H	H
	I-263	H	CN	H	H	H	Me	H	H	H
50	I-264	H	CONH <sub>2</sub>	H	H	H	Me	H	H	H
	I-265	H	CONHM e	H	H	H	Me	H	H	H
55	I-266	H	CONMe 2	H	H	H	Me	H	H	H
	I-267	H	COMe	H	H	H	Me	H	H	H
60	I-268	H	COOH	H	H	H	Me	H	H	H
	I-269	H	COOMe	H	H	H	Me	H	H	H
65	I-270	H	CSOMe	H	H	H	Me	H	H	H
	I-271	H	CSNH <sub>2</sub>	H	H	H	Me	H	H	H
	I-272	H	CSNMe 2	H	H	H	Me	H	H	H
	I-273	H	CSNHM e	H	H	H	Me	H	H	H

ES 2 353 159 T3

	I-274	H	OMe	H	H	H	Me	H	H	H
5	I-275	H	OEt	H	H	H	Me	H	H	H
	I-276	H	OCOMe	H	H	H	Me	H	H	H
10	I-277	H	OCOOMe	H	H	H	Me	H	H	H
	I-278	H	OCONHMe	H	H	H	Me	H	H	H
15	I-279	H	OCONMe <sub>2</sub>	H	H	H	Me	H	H	H
	I-280	H	OCSMe	H	H	H	Me	H	H	H
20	I-281	H	OCSNMe <sub>2</sub>	H	H	H	Me	H	H	H
	I-282	H	SMe	H	H	H	Me	H	H	H
25	I-283	H	SEt	H	H	H	Me	H	H	H
	I-284	H	SCOMe	H	H	H	Me	H	H	H
30	I-285	H	SCSNMe <sub>2</sub>	H	H	H	Me	H	H	H
	I-286	H	SCSNHMe	H	H	H	Me	H	H	H
35	I-287	H	NHMe	H	H	H	Me	H	H	H
	I-288	H	NH <sub>2</sub>	H	H	H	Me	H	H	H
40	I-289	H	NMe <sub>2</sub>	H	H	H	Me	H	H	H
	I-290	H	NHCOMe	H	H	H	Me	H	H	H
45	I-291	H	NHCONH <sub>2</sub>	H	H	H	Me	H	H	H
	I-292	H	NHCONHMe	H	H	H	Me	H	H	H
50	I-293	H	NHCONMe <sub>2</sub>	H	H	H	Me	H	H	H
	I-294	H	fenilo	H	H	H	Me	H	H	H
55	I-295	H	2-clorofenilo	H	H	H	Me	H	H	H
60										
65	I-296	H	4-nitrofenilo	H	H	H	Me	H	H	H

ES 2 353 159 T3

5	I-297	H	2- piri dilo	H	H	H	Me	H	H	H
10	I-298	H	3- piri dilo	H	H	H	Me	H	H	H
15	I-299	H	4- piri dilo	H	H	H	Me	H	H	H
20	I-300	H	2- furi lo	H	H	H	Me	H	H	H
25	I-301	H	PhO	H	H	H	Me	H	H	H
	I-302	CH <sub>2</sub>		H	H	H	Me	H	H	H
	I-303	H	H	H	Me	H	Me	H	H	H
	I-304	H	H	H	Et	H	Me	H	H	H
30	I-305	H	H	H	vinil o	H	Me	H	H	H
	I-306	H	H	H	alilo	H	Me	H	H	H
35	I-307	H	H	H	ciclo propi lo	H	Me	H	H	H
40	I-308	H	H	H	F	H	Me	H	H	H
	I-309	H	H	H	Cl	H	Me	H	H	H
	I-310	H	H	H	NO <sub>2</sub>	H	Me	H	H	H
	I-311	H	H	H	CN	H	Me	H	H	H
45	I-312	H	H	H	CONH <sub>2</sub>	H	Me	H	H	H
	I-313	H	H	H	CONHM e	H	Me	H	H	H
50	I-314	H	H	H	CONMe 2	H	Me	H	H	H
	I-315	H	H	H	COMe	H	Me	H	H	H
55	I-316	H	H	H	COOH	H	Me	H	H	H
	I-317	H	H	H	COOMe	H	Me	H	H	H
	I-318	H	H	H	CSOMe	H	Me	H	H	H
60	I-319	H	H	H	CSNH <sub>2</sub>	H	Me	H	H	H
	I-320	H	H	H	CSNMe 2	H	Me	H	H	H
65	I-321	H	H	H	CSNHM e	H	Me	H	H	H

## ES 2 353 159 T3

	I-322	H	H	H	OMe	H	Me	H	H	H
	I-323	H	H	H	OEt	H	Me	H	H	H
5	I-324	H	H	H	OCOMe	H	Me	H	H	H
	I-325	H	H	H	OCOOMe	H	Me	H	H	H
10	I-326	H	H	H	OCONHMe	H	Me	H	H	H
	I-327	H	H	H	OCONMe <sub>2</sub>	H	Me	H	H	H
15	I-328	H	H	H	OCSMe	H	Me	H	H	H
	I-329	H	H	H	OCSNMe <sub>2</sub>	H	Me	H	H	H
20	I-330	H	H	H	SMe	H	Me	H	H	H
	I-331	H	H	H	SEt	H	Me	H	H	H
25	I-332	H	H	H	SCOMe	H	Me	H	H	H
	I-333	H	H	H	SCSNMe <sub>2</sub>	H	Me	H	H	H
30	I-334	H	H	H	SCSNHMe	H	Me	H	H	H
	I-335	H	H	H	NHMe	H	Me	H	H	H
35	I-336	H	H	H	NH <sub>2</sub>	H	Me	H	H	H
	I-337	H	H	H	NMe <sub>2</sub>	H	Me	H	H	H
40	I-338	H	H	H	NHCOMe	H	Me	H	H	H
	I-339	H	H	H	NHCONH <sub>2</sub>	H	Me	H	H	H
45	I-340	H	H	H	NHCONHMe	H	Me	H	H	H
	I-341	H	H	H	NHCONMe <sub>2</sub>	H	Me	H	H	H
50	I-342	H	H	H	fenilo	H	Me	H	H	H
55	I-343	H	H	H	2-clorofenilo	H	Me	H	H	H
60										
65	I-344	H	H	H	4-nitrofenilo	H	Me	H	H	H

ES 2 353 159 T3

5	I-345	H	H	H	2- piri dilo	H	Me	H	H	H
10	I-346	H	H	H	3- piri dilo	H	Me	H	H	H
15	I-347	H	H	H	4- piri dilo	H	Me	H	H	H
20	I-348	H	H	H	2- furi lo	H	Me	H	H	H
25	I-349	H	H	H	PhO	H	Me	H	H	H
30	I-350	H	Me	H	Me	H	Me	H	H	H
35	I-351	H	Me	F	Me	H	Me	H	H	H
40	I-352	H	Me	H	F	H	Me	H	H	H
45	I-353	H	Me	F	H	H	Me	H	H	H
50	I-354	H	Me	Me	H	H	Me	H	H	H
55	I-355	H	F	H	Me	H	Me	H	H	H
60	I-356	H	F	H	F	H	Me	H	H	H
65	I-357	Me	H	H	H	H	F	H	F	H
	I-358	Et	H	H	H	H	F	H	F	H
	I-359	vinil o	H	H	H	H	F	H	F	H
	I-360	alilo	H	H	H	H	F	H	F	H
	I-361	ciclo propi lo	H	H	H	H	F	H	F	H
	I-362	CN	H	H	H	H	F	H	F	H
	I-363	CONH <sub>2</sub>	H	H	H	H	F	H	F	H
	I-364	CONHM e	H	H	H	H	F	H	F	H
	I-365	CONMe 2	H	H	H	H	F	H	F	H
	I-366	COMe	H	H	H	H	F	H	F	H
	I-367	COOH	H	H	H	H	F	H	F	H
	I-368	COOMe	H	H	H	H	F	H	F	H
	I-369	CSNHM e	H	H	H	H	F	H	F	H
	I-370	H	Me	H	H	H	F	H	F	H

ES 2 353 159 T3

	I-371	H	Et	H	H	H	F	H	F	H
5	I-372	H	vinil o	H	H	H	F	H	F	H
	I-373	H	alilo	H	H	H	F	H	F	H
10	I-374	H	ciclo propi lo	H	H	H	F	H	F	H
	I-375	H	F	H	H	H	F	H	F	H
15	I-376	H	Cl	H	H	H	F	H	F	H
	I-377	H	NO <sub>2</sub>	H	H	H	F	H	F	H
	I-378	H	CN	H	H	H	F	H	F	H
20	I-379	H	CONH <sub>2</sub>	H	H	H	F	H	F	H
	I-380	H	CONHM e	H	H	H	F	H	F	H
25	I-381	H	CONMe 2	H	H	H	F	H	F	H
	I-382	H	COMe	H	H	H	F	H	F	H
30	I-383	H	COOH	H	H	H	F	H	F	H
	I-384	H	COOMe	H	H	H	F	H	F	H
	I-385	H	CSOMe	H	H	H	F	H	F	H
35	I-386	H	CSNH <sub>2</sub>	H	H	H	F	H	F	H
	I-387	H	CSNMe 2	H	H	H	F	H	F	H
40	I-388	H	CSNHM e	H	H	H	F	H	F	H
	I-389	H	OMe	H	H	H	F	H	F	H
45	I-390	H	OEt	H	H	H	F	H	F	H
	I-391	H	OCOMe	H	H	H	F	H	F	H
	I-392		OCOOM e	H	H	H	F	H	F	H
50	I-393	H	OCONH Me	H	H	H	F	H	F	H
55	I-394	H	OCONM e <sub>2</sub>	H	H	H	F	H	F	H
	I-395	H	OCSMe	H	H	H	F	H	F	H
60	I-396	H	OCSNM e <sub>2</sub>	H	H	H	F	H	F	H
	I-397	H	SMe	H	H	H	F	H	F	H
65	I-398	H	SEt	H	H	H	F	H	F	H
	I-399	H	SCOMe	H	H	H	F	H	F	H

ES 2 353 159 T3

	I-400	H	SCSNM e <sub>2</sub>	H	H	H	F	H	F	H
5	I-401	H	SCSNH Me	H	H	H	F	H	F	H
	I-402	H	NHMe	H	H	H	F	H	F	H
10	I-403	H	NH <sub>2</sub>	H	H	H	F	H	F	H
	I-404	H	NMe <sub>2</sub>	H	H	H	F	H	F	H
15	I-405	H	NHCOM e	H	H	H	F	H	F	H
	I-406	H	NHCON H <sub>2</sub>	H	H	H	F	H	F	H
20	I-407	H	NHCON HMe	H	H	H	F	H	F	H
	I-408	H	NHCON Me <sub>2</sub>	H	H	H	F	H	F	H
25	I-409	H	feni lo	H	H	H	F	H	F	H
30	I-410	H	2- cloro feni lo	H	H	H	F	H	F	H
35	I-411	H	4- nitro feni lo	H	H	H	F	H	F	H
40	I-412	H	2- piri dilo	H	H	H	F	H	F	H
45	I-413	H	3- piri dilo	H	H	H	F	H	F	H
50	I-414	H	4- piri dilo	H	H	H	F	H	F	H
55	I-415	H	2- furi lo	H	H	H	F	H	F	H
60	I-416	H	PhO	H	H	H	F	H	F	H
65	I-417		CH <sub>2</sub>	H	H	H	F	H	F	H
	I-418	H	H	H	Me		F	H	F	H

## ES 2 353 159 T3

	I-419	H	H	H	Et		F	H	F	H
5	I-420	H	H	H	vinil o		F	H	F	H
	I-421	H	H	H	alilo		F	H	F	H
10	I-422	H	H	H	ciclo propi lo		F	H	F	H
15	I-423	H	H	H	F	H	F	H	F	H
	I-424	H	H	H	Cl	H	F	H	F	H
	I-425	H	H	H	NO <sub>2</sub>	H	F	H	F	H
20	I-426	H	H	H	CN	H	F	H	F	H
	I-427	H	H	H	CONH <sub>2</sub>	H	F	H	F	H
25	I-428	H	H	H	CONHM e	H	F	H	F	H
	I-429	H	H	H	CONMe 2	H	F	H	F	H
30	I-430	H	H	H	COMe	H	F	H	F	H
	I-431	H	H	H	COOH	H	F	H	F	H
	I-432	H	H	H	COOMe	H	F	H	F	H
35	I-433	H	H	H	CSOMe	H	F	H	F	H
	I-434	H	H	H	CSNH <sub>2</sub>	H	F	H	F	H
40	I-435	H	H	H	CSNMe 2	H	F	H	F	H
	I-436	H	H	H	CSNHM e	H	F	H	F	H
45	I-437	H	H	H	OMe	H	F	H	F	H
	I-438	H	H	H	OEt	H	F	H	F	H
	I-439	H	H	H	OCOMe	H	F	H	F	H
50	I-440	H	H	H	OCOOM e	H	F	H	F	H
55	I-441	H	H	H	OCONH Me	H	F	H	F	H
	I-442	H	H	H	OCONM e <sub>2</sub>	H	F	H	F	H
60	I-443	H	H	H	OCSMe	H	F	H	F	H
	I-444	H	H	H	OCSNM e <sub>2</sub>	H	F	H	F	H
65	I-445	H	H	H	SMe	H	F	H	F	H
	I-446	H	H	H	SEt	H	F	H	F	H

## ES 2 353 159 T3

	I-447	H	H	H	SCOMe	H	F	H	F	H
5	I-448	H	H	H	SCSNM e <sub>2</sub>	H	F	H	F	H
	I-449	H	H	H	SCSNH Me	H	F	H	F	H
10	I-450	H	H	H	NHMe	H	F	H	F	H
	I-451	H	H	H	NH <sub>2</sub>	H	F	H	F	H
	I-452	H	H	H	NMe <sub>2</sub>	H	F	H	F	H
15	I-453	H	H	H	NHCOM e	H	F	H	F	H
	I-454	H	H	H	NHCON H <sub>2</sub>	H	F	H	F	H
20	I-455	H	H	H	NHCON HMe	H	F	H	F	H
	I-456	H	H	H	NHCON Me <sub>2</sub>	H	F	H	F	H
25	I-457	H	H	H	fenil o	H	F	H	F	H
30	I-458	H	H	H	2- cloro feni lo	H	F	H	F	H
35	I-459	H	H	H	4- nitro feni lo	H	F	H	F	H
40	I-460	H	H	H	2- piri dilo	H	F	H	F	H
45	I-461	H	H	H	3- piri dilo	H	F	H	F	H
50	I-462	H	H	H	4- pirid ilo	H	F	H	F	H
55	I-463	H	H	H	2- furi lo	H	F	H	F	H
60	I-464	H	H	H	PhO	H	F	H	F	H
65	I-465	H	Me	H	Me	H	F	H	F	H

ES 2 353 159 T3

	I-466	H	Me	F	Me	H	F	H	F	H
	I-467	H	Me	H	F	H	F	H	F	H
5	I-468	H	Me	F	H	H	F	H	F	H
	I-469	H	Me	Me	H	H	F	H	F	H
	I-470	H	F	H	Me	H	F	H	F	H
10	I-471	H	F	H	F	H	F	H	F	H
	I-472	H	H	H	H	H	Me	H	H	H
	I-473	H	H	H	H	H	Et	H	H	H
15	I-474	H	H	H	H	H	vinil o	H	H	H
	I-475	H	H	H	H	H	alilo	H	H	H
20	I-476	H	H	H	H	H	ciclo propi lo	H	H	H
	I-477	H	H	H	H	H	F	H	H	H
	I-478	H	H	H	H	H	Cl	H	H	H
	I-479	H	H	H	H	H	NO <sub>2</sub>	H	H	H
30	I-480	H	H	H	H	H	CN	H		H
	I-481	H	H	H	H	H	CONH <sub>2</sub>	H	H	H
	I-482	H	H	H	H	H	CONHM e	H	H	H
35	I-483	H	H	H	H	H	CONMe 2	H	H	H
	I-484	H	H	H	H	H	COMe	H	H	H
	I-485	H	H	H	H	H	COOH	H	H	H
45	I-486	H	H	H	H	H	COOMe	H	H	H
	I-487	H	H	H	H	H	CSOMe	H	H	H
	I-488	H	H	H	H	H	CSNH <sub>2</sub>	H	H	H
	I-489	H	H	H	H	H	CSNMe 2	H	H	H
50	I-490	H	H	H	H	H	CSNHM e	H	H	H
55	I-491	H	H	H	H	H	OMe	H	H	H
	I-492	H	H	H	H	H	OEt	H	H	H
60	I-493	H	H	H	H	H	OCOMe	H	H	H
	I-494	H	H	H	H	H	OCOOM e	H	H	H
65	I-495	H	H	H	H	H	OCONH Me	H	H	H

## ES 2 353 159 T3

	I-496	H	H	H	H	H	OCOMM e <sub>2</sub>	H	H	H
5	I-497	H	H	H	H	H	OCSMe	H	H	H
	I-498	H	H	H	H	H	OCSNM e <sub>2</sub>	H	H	H
10	I-499	H	H	H	H	H	SMe	H	H	H
	I-500	H	H	H	H	H	SEt	H	H	H
	I-501	H	H	H	H	H	SCOMe	H	H	H
15	I-502	H	H	H	H	H	SCSNM e <sub>2</sub>	H	H	H
	I-503	H	H	H	H	H	SCSNH Me	H	H	H
20	I-504	H	H	H	H	H	NHMe	H	H	H
	I-505	H	H	H	H	H	NH <sub>2</sub>	H	H	H
25	I-506	H	H	H	H	H	NMe <sub>2</sub>	H	H	H
	I-507	H	H	H	H	H	NHCOM e	H	H	H
30	I-508	H	H	H	H	H	NHCON H <sub>2</sub>	H	H	H
	I-509	H	H	H	H	H	NHCON HMe	H	H	H
35	I-510	H	H	H	H	H	NHCON Me <sub>2</sub>	H	H	H
	I-511	H	H	H	H	H	feni lo	H	H	H
40	I-512	H	H	H	H	H	2- cloro feni lo	H	H	H
45										
50	I-513	H	H	H	H	H	4- nitro feni lo	H	H	H
55										
60	I-514	H	H	H	H	H	2- piri dilo	H	H	H
	I-515	H	H	H	H	H	3- piri dilo	H	H	H
65	I-516	H	H	H	H	H	4-	H	H	H

ES 2 353 159 T3

						piri dilo				
5	I-517	H	H	H	H	H	2- furi lo	H	H	H
10	I-518	H	H	H	H	H	PhO	H	H	H
	I-519	H	H	H	H	H	H	H	Me	H
	I-520	H	H	H	H	H	H	H	Et	H
15	I-521	H	H	H	H	H	H	H	vinil o	H
	I-522	H	H	H	H	H	H	H	alilo	H
20	I-523	H	H	H	H	H	H	H	ciclo propi lo	H
25	I-524	H	H	H	H	H	H	H	F	H
	I-525	H	H	H	H	H	H	H	Cl	H
	I-526	H	H	H	H	H	H	H	NO <sub>2</sub>	H
30	I-527	H	H	H	H	H	H	H	CN	H
	I-528	H	H	H	H	H	H	H	CONH <sub>2</sub>	H
	I-529	H	H	H	H	H	H	H	CONHM e	H
35	I-530	H	H	H	H	H	H	H	CONMe 2	H
40	I-531	H	H	H	H	H	H	H	COMe	H
	I-532	H	H	H	H	H	H	H	COOH	H
	I-533	H	H	H	H	H	H	H	COOMe	H
45	I-534	H	H	H	H	H	H	H	CSOMe	H
	I-535	H	H	H	H	H	H	H	CSNH <sub>2</sub>	H
	I-536	H	H	H	H	H	H	H	CSNMe 2	H
50	I-537	H	H	H	H	H	H	H	CSNHM e	H
55	I-538	H	H	H	H	H	H	H	OMe	H
	I-539	H	H	H	H	H	H	H	OEt	H
	I-540	H	H	H	H	H	H	H	OCOMe	H
60	I-541	H	H	H	H	H	H	H	OCOOM e	H
	I-542	H	H	H	H	H	H	H	OCONH Me	H
65	I-543	H	H	H	H	H	H	H	OCONM	H

# ES 2 353 159 T3

								e <sub>2</sub>	
5	I-544	H	H	H	H	H	H	OCSMe	H
	I-545	H	H	H	H	H	H	OCSNM	H
								e <sub>2</sub>	
10	I-546	H	H	H	H	H	H	SMe	H
	I-547	H	H	H	H	H	H	SEt	H
	I-548	H	H	H	H	H	H	SCOMe	H
15	I-549	H	H	H	H	H	H	SCSNM	H
								e <sub>2</sub>	
20	I-550	H	H	H	H	H	H	SCSNH	H
								Me	
	I-551	H	H	H	H	H	H	NHMe	H
	I-552	H	H	H	H	H	H	NH <sub>2</sub>	H
	I-553	H	H	H	H	H	H	NMe <sub>2</sub>	H
25	I-554	H	H	H	H	H	H	NHCOM	H
								e	
30	I-555	H	H	H	H	H	H	NHCON	H
								H <sub>2</sub>	
	I-556	H	H	H	H	H	H	NHCON	H
								HMe	
35	I-557	H	H	H	H	H	H	NHCON	H
								Me <sub>2</sub>	
40	I-558	H	H	H	H	H	H	fenil	H
								o	
45	I-559	H	H	H	H	H	H	2-clo	H
								rofe	
								nilo	
50	I-560	H	H	H	H	H	H	4-ni	H
								trofe	
								nilo	
55	I-561	H	H	H	H	H	H	2-	H
								piri	
								dilo	
60	I-562	H	H	H	H	H	H	3-	H
								piri	
								dilo	
65	I-563	H	H	H	H	H	H	4-	H
								piri	
								dilo	
	I-564	H	H	H	H	H	H	2-fu	H

ES 2 353 159 T3

								rilo	
5	I-565	H	H	H	H	H	H	PhO	H
	I-566	H	H	H	H	H	H	H	Me
	I-567	H	H	H	H	H	H	H	Et
10	I-568	H	H	H	H	H	H	H	vinil o
	I-569	H	H	H	H	H	H	H	alilo
15	I-570	H	H	H	H	H	H	H	ciclo propi lo
	I-571	H	H	H	H	H	H	H	F
20	I-572	H	H	H	H	H	H	H	Cl
	I-573	H	H	H	H	H	H	H	NO <sub>2</sub>
	I-574	H	H	H	H	H	H	H	CN
25	I-575	H	H	H	H	H	H	H	CONH <sub>2</sub>
	I-576	H	H	H	H	H	H	H	CONHM e
30	I-577	H	H	H	H	H	H	H	CONMe 2
	I-578	H	H	H	H	H	H	H	COMe
35	I-579	H	H	H	H	H	H	H	COOH
	I-580	H	H	H	H	H	H	H	COOMe
	I-581	H	H	H	H	H	H	H	CSOMe
40	I-582	H	H	H	H	H	H	H	CSNH <sub>2</sub>
	I-583	H	H	H	H	H	H	H	CSNMe 2
45	I-584	H	H	H	H	H	H	H	CSNHM e
	I-585	H	H	H	H	H	H	H	OMe
50	I-586	H	H	H	H	H	H	H	OEt
	I-587	H	H	H	H	H	H	H	OCOMe
	I-588	H	H	H	H	H	H	H	OCCOM e
55	I-589	H	H	H	H	H	H	H	OCONH Me
60	I-590	H	H	H	H	H	H	H	OCONM e <sub>2</sub>
	I-591	H	H	H	H	H	H	H	OCSMe
65	I-592	H	H	H	H	H	H	H	OCSNM e <sub>2</sub>

ES 2 353 159 T3

	I-593	H	H	H	H	H	H	H	SMe
	I-594	H	H	H	H	H	H	H	SEt
5	I-595	H	H	H	H	H	H	H	SCOMe
	I-596	H	H	H	H	H	H	H	SCSNM e <sub>2</sub>
10	I-597	H	H	H	H	H	H	H	SCSNH Me
	I-598	H	H	H	H	H	H	H	NHMe
15	I-599	H	H	H	H	H	H	H	NH <sub>2</sub>
	I-600	H	H	H	H	H	H	H	NMe <sub>2</sub>
20	I-601	H	H	H	H	H	H	H	NHCOM e
	I-602	H	H	H	H	H	H	H	NHCON H <sub>2</sub>
25	I-603	H	H	H	H	H	H	H	NHCON HMe
	I-604	H	H	H	H	H	H	H	NHCON Me <sub>2</sub>
30	I-605	H	H	H	H	H	H	H	feni lo
35	I-606	H	H	H	H	H	H	H	2-clo rofe nilo
40	I-607	H	H	H	H	H	H	H	4-ni trofe nilo
45	I-608	H	H	H	H	H	H	H	2- piri dilo
50	I-609	H	H	H	H	H	H	H	3- piri dilo
55	I-610	H	H	H	H	H	H	H	4- piri dilo
60	I-611	H	H	H	H	H	H	H	2-fu rilo
65	I-612	H	H	H	H	H	H	H	PhO

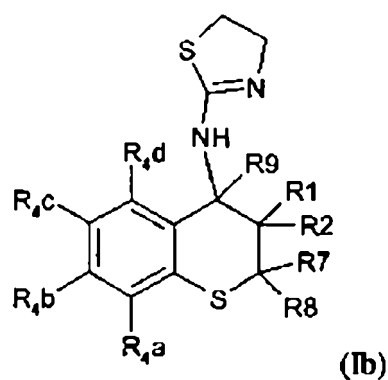
# ES 2 353 159 T3

La tabla II estipula 612 compuestos de fórmula Ib

5

10

15



20

donde los valores de  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^{4a}$ ,  $R^{4b}$ ,  $R^{4c}$ ,  $R^{4d}$ ,  $R^7$ ,  $R^8$  y  $R^9$  se indican en la tabla 1.

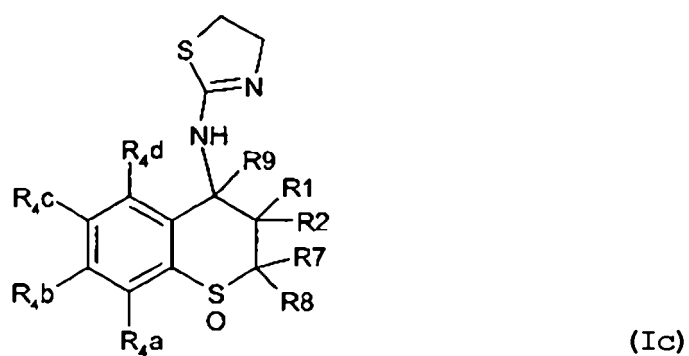
25

La tabla III estipula 612 compuestos de fórmula Ic

30

35

40



45

donde los valores de  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^{4a}$ ,  $R^{4b}$ ,  $R^{4c}$ ,  $R^{4d}$ ,  $R^7$ ,  $R^8$  y  $R^9$  se indican en la tabla 1.

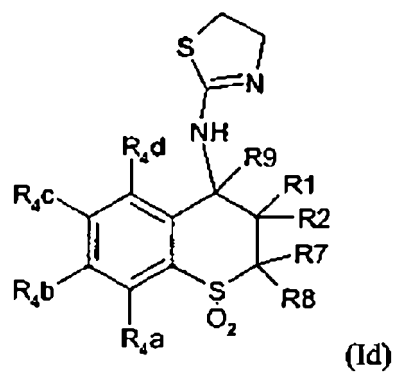
50

La tabla IV estipula 612 compuestos de fórmula Id

55

60

65



donde los valores de  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^{4a}$ ,  $R^{4b}$ ,  $R^{4c}$ ,  $R^{4d}$ ,  $R^7$ ,  $R^8$  y  $R^9$  se indican en la tabla 1.

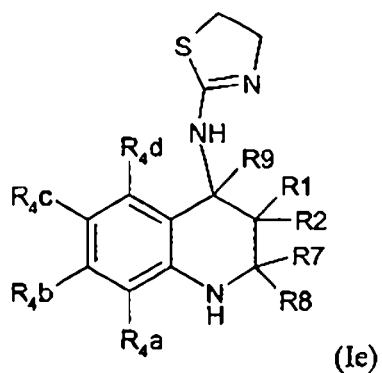
ES 2 353 159 T3

La tabla V estipula 612 compuestos de fórmula Ie

5

10

15



20

donde los valores de R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>4a</sup>, R<sup>4b</sup>, R<sup>4c</sup>, R<sup>4d</sup>, R<sup>7</sup>, R<sup>8</sup> y R<sup>9</sup> se indican en la tabla 1.

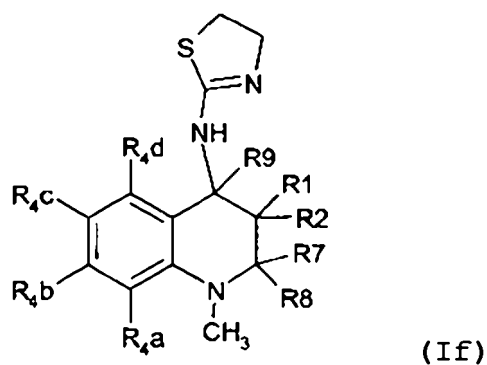
La tabla VI estipula 612 compuestos de fórmula If

25

30

35

40



45

donde los valores de R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>4a</sup>, R<sup>4b</sup>, R<sup>4c</sup>, R<sup>4d</sup>, R<sup>7</sup>, R<sup>8</sup> y R<sup>9</sup> se indican en la tabla 1.

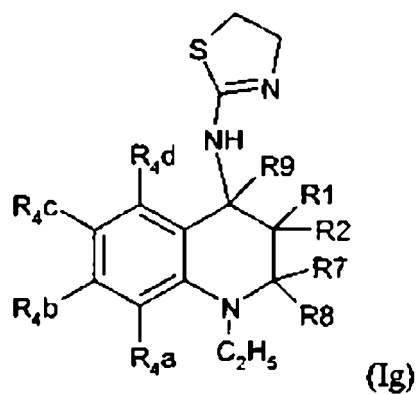
La tabla VII estipula 612 compuestos de fórmula Ig

50

55

60

65



donde los valores de R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>4a</sup>, R<sup>4b</sup>, R<sup>4c</sup>, R<sup>4d</sup>, R<sup>7</sup>, R<sup>8</sup> y R<sup>9</sup> se indican en la tabla 1.

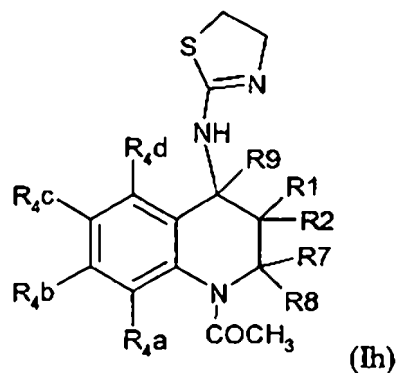
# ES 2 353 159 T3

La tabla VIII estipula 612 compuestos de fórmula Ih

5

10

15



20

donde los valores de R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>4a</sup>, R<sup>4b</sup>, R<sup>4c</sup>, R<sup>4d</sup>, R<sup>7</sup>, R<sup>8</sup> y R<sup>9</sup> se indican en la tabla 1.

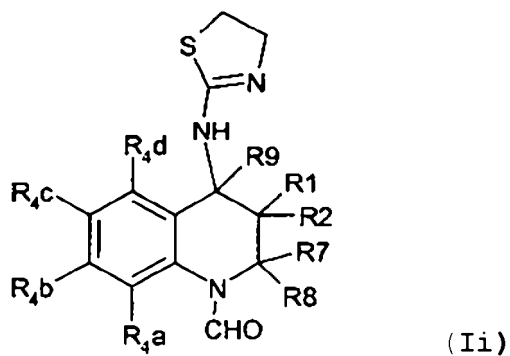
25

La tabla IX estipula 612 compuestos de fórmula Ii

30

35

40



45

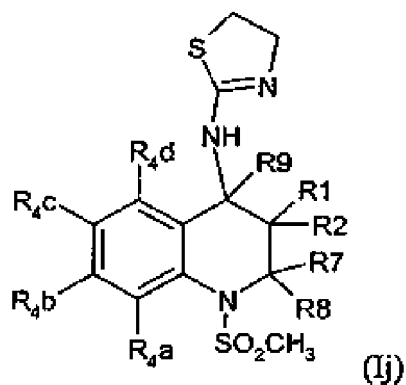
donde los valores de R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>4a</sup>, R<sup>4b</sup>, R<sup>4c</sup>, R<sup>4d</sup>, R<sup>7</sup>, R<sup>8</sup> y R<sup>9</sup> se indican en la tabla 1.

La tabla X estipula 612 compuestos de fórmula Ij

50

55

60

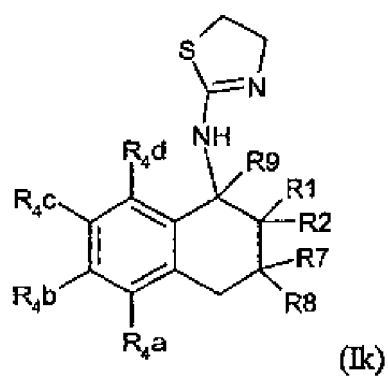


65

donde los valores de R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>4a</sup>, R<sup>4b</sup>, R<sup>4c</sup>, R<sup>4d</sup>, R<sup>7</sup>, R<sup>8</sup> y R<sup>9</sup> se indican en la tabla 1.

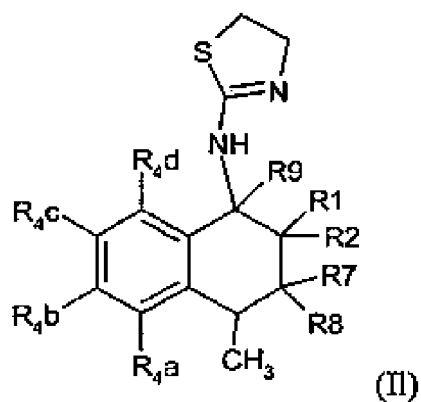
# ES 2 353 159 T3

La tabla XI estipula 612 compuestos de fórmula Ik



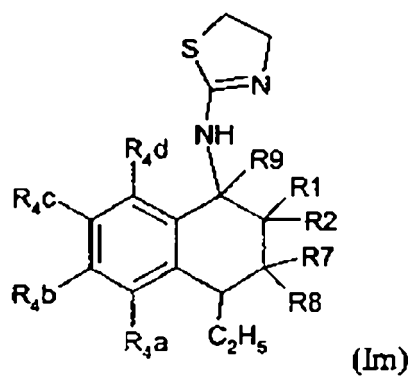
20 donde los valores de  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^{4a}$ ,  $R^{4b}$ ,  $R^{4c}$ ,  $R^{4d}$ ,  $R^7$ ,  $R^8$  y  $R^9$  se indican en la tabla 1.

La tabla XII estipula 612 compuestos de fórmula II



45 donde los valores de  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^{4a}$ ,  $R^{4b}$ ,  $R^{4c}$ ,  $R^{4d}$ ,  $R^7$ ,  $R^8$  y  $R^9$  se indican en la tabla 1.

La tabla XIII estipula 612 compuestos de fórmula Im



donde los valores de  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^{4a}$ ,  $R^{4b}$ ,  $R^{4c}$ ,  $R^{4d}$ ,  $R^7$ ,  $R^8$  y  $R^9$  se indican en la tabla 1.

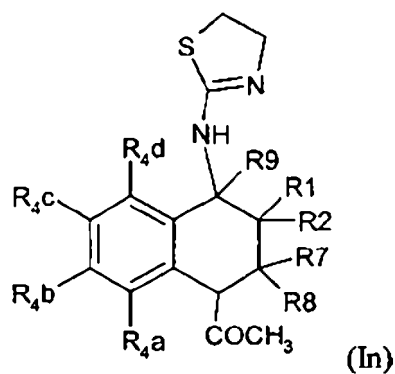
# ES 2 353 159 T3

La tabla XIV estipula 612 compuestos de fórmula In

5

10

15



20

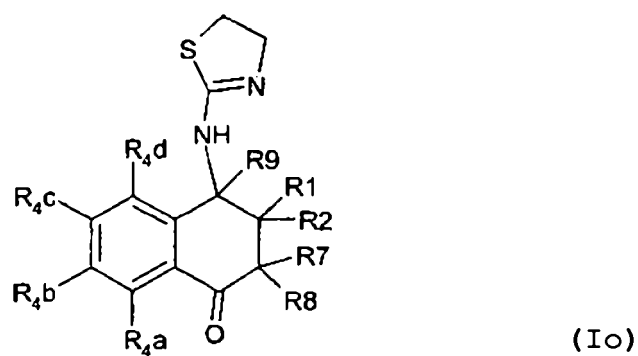
donde los valores de R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>4a</sup>, R<sup>4b</sup>, R<sup>4c</sup>, R<sup>4d</sup>, R<sup>7</sup>, R<sup>8</sup> y R<sup>9</sup> se indican en la tabla 1.

La tabla XV estipula 612 compuestos de fórmula Io

25

30

35



40

donde los valores de R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>4a</sup>, R<sup>4b</sup>, R<sup>4c</sup>, R<sup>4d</sup>, R<sup>7</sup>, R<sup>8</sup> y R<sup>9</sup> se indican en la tabla 1.

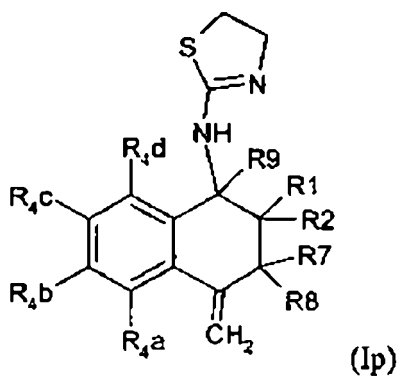
45

La tabla XVI estipula 612 compuestos de fórmula Ip

50

55

60

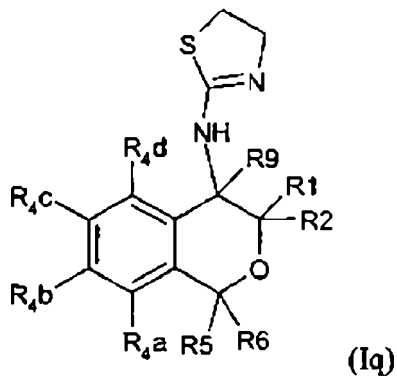


65

donde los valores de R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>4a</sup>, R<sup>4b</sup>, R<sup>4c</sup>, R<sup>4d</sup>, R<sup>7</sup>, R<sup>8</sup> y R<sup>9</sup> se indican en la tabla 1.

# ES 2 353 159 T3

La tabla XVII estipula 612 compuestos de fórmula Iq



20 donde los valores de R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>4a</sup>, R<sup>4b</sup>, R<sup>4c</sup>, R<sup>4d</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> y R<sup>9</sup> se indican en la tabla 2.

TABLA 2

25

30

35

40

45

50

55

60

65

Compu esto N°	R <sup>9</sup>	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>5</sup>	R <sup>6</sup>	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>4c</sup>	R <sup>4d</sup>
XVII- 1	Me	H	H	H	H	H	H	H	H
XVII- 2	Et	H	H	H	H	H	H	H	H
XVII- 3	vinil o	H	H	H	H	H	H	H	H
XVII- 4	alilo	H	H	H	H	H	H	H	H
XVII- 5	ciclo propi lo	H	H	H	H	H	H	H	H
XVII- 6	CN	H	H	H	H	H	H	H	H
XVII- 7	CONH <sub>2</sub>	H	H	H	H	H	H	H	H
XVII- 8	CONHM e	H	H	H	H	H	H	H	H
XVII- 9	CONMe 2	H	H	H	H	H	H	H	H
XVII- 10	COMe	H	H	H	H	H	H	H	H

ES 2 353 159 T3

	XVII- 11	COOH	H	H	H	H	H	H	H
5	XVII- 12	COOMe	H	H	H	H	H	H	H
10	XVII- 13	CSNHMe	H	H	H	H	H	H	H
	XVII- 14	H	Me	H	H	H	H	H	H
15	XVII- 15	H	Et	H	H	H	H	H	H
20	XVII- 16	H	vinil o	H	H	H	H	H	H
	XVII- 17	H	alilo	H	H	H	H	H	H
25	XVII- 18	H	ciclo propi lo	H	H	H	H	H	H
30	XVII- 19	H	F	H	H	H	H	H	H
35	XVII- 20	H	Cl	H	H	H	H	H	H
	XVII- 21	H	NO <sub>2</sub>	H	H	H	H	H	H
40	XVII- 22	H	CN	H	H	H	H	H	H
45	XVII- 23	H	CONH <sub>2</sub>	H	H	H	H	H	H
	XVII- 24	H	CONHMe	H	H	H	H	H	H
50	XVII- 25	H	CONMe <sub>2</sub>	H	H	H	H	H	H
55	XVII- 26	H	COMe	H	H	H	H	H	H
	XVII- 27	H	COOH	H	H	H	H	H	H
60	XVII- 28	H	COOMe	H	H	H	H	H	H
	XVII- 29	H	CSOMe	H	H	H	H	H	H
65	XVII-	H	CSNH <sub>2</sub>	H	H	H	H	H	H

# ES 2 353 159 T3

	30								
5	XVII- 31	H	CSNMe 2	H	H	H	H	H	H
	XVII- 32	H	CSNHMe	H	H	H	H	H	H
10	XVII- 33	H	OMe	H	H	H	H	H	H
15	XVII- 34	H	OEt	H	H	H	H	H	H
	XVII- 35	H	OCOMe	H	H	H	H	H	H
20	XVII- 36	H	OCOOMe	H	H	H	H	H	H
25	XVII- 37	H	OCONHMe	H	H	H	H	H	H
	XVII- 38	H	OCONMe <sub>2</sub>	H	H	H	H	H	H
30	XVII- 39	H	OCSMe	H	H	H	H	H	H
35	XVII- 40	H	OCSNMe <sub>2</sub>	H	H	H	H	H	H
40	XVII- 41	H	SMe	H	H	H	H	H	H
	XVII- 42	H	SEt	H	H	H	H	H	H
45	XVII- 43	H	SCOMe	H	H	H	H	H	H
	XVII- 44	H	SCSNMe <sub>2</sub>	H	H	H	H	H	H
50	XVII- 45	H	SCSNHMe	H	H	H	H	H	H
55	XVII- 46	H	NHMe	H	H	H	H	H	H
	XVII- 47	H	NH <sub>2</sub>	H	H	H	H	H	H
60	XVII- 48	H	NMe <sub>2</sub>	H	H	H	H	H	H
	XVII- 49	H	NHCOMe	H	H	H	H	H	H
65	XVII-	H	NHCON	H	H	H	H	H	H

ES 2 353 159 T3

	50		H <sub>2</sub>						
5	XVII- 51	H	NHCON HMe	H	H	H	H	H	H
	XVII- 52	H	NHCON Me <sub>2</sub>	H	H	H	H	H	H
10	XVII- 53	H	fenil o	H	H	H	H	H	H
15	XVII- 54	H	2- cloro fenil o	H	H	H	H	H	H
20	XVII- 55	H	4- nitro fenil o	H	H	H	H	H	H
25									
30	XVII- 56	H	2- pirid ilo	H	H	H	H	H	H
35	XVII- 57	H	3- pirid ilo	H	H	H	H	H	H
40	XVII- 58	H	4- pirid ilo	H	H	H	H	H	H
45	XVII- 59	H	2- furil o	H	H	H	H	H	H
50	XVII- 60	H	PhO	H	H	H	H	H	H
	XVII- 61		CH <sub>2</sub>	H	H	H	H	H	H
55	XVII- 62	H	=O	H	H	H	H	H	H
	XVII- 63	H	=NOH	H	H	H	H	H	H
60	XVII- 64	H	=NOMe	H	H	H	H	H	H
	XVII- 65	H	=CH <sub>2</sub>	H	H	H	H	H	H
65	XVII- 65	H	=CHMe	H	H	H	H	H	H

ES 2 353 159 T3

	66								
5	XVII- 67	H	H	H	H	H	H	H	H
	XVII- 68	H	H	H	Me	H	H	H	H
10	XVII- 69	H	H	H	Et	H	H	H	H
15	XVII- 70	H	H	H	vinil o	H	H	H	H
	XVII- 71	H	H	H	alilo	H	H	H	H
20	XVII- 72	H	H	H	ciclo propi lo	H	H	H	H
25	XVII- 73	H	H	H	F	H	H	H	H
30	XVII- 74	H	H	H	Cl	H	H	H	H
	XVII- 75	H	H	H	NO <sub>2</sub>	H	H	H	H
35	XVII- 76	H	H	H	CN	H	H	H	H
40	XVII- 77	H	H	H	CONH <sub>2</sub>	H	H	H	H
	XVII- 78	H	H	H	CONHM e	H	H	H	H
45	XVII- 79	H	H	H	CONMe 2	H	H	H	H
50	XVII- 80	H	H	H	COMe	H	H	H	H
	XVII- 81	H	H	H	COOH	H	H	H	H
55	XVII- 82	H	H	H	COOMe	H	H	H	H
	XVII- 83	H	H	H	CSOMe	H	H	H	H
60	XVII- 84	H	H	H	CSNH <sub>2</sub>	H	H	H	H
65	XVII- 85	H	H	H	CSNMe 2	H	H	H	H

# ES 2 353 159 T3

5	XVII- 86	H	H	H	CSNHMe	H	H	H	H	H
	XVII- 87	H	H	H	OMe	H	H	H	H	H
10	XVII- 88	H	H	H	OEt	H	H	H	H	H
	XVII- 89	H	H	H	OCOMe	H	H	H	H	H
15	XVII- 90	H	H	H	OCOOMe	H	H	H	H	H
	XVII- 91	H	H	H	OCONHMe	H	H	H	H	H
20	XVII- 92	H	H	H	OCONMe <sub>2</sub>	H	H	H	H	H
	XVII- 93	H	H	H	OCSMe	H	H	H	H	H
25	XVII- 94	H	H	H	OCSNHMe <sub>2</sub>	H	H	H	H	H
	XVII- 95	H	H	H	SMe	H	H	H	H	H
30	XVII- 96	H	H	H	SEt	H	H	H	H	H
	XVII- 97	H	H	H	SCOMe	H	H	H	H	H
40	XVII- 98	H	H	H	SCSNHMe <sub>2</sub>	H	H	H	H	H
	XVII- 99	H	H	H	SCSNHMe	H	H	H	H	H
45	XVII- 100	H	H	H	NHMe	H	H	H	H	H
	XVII- 101	H	H	H	NH <sub>2</sub>	H	H	H	H	H
50	XVII- 102	H	H	H	NMe <sub>2</sub>	H	H	H	H	H
	XVII- 103	H	H	H	NHCOMe	H	H	H	H	H
55	XVII- 104	H	H	H	NHCONH <sub>2</sub>	H	H	H	H	H
60	XVII- 105	H	H	H	NHCONHMe	H	H	H	H	H

ES 2 353 159 T3

	XVII- 106	H	H	H	NHCON Me <sub>2</sub>	H	H	H	H	H
5	XVII- 107	H	H	H	fenil o	H	H	H	H	H
10	XVII- 108	H	H	H	2- cloro fenil o	H	H	H	H	H
15	XVII- 109	H	H	H	4- nitro fenil o	H	H	H	H	H
20										
25	XVII- 110	H	H	H	2- pirid ilo	H	H	H	H	H
30	XVII- 111	H	H	H	3- pirid ilo	H	H	H	H	H
35	XVII- 112	H	H	H	4- pirid ilo	H	H	H	H	H
40	XVII- 113	H	H	H	2- furil o	H	H	H	H	H
45	XVII- 114	H	H	H	PhO	H	H	H	H	H
	XVII- 115	H	H	H	=O	H	H	H	H	H
50	XVII- 116	H	H	H	=NOH	H	H	H	H	H
55	XVII- 117	H	H	H	=NOMe	H	H	H	H	H
60	XVII- 118	H	H	H	=CH <sub>2</sub>	H	H	H	H	H
	XVII- 119	H	H	H	=CHMe	H	H	H	H	H
65	XVII- 120	H	Me	H	Me	H	H	H	H	H
	XVII- 121	H	Me	F	Me	H	H	H	H	H

ES 2 353 159 T3

5	XVII- 122	H	Me	H	F	H	H	H	H
	XVII- 123	H	Me	F	H	H	H	H	H
10	XVII- 124	H	Me	Me	H	H	H	H	H
	XVII- 125	H	F	H	Me	H	H	H	H
15	XVII- 126	H	F	H	F	H	H	H	H
	XVII- 127	Me	H	H	H	H	F	H	H
20	XVII- 128	Et	H	H	H	H	F	H	H
	XVII- 129	vinil o	H	H	H	H	F	H	H
25	XVII- 130	alilo	H	H	H	H	F	H	H
	XVII- 131	ciclo propi lo	H	H	H	H	F	H	H
30	XVII- 132	CN	H	H	H	H	F	H	H
	XVII- 133	CONH <sub>2</sub>	H	H	H	H	F	H	H
35	XVII- 134	CONHM e	H	H	H	H	F	H	H
	XVII- 135	CONMe 2	H	H	H	H	F	H	H
40	XVII- 136	COMe	H	H	H	H	F	H	H
	XVII- 137	COOH	H	H	H	H	F	H	H
45	XVII- 138	COOMe	H	H	H	H	F	H	H
	XVII- 139	CSNHM e	H	H	H	H	F	H	H
50	XVII- 140	H	Me	H	H	H	F	H	H
	XVII-	H	Et	H	H	H	F	H	H

## ES 2 353 159 T3

	141								
5	XVII-142	H	vinil	H	H	H	F	H	H
			o						
10	XVII-143	H	alilo	H	H	H	F	H	H
15	XVII-144	H	ciclo propi lo	H	H	H	F	H	H
20	XVII-145	H	F	H	H	H	F	H	H
25	XVII-146	H	Cl	H	H	H	F	H	H
30	XVII-147	H	NO <sub>2</sub>	H	H	H	F	H	H
35	XVII-148	H	CN	H	H	H	F	H	H
40	XVII-149	H	CONH <sub>2</sub>	H	H	H	F	H	H
45	XVII-150	H	CONHM e	H	H	H	F	H	H
50	XVII-151	H	CONMe 2	H	H	H	F	H	H
55	XVII-152	H	COMe	H	H	H	F	H	H
60	XVII-153	H	COOH	H	H	H	F	H	H
65	XVII-154	H	COOMe	H	H	H	F	H	H
	XVII-155	H	CSOMe	H	H	H	F	H	H
	XVII-156	H	CSNH <sub>2</sub>	H	H	H	F	H	H
	XVII-157	H	CSNMe 2	H	H	H	F	H	H
	XVII-158	H	CSNHM e	H	H	H	F	H	H
	XVII-159	H	OMe	H	H	H	F	H	H
	XVII-160	H	OEt	H	H	H	F	H	H

ES 2 353 159 T3

	XVII- 161	H	OCOMe	H	H	H	F	H	H	H
5	XVII- 162	H	OCOOM e	H	H	H	F	H	H	H
10	XVII- 163	H	OCONH Me	H	H	H	F	H	H	H
	XVII- 164	H	OCONM e <sub>2</sub>	H	H	H	F	H	H	H
15	XVII- 165	H	OCSMe	H	H	H	F	H	H	H
20	XVII- 166	H	OCSNM e <sub>2</sub>	H	H	H	F	H	H	H
	XVII- 167	H	SMe	H	H	H	F	H	H	H
25	XVII- 168	H	SEt	H	H	H	F	H	H	H
	XVII- 169	H	SCOMe	H	H	H	F	H	H	H
30	XVII- 170	H	SCSNM e <sub>2</sub>	H	H	H	F	H	H	H
35	XVII- 171	H	SCSNH Me	H	H	H	F	H	H	H
	XVII- 172	H	NHMe	H	H	H	F	H	H	H
40	XVII- 173	H	NH <sub>2</sub>	H	H	H	F	H	H	H
45	XVII- 174	H	NMe <sub>2</sub>	H	H	H	F	H	H	H
	XVII- 175	H	NHCOM e	H	H	H	F	H	H	H
50	XVII- 176	H	NHCON H <sub>2</sub>	H	H	H	F	H	H	H
55	XVII- 177	H	NHCON HMe	H	H	H	F	H	H	H
	XVII- 178	H	NHCON Me <sub>2</sub>	H	H	H	F	H	H	H
60	XVII- 179	H	fenil o	H	H	H	F	H	H	H
65	XVII- 180	H	2- cloro	H	H	H	F	H	H	H

ES 2 353 159 T3

		fenil o								
5	XVII- 181	H	4- nitro fenil o	H	H	H	F	H	H	H
10	XVII- 182	H	2- pirid ilo	H	H	H	F	H	H	H
15	XVII- 183	H	3- pirid ilo	H	H	H	F	H	H	H
20	XVII- 184	H	4- pirid ilo	H	H	H	F	H	H	H
25	XVII- 185	H	2- furil o	H	H	H	F	H	H	H
30	XVII- 186	H	PhO	H	H	H	F	H	H	H
35	XVII- 187		CH <sub>2</sub>	H	H	H	F		H	H
40	XVII- 188	H	H	H	Me	H	F	H	H	H
45	XVII- 189	H	H	H	Et	H	F	H	H	H
50	XVII- 190	H	H	H	vinil o	H	F	H	H	H
55	XVII- 191	H	H	H	alilo	H	F	H	H	H
60	XVII- 192	H	H	H	ciclo propi lo	H	F	H	H	H
65	XVII- 193	H	H	H	F	H	F	H	H	H
	XVII- 194	H	H	H	Cl	H	F	H	H	H
	XVII- 195	H	H	H	NO <sub>2</sub>	H	F	H	H	H
	XVII- 196	H	H	H	CN	H	F	H	H	H

## ES 2 353 159 T3

	196								
5	XVII- 197	H	H	H	CONH <sub>2</sub>	H	F	H	H
	XVII- 198	H	H	H	CONHM e	H	F	H	H
10	XVII- 199	H	H	H	CONMe 2	H	F	H	H
15	XVII- 200	H	H	H	COMe	H	F	H	H
	XVII- 201	H	H	H	COOH	H	F	H	H
20	XVII- 202	H	H	H	COOMe	H	F	H	H
	XVII- 203	H	H	H	CSOMe	H	F	H	H
25	XVII- 204	H	H	H	CSNH <sub>2</sub>	H	F	H	H
	XVII- 205	H	H	H	CSNMe 2	H	F	H	H
30	XVII- 206	H	H	H	CSNHM e	H	F	H	H
35	XVII- 207	H	H	H	OMe	H	F	H	H
	XVII- 208	H	H	H	OEt	H	F	H	H
40	XVII- 209	H	H	H	OCOMe	H	F	H	H
45	XVII- 210	H	H	H	OCOOM e	H	F	H	H
	XVII- 211	H	H	H	OCONH Me	H	F	H	H
50	XVII- 212	H	H	H	OCONM e <sub>2</sub>	H	F	H	H
55	XVII- 213	H	H	H	OCSMe	H	F	H	H
	XVII- 214	H	H	H	OCSNM e <sub>2</sub>	H	F	H	H
60	XVII- 215	H	H	H	SMe	H	F	H	H
65	XVII-	H	H	H	SEt	H	F	H	H

ES 2 353 159 T3

	216								
5	XVII- 217	H	H	H	SCOMe	H	F	H	H
	XVII- 218	H	H	H	SCSNM e <sub>2</sub>	H	F	H	H
10	XVII- 219	H	H	H	SCSNH Me	H	F	H	H
15	XVII- 220	H	H	H	NHMe	H	F	H	H
	XVII- 221	H	H	H	NH <sub>2</sub>	H	F	H	H
20	XVII- 222	H	H	H	NMe <sub>2</sub>	H	F	H	H
25	XVII- 223	H	H	H	NHCOM e	H	F	H	H
	XVII- 224	H	H	H	NHCON H <sub>2</sub>	H	F	H	H
30	XVII- 225	H	H	H	NHCON HMe	H	F	H	H
35	XVII- 226	H	H	H	NHCON Me <sub>2</sub>	H	F	H	H
	XVII- 227	H	H	H	fenil o	H	F	H	H
40	XVII- 228	H	H	H	2- cloro fenil o	H	F	H	H
45									
50	XVII- 229	H	H	H	4- nitro fenil o	H	F	H	H
55	XVII- 230	H	H	H	2- pirid ilo	H	F	H	H
60	XVII- 231	H	H	H	3- pirid ilo	H	F	H	H
65	XVII- 232	H	H	H	4- pirid ilo	H	F	H	H

ES 2 353 159 T3

5	XVII- 233	H	H	H	2- furil o	H	F	H	H	H
	XVII- 234	H	H	H	PhO	H	F	H	H	H
10	XVII- 235	H	Me	H	Me	H	F	H	H	H
	XVII- 236	H	Me	F	Me	H	F	H	H	H
15	XVII- 237	H	Me	H	F	H	F	H	H	H
	XVII- 238	H	Me	F	H	H	F	H	H	H
20	XVII- 239	H	Me	Me	H	H	F	H	H	H
	XVII- 240	H	F	H	Me	H	F	H	H	H
25	XVII- 241	H	F	H	F	H	F	H	H	H
	XVII- 242	Me	H	H	H	H	Me	H	H	H
30	XVII- 243	Et	H	H	H	H	Me	H	H	H
	XVII- 244	vinil o	H	H	H	H	Me	H	H	H
35	XVII- 245	alilo	H	H	H	H	Me	H	H	H
	XVII- 246	ciclo propi lo	H	H	H	H	Me	H	H	H
40	XVII- 247	CN	H	H	H	H	Me	H	H	H
	XVII- 248	CONH <sub>2</sub>	H	H	H	H	Me	H	H	H
45	XVII- 249	CONHM e	H	H	H	H	Me	H	H	H
	XVII- 250	CONMe 2	H	H	H	H	Me	H	H	H
50	XVII- 251	COMe	H	H	H	H	Me	H	H	H
55										
60										
65										

## ES 2 353 159 T3

	XVII- 252	COOH	H	H	H	H	Me	H	H	H
5	XVII- 253	COOMe	H	H	H	H	Me	H	H	H
10	XVII- 254	CSNHMe	H	H	H	H	Me	H	H	H
	XVII- 255	H	Me	H	H	H	Me	H	H	H
15	XVII- 256	H	Et	H	H	H	Me	H	H	H
20	XVII- 257	H	vinil o	H	H	H	Me	H	H	H
	XVII- 258	H	alilo	H	H	H	Me	H	H	H
25	XVII- 259	H	ciclo propi lo	H	H	H	Me	H	H	H
30	XVII- 260	H	F	H	H	H	Me	H	H	H
	XVII- 261	H	Cl	H	H	H	Me	H	H	H
35	XVII- 262	H	NO <sub>2</sub>	H	H	H	Me	H	H	H
40	XVII- 263	H	CN	H	H	H	Me	H	H	H
	XVII- 264	H	CONH <sub>2</sub>	H	H	H	Me	H	H	H
45	XVII- 265	H	CONHMe	H	H	H	Me	H	H	H
50	XVII- 266	H	CONMe <sub>2</sub>	H	H	H	Me	H	H	H
	XVII- 267	H	COMe	H	H	H	Me	H	H	H
55	XVII- 268	H	COOH	H	H	H	Me	H	H	H
60	XVII- 269	H	COOMe	H	H	H	Me	H	H	H
	XVII- 270	H	CSOMe	H	H	H	Me	H	H	H
65	XVII- 270	H	CSNH <sub>2</sub>	H	H	H	Me	H	H	H

ES 2 353 159 T3

	271								
5	XVII- 272	H	CSNMe <sub>2</sub>	H	H	H	Me	H	H
	XVII- 273	H	CSNHMe	H	H	H	Me	H	H
10	XVII- 274	H	OMe	H	H	H	Me	H	H
	XVII- 275	H	OEt	H	H	H	Me	H	H
15	XVII- 276	H	OCOMe	H	H	H	Me	H	H
	XVII- 277	H	OCOOMe	H	H	H	Me	H	H
20	XVII- 278	H	OCONHMe	H	H	H	Me	H	H
	XVII- 279	H	OCONMe <sub>2</sub>	H	H	H	Me	H	H
25	XVII- 280	H	OCSMe	H	H	H	Me	H	H
	XVII- 281	H	OCSNMe <sub>2</sub>	H	H	H	Me	H	H
30	XVII- 282	H	SMe	H	H	H	Me	H	H
	XVII- 283	H	SEt	H	H	H	Me	H	H
35	XVII- 284	H	SCOMe	H	H	H	Me	H	H
	XVII- 285	H	SCSNMe <sub>2</sub>	H	H	H	Me	H	H
40	XVII- 286	H	SCSNHMe	H	H	H	Me	H	H
	XVII- 287	H	NHMe	H	H	H	Me	H	H
45	XVII- 288	H	NH <sub>2</sub>	H	H	H	Me	H	H
	XVII- 289	H	NMe <sub>2</sub>	H	H	H	Me	H	H
50	XVII- 290	H	NHCOMe	H	H	H	Me	H	H
	XVII-	H	NHCON	H	H	H	Me	H	H
55									
60									
65									

ES 2 353 159 T3

	291		H <sub>2</sub>						
5	XVII- 292	H	NHCON HMe	H	H	H	Me	H	H
10	XVII- 293	H	NHCON Me <sub>2</sub>	H	H	H	Me	H	H
15	XVII- 294	H	fenil o	H	H	H	Me	H	H
20	XVII- 295	H	2- cloro fenil o	H	H	H	Me	H	H
25	XVII- 296	H	4- nitro fenil o	H	H	H	Me	H	H
30	XVII- 297	H	2- pirid ilo	H	H	H	Me	H	H
35	XVII- 298	H	3- pirid ilo	H	H	H	Me	H	H
40	XVII- 299	H	4- pirid ilo	H	H	H	Me	H	H
45	XVII- 300	H	2- furil o	H	H	H	Me	H	H
50	XVII- 301	H	PhO	H	H	H	Me	H	H
55	XVII- 302		CH <sub>2</sub>	H	H	H	Me	H	H
60	XVII- 303	H	H	H	Me	H	Me	H	H
65	XVII- 304	H	H	H	Et	H	Me	H	H
	XVII- 305	H	H	H	vinil o	H	Me	H	H
	XVII- 306	H	H	H	alilo	H	Me	H	H
	XVII-	H	H	H	ciclo	H	Me	H	H

## ES 2 353 159 T3

	307				propilo				
5	XVII-308	H	H	H	F	H	Me	H	H
10	XVII-309	H	H	H	Cl	H	Me	H	H
15	XVII-310	H	H	H	NO <sub>2</sub>	H	Me	H	H
20	XVII-311	H	H	H	CN	H	Me	H	H
25	XVII-312	H	H	H	CONH <sub>2</sub>	H	Me	H	H
30	XVII-313	H	H	H	CONHMe	H	Me	H	H
35	XVII-314	H	H	H	CONMe <sub>2</sub>	H	Me	H	H
40	XVII-315	H	H	H	COMe	H	Me	H	H
45	XVII-316	H	H	H	COOH	H	Me	H	H
50	XVII-317	H	H	H	COOMe	H	Me	H	H
55	XVII-318	H	H	H	CSOMe	H	Me	H	H
60	XVII-319	H	H	H	CSNH <sub>2</sub>	H	Me	H	H
65	XVII-320	H	H	H	CSNMe <sub>2</sub>	H	Me	H	H
	XVII-321	H	H	H	CSNHMe	H	Me	H	H
	XVII-322	H	H	H	OMe	H	Me	H	H
	XVII-323	H	H	H	OEt	H	Me	H	H
	XVII-324	H	H	H	OCOMe	H	Me	H	H
	XVII-325	H	H	H	OCOOMe	H	Me	H	H
	XVII-326	H	H	H	OCONHMe	H	Me	H	H

## ES 2 353 159 T3

5	XVII- 327	H	H	H	OCONM e <sub>2</sub>	H	Me	H	H	H
	XVII- 328	H	H	H	OCSMe	H	Me	H	H	H
10	XVII- 329	H	H	H	OCSNM e <sub>2</sub>	H	Me	H	H	H
	XVII- 330	H	H	H	SMe	H	Me	H	H	H
15	XVII- 331	H	H	H	SEt	H	Me	H	H	H
	XVII- 332	H	H	H	SCOMe	H	Me	H	H	H
20	XVII- 333	H	H	H	SCSNM e <sub>2</sub>	H	Me	H	H	H
25	XVII- 334	H	H	H	SCSNH Me	H	Me	H	H	H
	XVII- 335	H	H	H	NHMe	H	Me	H	H	H
30	XVII- 336	H	H	H	NH <sub>2</sub>	H	Me	H	H	H
35	XVII- 337	H	H	H	NMe <sub>2</sub>	H	Me	H	H	H
	XVII- 338	H	H	H	NHCOM e	H	Me	H	H	H
40	XVII- 339	H	H	H	NHCON H <sub>2</sub>	H	Me	H	H	H
45	XVII- 340	H	H	H	NHCON HMe	H	Me	H	H	H
	XVII- 341	H	H	H	NHCON Me <sub>2</sub>	H	Me	H	H	H
50	XVII- 342	H	H	H	fenil o	H	Me	H	H	H
55	XVII- 343	H	H	H	2- cloro fenil o	H	Me	H	H	H
60	XVII- 344	H	H	H	4- nitro fenil o	H	Me	H	H	H
65										

ES 2 353 159 T3

5	XVII- 345	H	H	H	2- pirid ilo	H	Me	H	H	H
10	XVII- 346	H	H	H	3- pirid ilo	H	Me	H	H	H
15	XVII- 347	H	H	H	4- pirid ilo	H	Me	H	H	H
20	XVII- 348	H	H	H	2- furil o	H	Me	H	H	H
25	XVII- 349	H	H	H	PhO	H	Me	H	H	H
30	XVII- 350	H	Me	H	Me	H	Me	H	H	H
35	XVII- 351	H	Me	F	Me	H	Me	H	H	H
40	XVII- 352	H	Me	H	F	H	Me	H	H	H
45	XVII- 353	H	Me	F	H	H	Me	H	H	H
50	XVII- 354	H	Me	Me	H	H	Me	H	H	H
55	XVII- 355	H	F	H	Me	H	Me	H	H	H
60	XVII- 356	H	F	H	F	H	Me	H	H	H
65	XVII- 357	Me	H	H	H	H	F	H	F	H
	XVII- 358	Et	H	H	H	H	F	H	F	H
	XVII- 359	vinil o	H	H	H	H	F	H	F	H
	XVII- 360	alilo	H	H	H	H	F	H	F	H
	XVII- 361	ciclo propi lo	H	H	H	H	F	H	F	H
	XVII- 362	CN	H	H	H	H	F	H	F	H

ES 2 353 159 T3

	362									
5	XVII- 363	CONH <sub>2</sub>	H	H	H	H	F	H	F	H
	XVII- 364	CONHM e	H	H	H	H	F	H	F	H
10	XVII- 365	CONMe 2	H	H	H	H	F	H	F	H
15	XVII- 366	COMe	H	H	H	H	F	H	F	H
	XVII- 367	COOH	H	H	H	H	F	H	F	H
20	XVII- 368	COOMe	H	H	H	H	F	H	F	H
	XVII- 369	CSNHM e	H	H	H	H	F	H	F	H
25	XVII- 370	H	Me	H	H	H	F	H	F	H
30	XVII- 371	H	Et	H	H	H	F	H	F	H
	XVII- 372	H	vinil o	H	H	H	F	H	F	H
35	XVII- 373	H	alilo	H	H	H	F	H	F	H
40	XVII- 374	H	ciclo propi lo	H	H	H	F	H	F	H
45	XVII- 375	H	F	H	H	H	F	H	F	H
	XVII- 376	H	Cl	H	H	H	F	H	F	H
50	XVII- 377	H	NO <sub>2</sub>	H	H	H	F	H	F	H
	XVII- 378	H	CN	H	H	H	F	H	F	H
55	XVII- 379	H	CONH <sub>2</sub>	H	H	H	F	H	F	H
60	XVII- 380	H	CONHM e	H	H	H	F	H	F	H
65	XVII- 381	H	CONMe 2	H	H	H	F	H	F	H

ES 2 353 159 T3

5	XVII- 382	H	COMe	H	H	H	F	H	F	H
	XVII- 383	H	COOH	H	H	H	F	H	F	H
10	XVII- 384	H	COOMe	H	H	H	F	H	F	H
	XVII- 385	H	CSOMe	H	H	H	F	H	F	H
15	XVII- 386	H	CSNH <sub>2</sub>	H	H	H	F	H	F	H
	XVII- 387	H	CSNMe <sub>2</sub>	H	H	H	F	H	F	H
20	XVII- 388	H	CSNHMe	H	H	H	F	H	F	H
	XVII- 389	H	OMe	H	H	H	F	H	F	H
25	XVII- 390	H	OEt	H	H	H	F	H	F	H
	XVII- 391	H	OCOMe	H	H	H	F	H	F	H
30	XVII- 392		OCOOMe	H	H	H	F	H	F	H
	XVII- 393	H	OCONHMe	H	H	H	F	H	F	H
35	XVII- 394	H	OCONMe <sub>2</sub>	H	H	H	F	H	F	H
	XVII- 395	H	OCSMe	H	H	H	F	H	F	H
40	XVII- 396	H	OCSNMe <sub>2</sub>	H	H	H	F	H	F	H
	XVII- 397	H	SMe	H	H	H	F	H	F	H
45	XVII- 398	H	SEt	H	H	H	F	H	F	H
	XVII- 399	H	SCOMe	H	H	H	F	H	F	H
50	XVII- 400	H	SCSNMe <sub>2</sub>	H	H	H	F	H	F	H
	XVII- 401	H	SCSNHMe	H	H	H	F	H	F	H
55										
60										
65										

ES 2 353 159 T3

	XVII- 402	H	NHMe	H	H	H	F	H	F	H
5	XVII- 403	H	NH <sub>2</sub>	H	H	H	F	H	F	H
10	XVII- 404	H	NMe <sub>2</sub>	H	H	H	F	H	F	H
15	XVII- 405	H	NHCOM e	H	H	H	F	H	F	H
20	XVII- 406	H	NHCON H <sub>2</sub>	H	H	H	F	H	F	H
25	XVII- 407	H	NHCON HMe	H	H	H	F	H	F	H
30	XVII- 408	H	NHCON Me <sub>2</sub>	H	H	H	F	H	F	H
35	XVII- 409	H	fenil o	H	H	H	F	H	F	H
40	XVII- 410	H	2- cloro fenil o	H	H	H	F	H	F	H
45	XVII- 411	H	4- nitro fenil o	H	H	H	F	H	F	H
50	XVII- 412	H	2- pirid ilo	H	H	H	F	H	F	H
55	XVII- 413	H	3- pirid ilo	H	H	H	F	H	F	H
60	XVII- 414	H	4- pirid ilo	H	H	H	F	H	F	H
65	XVII- 415	H	2- furil o	H	H	H	F	H	F	H
	XVII- 416	H	PhO	H	H	H	F	H	F	H
	XVII- 417		CH <sub>2</sub>	H	H	H	F	H	F	H

## ES 2 353 159 T3

	XVII- 418	H	H	H	Me	H	F	H	F	H
5	XVII- 419	H	H	H	Et	H	F	H	F	H
10	XVII- 420	H	H	H	vinil o	H	F	H	F	H
	XVII- 421	H	H	H	alilo	H	F	H	F	H
15	XVII- 422	H	H	H	ciclo propi lo	H	F	H	F	H
20	XVII- 423	H	H	H	F	H	F	H	F	H
25	XVII- 424	H	H	H	Cl	H	F	H	F	H
	XVII- 425	H	H	H	NO <sub>2</sub>	H	F	H	F	H
30	XVII- 426	H	H	H	CN	H	F	H	F	H
35	XVII- 427	H	H	H	CONH <sub>2</sub>	H	F	H	F	H
40	XVII- 428	H	H	H	CONHM e	H	F	H	F	H
	XVII- 429	H	H	H	CONMe 2	H	F	H	F	H
45	XVII- 430	H	H	H	COMe	H	F	H	F	H
	XVII- 431	H	H	H	COOH	H	F	H	F	H
50	XVII- 432	H	H	H	COOMe	H	F	H	F	H
55	XVII- 433	H	H	H	CSOMe	H	F	H	F	H
	XVII- 434	H	H	H	CSNH <sub>2</sub>	H	F	H	F	H
60	XVII- 435	H	H	H	CSNMe 2	H	F	H	F	H
65	XVII- 436	H	H	H	CSNHM e	H	F	H	F	H
	XVII- 437	H	H	H	OMe	H	F	H	F	H

## ES 2 353 159 T3

	437									
5	XVII- 438	H	H	H	OEt	H	F	H	F	H
	XVII- 439	H	H	H	OCOMe	H	F	H	F	H
10	XVII- 440	H	H	H	OCOOMe	H	F	H	F	H
15	XVII- 441	H	H	H	OCONHMe	H	F	H	F	H
	XVII- 442	H	H	H	OCONMe <sub>2</sub>	H	F	H	F	H
20	XVII- 443	H	H	H	OCSMe	H	F	H	F	H
25	XVII- 444	H	H	H	OCSNMe <sub>2</sub>	H	F	H	F	H
	XVII- 445	H	H	H	SMe	H	F	H	F	H
30	XVII- 446	H	H	H	SEt	H	F	H	F	H
	XVII- 447	H	H	H	SCOMe	H	F	H	F	H
35	XVII- 448	H	H	H	SCSNMe <sub>2</sub>	H	F	H	F	H
40	XVII- 449	H	H	H	SCSNHMe	H	F	H	F	H
	XVII- 450	H	H	H	NHMe	H	F	H	F	H
45	XVII- 451	H	H	H	NH <sub>2</sub>	H	F	H	F	H
50	XVII- 452	H	H	H	NMe <sub>2</sub>	H	F	H	F	H
	XVII- 453	H	H	H	NHCOMe	H	F	H	F	H
55	XVII- 454	H	H	H	NHCONH <sub>2</sub>	H	F	H	F	H
60	XVII- 455	H	H	H	NHCONHMe	H	F	H	F	H
	XVII- 456	H	H	H	NHCONMe <sub>2</sub>	H	F	H	F	H
65	XVII-	H	H	H	fenil	H	F	H	F	H

ES 2 353 159 T3

	457				o					
5	XVII- 458	H	H	H	2- cloro fenil o	H	F	H	F	H
10	XVII- 459	H	H	H	4- nitro fenil o	H	F	H	F	H
15	XVII- 460	H	H	H	2- pirid ilo	H	F	H	F	H
20	XVII- 461	H	H	H	3- pirid ilo	H	F	H	F	H
25	XVII- 462	H	H	H	4- pirid ilo	H	F	H	F	H
30	XVII- 463	H	H	H	2- fural o	H	F	H	F	H
35	XVII- 464	H	H	H	PhO	H	F	H	F	H
40	XVII- 465	H	Me	H	Me	H	F	H	F	H
45	XVII- 466	H	Me	F	Me	H	F	H	F	H
50	XVII- 467	H	Me	H	F	H	F	H	F	H
55	XVII- 468	H	Me	F	H	H	F	H	F	H
60	XVII- 469	H	Me	Me	H	H	F	H	F	H
65	XVII- 470	H	F	H	Me	H	F	H	F	H
	XVII- 471	H	F	H	F	H	F	H	F	H
	XVII- 472	H	H	H	H	H	Me	H	H	H
	XVII-	H	H	H	H	H	Et	H	H	H

ES 2 353 159 T3

	473									
5	XVII- 474	H	H	H	H	H	vinil o	H	H	H
	XVII- 475	H	H	H	H	H	alilo	H	H	H
10	XVII- 476	H	H	H	H	H	ciclo pro pilo	H	H	H
15	XVII- 477	H	H	H	H	H	F	H	H	H
20	XVII- 478	H	H	H	H	H	Cl	H	H	H
	XVII- 479	H	H	H	H	H	NO <sub>2</sub>	H	H	H
25	XVII- 480	H	H	H	H	H	CN	H		H
30	XVII- 481	H	H	H	H	H	CONH <sub>2</sub>	H	H	H
	XVII- 482	H	H	H	H	H	CONHM e	H	H	H
35	XVII- 483	H	H	H	H	H	CONMe 2	H	H	H
40	XVII- 484	H	H	H	H	H	COMe	H	H	H
	XVII- 485	H	H	H	H	H	COOH	H	H	H
45	XVII- 486	H	H	H	H	H	COOMe	H	H	H
50	XVII- 487	H	H	H	H	H	CSOMe	H	H	H
	XVII- 488	H	H	H	H	H	CSNH <sub>2</sub>	H	H	H
55	XVII- 489	H	H	H	H	H	CSNMe 2	H	H	H
60	XVII- 490	H	H	H	H	H	CSNHM e	H	H	H
	XVII- 491	H	H	H	H	H	OMe	H	H	H
65	XVII- 492	H	H	H	H	H	OEt	H	H	H

## ES 2 353 159 T3

	XVII- 493	H	H	H	H	H	OCOMe	H	H	H
5	XVII- 494	H	H	H	H	H	OCOOM e	H	H	H
10	XVII- 495	H	H	H	H	H	OCONH Me	H	H	H
	XVII- 496	H	H	H	H	H	OCONM e <sub>2</sub>	H	H	H
15	XVII- 497	H	H	H	H	H	OCSMe	H	H	H
20	XVII- 498	H	H	H	H	H	OCSNM e <sub>2</sub>	H	H	H
	XVII- 499	H	H	H	H	H	SMe	H	H	H
25	XVII- 500	H	H	H	H	H	SEt	H	H	H
30	XVII- 501	H	H	H	H	H	SCOMe	H	H	H
	XVII- 502	H	H	H	H	H	SCSNM e <sub>2</sub>	H	H	H
35	XVII- 503	H	H	H	H	H	SCSNH Me	H	H	H
40	XVII- 504	H	H	H	H	H	NHMe	H	H	H
	XVII- 505	H	H	H	H	H	NH <sub>2</sub>	H	H	H
45	XVII- 506	H	H	H	H	H	NMe <sub>2</sub>	H	H	H
50	XVII- 507	H	H	H	H	H	NHCOM e	H	H	H
	XVII- 508	H	H	H	H	H	NHCON H <sub>2</sub>	H	H	H
55	XVII- 509	H	H	H	H	H	NHCON HMe	H	H	H
60	XVII- 510	H	H	H	H	H	NHCON Me <sub>2</sub>	H	H	H
	XVII- 511	H	H	H	H	H	fenil o	H	H	H
65	XVII- 512	H	H	H	H	H	2- cloro	H	H	H

ES 2 353 159 T3

						fenil o			
5	XVII- 513	H	H	H	H	4- nitro fenil o	H	H	H
10	XVII- 514	H	H	H	H	2- pirid ilo	H	H	H
15	XVII- 515	H	H	H	H	3- pirid ilo	H	H	H
20	XVII- 516	H	H	H	H	4- pirid ilo	H	H	H
25	XVII- 517	H	H	H	H	2- furi l o	H	H	H
30	XVII- 518	H	H	H	H	PhO	H	H	H
35	XVII- 519	H	H	H	H	H	H	Me	H
40	XVII- 520	H	H	H	H	H	H	Et	H
45	XVII- 521	H	H	H	H	H	H	vinil o	H
50	XVII- 522	H	H	H	H	H	H	alilo	H
55	XVII- 523	H	H	H	H	H	H	ciclo propi lo	H
60	XVII- 524	H	H	H	H	H	H	F	H
65	XVII- 525	H	H	H	H	H	H	Cl	H
	XVII- 526	H	H	H	H	H	H	NO <sub>2</sub>	H
	XVII- 527	H	H	H	H	H	H	CN	H
	XVII-	H	H	H	H	H	H	CONH <sub>2</sub>	H

ES 2 353 159 T3

	528								
5	XVII- 529	H	H	H	H	H	H	CONHM e	H
	XVII- 530	H	H	H	H	H	H	CONMe 2	H
10	XVII- 531	H	H	H	H	H	H	COMe	H
	XVII- 532	H	H	H	H	H	H	COOH	H
15	XVII- 533	H	H	H	H	H	H	COOMe	H
	XVII- 534	H	H	H	H	H	H	CSOMe	H
20	XVII- 535	H	H	H	H	H	H	CSNH <sub>2</sub>	H
	XVII- 536	H	H	H	H	H	H	CSNMe 2	H
25	XVII- 537	H	H	H	H	H	H	CSNHM e	H
	XVII- 538	H	H	H	H	H	H	OMe	H
30	XVII- 539	H	H	H	H	H	H	OEt	H
	XVII- 540	H	H	H	H	H	H	OCOMe	H
35	XVII- 541	H	H	H	H	H	H	OCOOM e	H
	XVII- 542	H	H	H	H	H	H	OCONH Me	H
40	XVII- 543	H	H	H	H	H	H	OCONM e <sub>2</sub>	H
	XVII- 544	H	H	H	H	H	H	OCSMe	H
45	XVII- 545	H	H	H	H	H	H	OCSNM e <sub>2</sub>	H
	XVII- 546	H	H	H	H	H	H	SMe	H
50	XVII- 547	H	H	H	H	H	H	SEt	H
	XVII-	H	H	H	H	H	H	SCOMe	H

ES 2 353 159 T3

	548								
5	XVII- 549	H	H	H	H	H	H	SCSNM e <sub>2</sub>	H
	XVII- 550	H	H	H	H	H	H	SCSNH Me	H
10	XVII- 551	H	H	H	H	H	H	NHMe	H
15	XVII- 552	H	H	H	H	H	H	NH <sub>2</sub>	H
	XVII- 553	H	H	H	H	H	H	NMe <sub>2</sub>	H
20	XVII- 554	H	H	H	H	H	H	NHCOM e	H
25	XVII- 555	H	H	H	H	H	H	NHCON H <sub>2</sub>	H
	XVII- 556	H	H	H	H	H	H	NHCON HMe	H
30	XVII- 557	H	H	H	H	H	H	NHCON Me <sub>2</sub>	H
35	XVII- 558	H	H	H	H	H	H	fenil o	H
40	XVII- 559	H	H	H	H	H	H	2- cloro fenil o	H
45	XVII- 560	H	H	H	H	H	H	4- nitro fenil o	H
50	XVII- 561	H	H	H	H	H	H	2- pirid ilo	H
55	XVII- 562	H	H	H	H	H	H	3- pirid ilo	H
60	XVII- 563	H	H	H	H	H	H	4- pirid ilo	H
65	XVII- 564	H	H	H	H	H	H	2- fural	H

ES 2 353 159 T3

								o	
5	XVII- 565	H	H	H	H	H	H	H	PhO
	XVII- 566	H	H	H	H	H	H	H	Me
10	XVII- 567	H	H	H	H	H	H	H	Et
15	XVII- 568	H	H	H	H	H	H	H	vinil o
	XVII- 569	H	H	H	H	H	H	H	alilo
20	XVII- 570	H	H	H	H	H	H	H	ciclo propi lo
25	XVII- 571	H	H	H	H	H	H	H	F
30	XVII- 572	H	H	H	H	H	H	H	Cl
	XVII- 573	H	H	H	H	H	H	H	NO <sub>2</sub>
35	XVII- 574	H	H	H	H	H	H	H	CN
40	XVII- 575	H	H	H	H	H	H	H	CONH <sub>2</sub>
	XVII- 576	H	H	H	H	H	H	H	CONHM e
45	XVII- 577	H	H	H	H	H	H	H	CONMe 2
50	XVII- 578	H	H	H	H	H	H	H	COMe
	XVII- 579	H	H	H	H	H	H	H	COOH
55	XVII- 580	H	H	H	H	H	H	H	COOMe
60	XVII- 581	H	H	H	H	H	H	H	CSOMe
	XVII- 582	H	H	H	H	H	H	H	CSNH <sub>2</sub>
65	XVII- 583	H	H	H	H	H	H	H	CSNMe 2

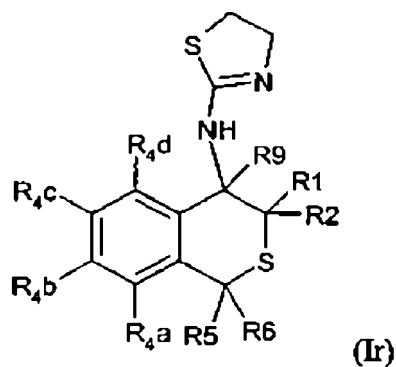
ES 2 353 159 T3

	XVII-	H	H	H	H	H	H	H	CSNHMe
5	XVII-	H	H	H	H	H	H	H	OMe
10	XVII-	H	H	H	H	H	H	H	OEt
	XVII-	H	H	H	H	H	H	H	OCOMe
15	XVII-	H	H	H	H	H	H	H	OCOOMe
20	XVII-	H	H	H	H	H	H	H	OCNHMe
	XVII-	H	H	H	H	H	H	H	OCNMe <sub>2</sub>
25	XVII-	H	H	H	H	H	H	H	OCSMe
30	XVII-	H	H	H	H	H	H	H	OCSNMe <sub>2</sub>
	XVII-	H	H	H	H	H	H	H	SMe
35	XVII-	H	H	H	H	H	H	H	SEt
40	XVII-	H	H	H	H	H	H	H	SCOMe
	XVII-	H	H	H	H	H	H	H	SCSNMe <sub>2</sub>
45	XVII-	H	H	H	H	H	H	H	SCSNHMe
	XVII-	H	H	H	H	H	H	H	NHMe
50	XVII-	H	H	H	H	H	H	H	NH <sub>2</sub>
55	XVII-	H	H	H	H	H	H	H	NMe <sub>2</sub>
	XVII-	H	H	H	H	H	H	H	NHCOMe
60	XVII-	H	H	H	H	H	H	H	NHCONH <sub>2</sub>
65	XVII-	H	H	H	H	H	H	H	NHCONHMe

ES 2 353 159 T3

5	XVII-604	H	H	H	H	H	H	H	NHCON Me <sub>2</sub>
	XVII-605	H	H	H	H	H	H	H	fenil o
10	XVII-606	H	H	H	H	H	H	H	2- cloro fenil o
15	XVII-607	H	H	H	H	H	H	H	4- nitro fenil o
20	XVII-608	H	H	H	H	H	H	H	2- pirid ilo
25	XVII-609	H	H	H	H	H	H	H	3- pirid ilo
30	XVII-610	H	H	H	H	H	H	H	4- pirid ilo
35	XVII-611	H	H	H	H	H	H	H	2- furil o
40	XVII-612	H	H	H	H	H	H	H	PhO
45									

La tabla XVIII estipula 612 compuestos de fórmula Ir



donde los valores de R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>4a</sup>, R<sup>4b</sup>, R<sup>4c</sup>, R<sup>4d</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> y R<sup>9</sup> se indican en la tabla 2.

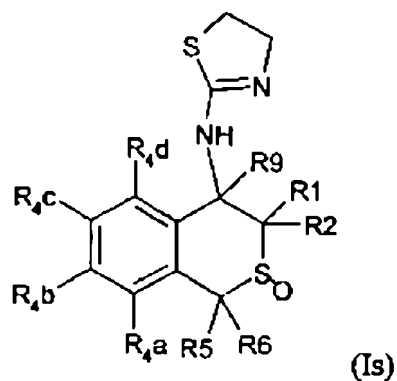
# ES 2 353 159 T3

La tabla XIX estipula 612 compuestos de fórmula Is

5

10

15



donde los valores de  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^{4a}$ ,  $R^{4b}$ ,  $R^{4c}$ ,  $R^{4d}$ ,  $R^5$ ,  $R^6$  y  $R^9$  se indican en la tabla 2.

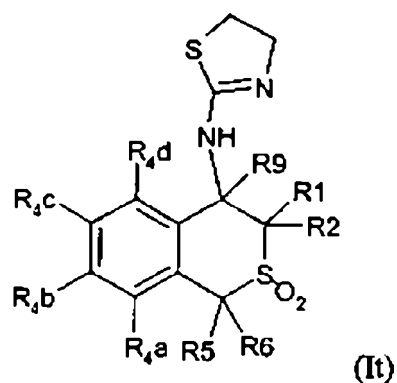
20

La tabla XX estipula 612 compuestos de fórmula It

25

30

35



donde los valores de  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^{4a}$ ,  $R^{4b}$ ,  $R^{4c}$ ,  $R^{4d}$ ,  $R^5$ ,  $R^6$  y  $R^9$  se indican en la tabla 2.

40

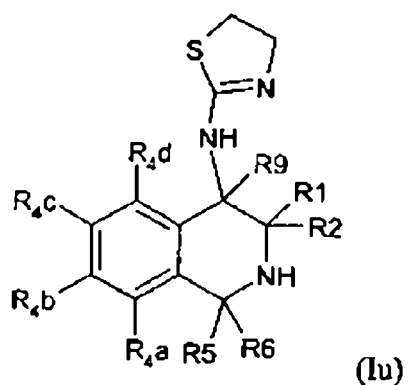
La tabla XXI estipula 612 compuestos de fórmula Iu

45

50

55

60

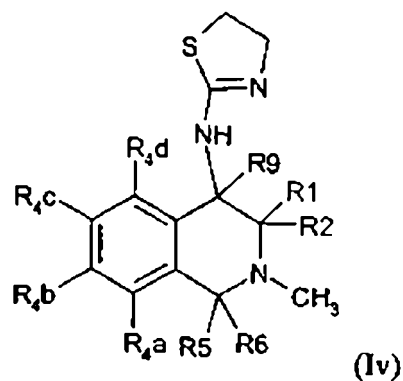


donde los valores de  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^{4a}$ ,  $R^{4b}$ ,  $R^{4c}$ ,  $R^{4d}$ ,  $R^5$ ,  $R^6$  y  $R^9$  se indican en la tabla 2.

65

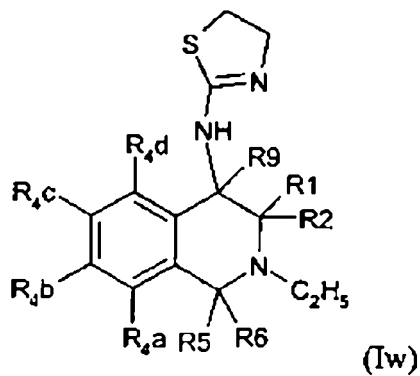
## ES 2 353 159 T3

La tabla XXII estipula 612 compuestos de fórmula Iv



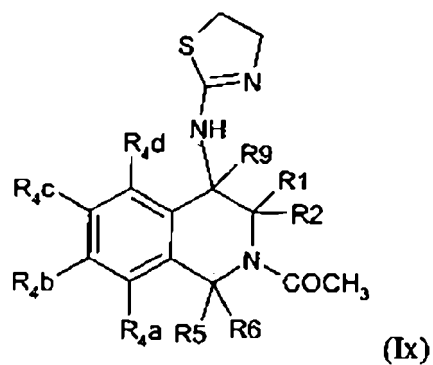
donde los valores de  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^{4a}$ ,  $R^{4b}$ ,  $R^{4c}$ ,  $R^{4d}$ ,  $R^5$ ,  $R^6$  y  $R^9$  se indican en la tabla 2.

La tabla XXIII presenta 612 compuestos de fórmula Iw



donde los valores de  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^{4a}$ ,  $R^{4b}$ ,  $R^{4c}$ ,  $R^{4d}$ ,  $R^5$ ,  $R^6$  y  $R^9$  se indican en la tabla 2.

La tabla XXIV estipula 612 compuestos de fórmula Ix

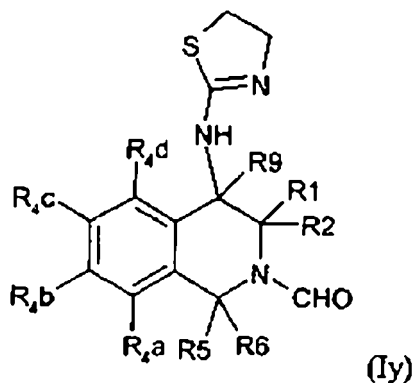


donde los valores de  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^{4a}$ ,  $R^{4b}$ ,  $R^{4c}$ ,  $R^{4d}$ ,  $R^5$ ,  $R^6$  y  $R^9$  se indican en la tabla 2.

65

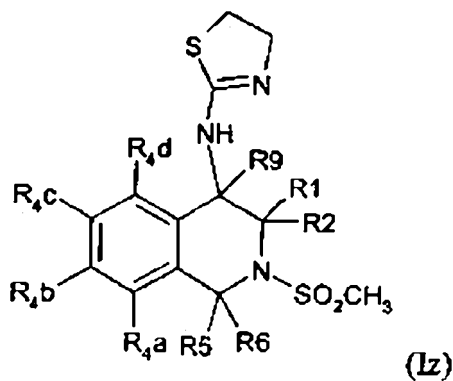
ES 2 353 159 T3

La tabla XXV estipula 612 compuestos de fórmula Iy



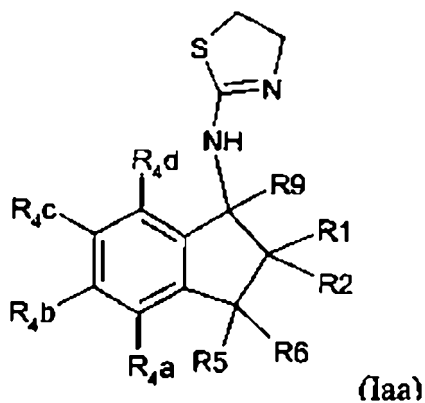
20 donde los valores de  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^{4a}$ ,  $R^{4b}$ ,  $R^{4c}$ ,  $R^{4d}$ ,  $R^5$ ,  $R^6$  y  $R^9$  se indican en la tabla 2.

La tabla XXVI estipula 612 compuestos de fórmula Iz



40 donde los valores de  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^{4a}$ ,  $R^{4b}$ ,  $R^{4c}$ ,  $R^{4d}$ ,  $R^5$ ,  $R^6$  y  $R^9$  se indican en la tabla 2.

La tabla XXVII estipula 612 compuestos de fórmula Iaa



65 donde los valores de  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^{4a}$ ,  $R^{4b}$ ,  $R^{4c}$ ,  $R^{4d}$ ,  $R^5$ ,  $R^6$  y  $R^9$  se indican en la tabla 3.

# ES 2 353 159 T3

## TABLA 3

5	Compu	R9	R1	R2	R5	R6	R4a	R4b	R4c	R4d
10	esto N°									
15	XXVII -1	Me	H	H	H	H	H	H	H	H
20	XXVII -2	Et	H	H	H	H	H	H	H	H
25	XXVII -3	vinil o	H	H	H	H	H	H	H	H
30	XXVII -4	alilo	H	H	H	H	H	H	H	H
35	XXVII -5	ciclo propi lo	H	H	H	H	H	H	H	H
40	XXVII -6	CN	H	H	H	H	H	H	H	H
45	XXVII -7	CONH <sub>2</sub>	H	H	H	H	H	H	H	H
50	XXVII -8	CONHM e	H	H	H	H	H	H	H	H
55	XXVII -9	CONMe 2	H	H	H	H	H	H	H	H
60	XXVII -10	COMe	H	H	H	H	H	H	H	H
65	XXVII -11	COOH	H	H	H	H	H	H	H	H
70	XXVII -12	COOMe	H	H	H	H	H	H	H	H
75	XXVII -13	CSNHM e	H	H	H	H	H	H	H	H
80	XXVII -14	H	Me	H	H	H	H	H	H	H
85	XXVII -15	H	Et	H	H	H	H	H	H	H

65

ES 2 353 159 T3

	XXVII	H	vinil	H	H	H	H	H	H	H
5	-16		o							
	XXVII	H	alilo	H	H	H	H	H	H	H
	-17									
10	XXVII	H	ciclo	H	H	H	H	H	H	H
	-18		propi							
			lo							
15	XXVII	H	F	H	H	H	H	H	H	H
	-19									
20	XXVII	H	Cl	H	H	H	H	H	H	H
	-20									
25	XXVII	H	NO	H	H	H	H	H	H	H
	-21									
30	XXVII	H	CN	H	H	H	H	H	H	H
	-22									
35	XXVII	H	CONH	H	H	H	H	H	H	H
	-23									
40	XXVII	H	CONHM	H	H	H	H	H	H	H
	-24		e							
45	XXVII	H	CONMe	H	H	H	H	H	H	H
	-25									
50	XXVII	H	COMe	H	H	H	H	H	H	H
	-26									
55	XXVII	H	COOH	H	H	H	H	H	H	H
	-27									
60	XXVII	H	COOMe	H	H	H	H	H	H	H
	-28									
65	XXVII	H	CSOMe	H	H	H	H	H	H	H
	-29									
	XXVII	H	CSNH	H	H	H	H	H	H	H
	-30									
	XXVII	H	CSNMe	H	H	H	H	H	H	H
	-31									
	XXVII	H	CSNHM	H	H	H	H	H	H	H
	-32		e							
	XXVII	H	OMe	H	H	H	H	H	H	H
	-33									
	XXVII	H	OEt	H	H	H	H	H	H	H
	-34									
	XXVII	H	OCOMe	H	H	H	H	H	H	H

ES 2 353 159 T3

	-35								
5	XXVII -36	H e	OCOOM	H	H	H	H	H	H
	XXVII -37	H	OCONH Me	H	H	H	H	H	H
10	XXVII -38	H	OCONM e <sub>2</sub>	H	H	H	H	H	H
15	XXVII -39	H	OCSMe	H	H	H	H	H	H
	XXVII -40	H	OCSNM e <sub>2</sub>	H	H	H	H	H	H
20	XXVII -41	H	SMe	H	H	H	H	H	H
25	XXVII -42	H	SEt	H	H	H	H	H	H
	XXVII -43	H	SCOMe	H	H	H	H	H	H
30	XXVII -44	H	SCSNM e <sub>2</sub>	H	H	H	H	H	H
35	XXVII -45	H	SCSNH Me	H	H	H	H	H	H
	XXVII -46	H	NHMe	H	H	H	H	H	H
40	XXVII -47	H	NH <sub>2</sub>	H	H	H	H	H	H
45	XXVII -48	H	NMe <sub>2</sub>	H	H	H	H	H	H
	XXVII -49	H	NHCOM e	H	H	H	H	H	H
50	XXVII -50	H	NHCON H <sub>2</sub>	H	H	H	H	H	H
55	XXVII -51	H	NHCON HMe	H	H	H	H	H	H
	XXVII -52	H	NHCON Me <sub>2</sub>	H	H	H	H	H	H
60	XXVII -53	H	fenil o	H	H	H	H	H	H
65	XXVII -54	H	2- cloro fenil	H	H	H	H	H	H

ES 2 353 159 T3

		o							
5	XXVII -55	H	4- nitro fenil o	H	H	H	H	H	H
10	XXVII -56	H	2- pirid ilo	H	H	H	H	H	H
15	XXVII -57	H	3- pirid ilo	H	H	H	H	H	H
20	XXVII -58	H	4- pirid ilo	H	H	H	H	H	H
25	XXVII -59	H	2- furil o	H	H	H	H	H	H
30	XXVII -60	H	PhO	H	H	H	H	H	H
35	XXVII -61	CH <sub>2</sub>		H	H	H	H	H	H
40	XXVII -62	H	=O	H	H	H	H	H	H
45	XXVII -63	H	=NOH	H	H	H	H	H	H
50	XXVII -64	H	=NOMe	H	H	H	H	H	H
55	XXVII -65	H	=CH <sub>2</sub>	H	H	H	H	H	H
60	XXVII -66	H	=CHMe	H	H	H	H	H	H
65	XXVII -67	H	H	H	H	H	H	H	H
	XXVII -68	H	H	H	Me	H	H	H	H
	XXVII -69	H	H	H	Et	H	H	H	H
	XXVII -70	H	H	H	vinil o	H	H	H	H
	XXVII	H	H	H	alilo	H	H	H	H

ES 2 353 159 T3

	-71								
5	XXVII -72	H	H	H	ciclo propi lo	H	H	H	H
10	XXVII -73	H	H	H	F	H	H	H	H
15	XXVII -74	H	H	H	Cl	H	H	H	H
20	XXVII -75	H	H	H	NO <sub>2</sub>	H	H	H	H
25	XXVII -76	H	H	H	CN	H	H	H	H
30	XXVII -77	H	H	H	CONH <sub>2</sub>	H	H	H	H
35	XXVII -78	H	H	H	CONHM e	H	H	H	H
40	XXVII -79	H	H	H	CONMe 2	H	H	H	H
45	XXVII -80	H	H	H	COMe	H	H	H	H
50	XXVII -81	H	H	H	COOH	H	H	H	H
55	XXVII -82	H	H	H	COOMe	H	H	H	H
60	XXVII -83	H	H	H	CSOMe	H	H	H	H
65	XXVII -84	H	H	H	CSNH <sub>2</sub>	H	H	H	H
	XXVII -85	H	H	H	CSNMe 2	H	H	H	H
	XXVII -86	H	H	H	CSNHM e	H	H	H	H
	XXVII -87	H	H	H	OMe	H	H	H	H
	XXVII -88	H	H	H	OEt	H	H	H	H
	XXVII -89	H	H	H	OCOMe	H	H	H	H
	XXVII -90	H	H	H	OCOOM e	H	H	H	H

## ES 2 353 159 T3

	XXVII -91	H	H	H	OCONH Me	H	H	H	H	H
5	XXVII -92	H	H	H	OCONM e <sub>2</sub>	H	H	H	H	H
10	XXVII -93	H	H	H	OCSMe	H	H	H	H	H
	XXVII -94	H	H	H	OCSNM e <sub>2</sub>	H	H	H	H	H
15	XXVII -95	H	H	H	SMe	H	H	H	H	H
20	XXVII -96	H	H	H	SEt	H	H	H	H	H
	XXVII -97	H	H	H	SCOMe	H	H	H	H	H
25	XXVII -98	H	H	H	SCSNM e <sub>2</sub>	H	H	H	H	H
30	XXVII -99	H	H	H	SCSNH Me	H	H	H	H	H
	XXVII -100	H	H	H	NHMe	H	H	H	H	H
35	XXVII -101	H	H	H	NH <sub>2</sub>	H	H	H	H	H
40	XXVII -102	H	H	H	NMe <sub>2</sub>	H	H	H	H	H
	XXVII -103	H	H	H	NHCOM e	H	H	H	H	H
45	XXVII -104	H	H	H	NHCON H <sub>2</sub>	H	H	H	H	H
50	XXVII -105	H	H	H	NHCON HMe	H	H	H	H	H
	XXVII -106	H	H	H	NHCON Me <sub>2</sub>	H	H	H	H	H
55	XXVII -107	H	H	H	fenil o	H	H	H	H	H
60	XXVII -108	H	H	H	2- cloro fenil o	H	H	H	H	H
65	XXVII -109	H	H	H	4- nitro	H	H	H	H	H

ES 2 353 159 T3

				fenil o					
5	XXVII -110	H	H	H	2- pirid ilo	H	H	H	H
10	XXVII -111	H	H	H	3- pirid ilo	H	H	H	H
15	XXVII -112	H	H	H	4- pirid ilo	H	H	H	H
20	XXVII -113	H	H	H	2- furil o	H	H	H	H
25	XXVII -114	H	H	H	PhO	H	H	H	H
30	XXVII -115	H	H	H	=O	H	H	H	H
35	XXVII -116	H	H	H	=NOH	H	H	H	H
40	XXVII -117	H	H	H	=NOMe	H	H	H	H
45	XXVII -118	H	H	H	=CH <sub>2</sub>	H	H	H	H
50	XXVII -119	H	H	H	=CHMe	H	H	H	H
55	XXVII -120	H	Me	H	Me	H	H	H	H
60	XXVII -121	H	Me	F	Me	H	H	H	H
65	XXVII -122	H	Me	H	F	H	H	H	H
	XXVII -123	H	Me	F	H	H	H	H	H
	XXVII -124	H	Me	Me	H	H	H	H	H
	XXVII -125	H	F	H	Me	H	H	H	H
	XXVII -126	H	F	H	F	H	H	H	H

ES 2 353 159 T3

5	XXVII -127	Me	H	H	H	H	F	H	H	H
	XXVII -128	Et	H	H	H	H	F	H	H	H
10	XXVII -129	vinil o	H	H	H	H	F	H	H	H
	XXVII -130	alilo	H	H	H	H	F	H	H	H
15	XXVII -131	ciclo propi lo	H	H	H	H	F	H	H	H
20	XXVII -132	CN	H	H	H	H	F	H	H	H
25	XXVII -133	CONH <sub>2</sub>	H	H	H	H	F	H	H	H
	XXVII -134	CONHM e	H	H	H	H	F	H	H	H
30	XXVII -135	CONMe 2	H	H	H	H	F	H	H	H
35	XXVII -136	COMe	H	H	H	H	F	H	H	H
	XXVII -137	COOH	H	H	H	H	F	H	H	H
40	XXVII -138	COOMe	H	H	H	H	F	H	H	H
45	XXVII -139	CSNHM e	H	H	H	H	F	H	H	H
	XXVII -140	H	Me	H	H	H	F	H	H	H
50	XXVII -141	H	Et	H	H	H	F	H	H	H
55	XXVII -142	H	vinil o	H	H	H	F	H	H	H
	XXVII -143	H	alilo	H	H	H	F	H	H	H
60	XXVII -144	H	ciclo propi lo	H	H	H	F	H	H	H
65	XXVII -145	H	F	H	H	H	F	H	H	H

## ES 2 353 159 T3

	XXVII -146	H	Cl	H	H	H	F	H	H	H
5	XXVII -147	H	NO <sub>2</sub>	H	H	H	F	H	H	H
10	XXVII -148	H	CN	H	H	H	F	H	H	H
	XXVII -149	H	CONH <sub>2</sub>	H	H	H	F	H	H	H
15	XXVII -150	H	CONHM e	H	H	H	F	H	H	H
20	XXVII -151	H	CONMe 2	H	H	H	F	H	H	H
	XXVII -152	H	COMe	H	H	H	F	H	H	H
25	XXVII -153	H	COOH	H	H	H	F	H	H	H
30	XXVII -154	H	COOMe	H	H	H	F	H	H	H
	XXVII -155	H	CSOMe	H	H	H	F	H	H	H
35	XXVII -156	H	CSNH <sub>2</sub>	H	H	H	F	H	H	H
40	XXVII -157	H	CSNMe 2	H	H	H	F	H	H	H
	XXVII -158	H	CSNHM e	H	H	H	F	H	H	H
45	XXVII -159	H	OMe	H	H	H	F	H	H	H
50	XXVII -160	H	OEt	H	H	H	F	H	H	H
	XXVII -161	H	OCOMe	H	H	H	F	H	H	H
55	XXVII -162	H	OCOOM e	H	H	H	F	H	H	H
60	XXVII -163	H	OCONH Me	H	H	H	F	H	H	H
	XXVII -164	H	OCONM e <sub>2</sub>	H	H	H	F	H	H	H
65	XXVII -165	H	OCSMe	H	H	H	F	H	H	H

ES 2 353 159 T3

5	XXVII -166	H	OCSNM e <sub>2</sub>	H	H	H	F	H	H	H
	XXVII -167	H	SMe	H	H	H	F	H	H	H
10	XXVII -168	H	SEt	H	H	H	F	H	H	H
	XXVII -169	H	SCOMe	H	H	H	F	H	H	H
15	XXVII -170	H	SCSNM e <sub>2</sub>	H	H	H	F	H	H	H
	XXVII -171	H	SCSNH Me	H	H	H	F	H	H	H
20	XXVII -172	H	NHMe	H	H	H	F	H	H	H
	XXVII -173	H	NH <sub>2</sub>	H	H	H	F	H	H	H
25	XXVII -174	H	NMe <sub>2</sub>	H	H	H	F	H	H	H
30	XXVII -175	H	NHCOM e	H	H	H	F	H	H	H
35	XXVII -176	H	NHCON H <sub>2</sub>	H	H	H	F	H	H	H
	XXVII -177	H	NHCON HMe	H	H	H	F	H	H	H
40	XXVII -178	H	NHCON Me <sub>2</sub>	H	H	H	F	H	H	H
45	XXVII -179	H	fenil o	H	H	H	F	H	H	H
50	XXVII -180	H	2- cloro fenil o	H	H	H	F	H	H	H
55	XXVII -181	H	4- nitro fenil o	H	H	H	F	H	H	H
60	XXVII -182	H	2- pirid ilo	H	H	H	F	H	H	H
65	XXVII	H	3-	H	H	H	F	H	H	H

ES 2 353 159 T3

	-183		pirid ilo						
5	XXVII -184	H	4- pirid ilo	H	H	H	F	H	H
10	XXVII -185	H	2- furil o	H	H	H	F	H	H
15	XXVII -186	H	PhO	H	H	H	F	H	H
20	XXVII -187	CH <sub>2</sub>		H	H	H	F		H
	XXVII -188	H	H	H	Me	H	F	H	H
25	XXVII -189	H	H	H	Et	H	F	H	H
30	XXVII -190	H	H	H	vinil o	H	F	H	H
	XXVII -191	H	H	H	alilo	H	F	H	H
35	XXVII -192	H	H	H	ciclo propi lo	H	F	H	H
40	XXVII -193	H	H	H	F	H	F	H	H
45	XXVII -194	H	H	H	Cl	H	F	H	H
	XXVII -195	H	H	H	NO <sub>2</sub>	H	F	H	H
50	XXVII -196	H	H	H	CN	H	F	H	H
55	XXVII -197	H	H	H	CONH <sub>2</sub>	H	F	H	H
	XXVII -198	H	H	H	CONHM e	H	F	H	H
60	XXVII -199	H	H	H	CONMe z	H	F	H	H
	XXVII -200	H	H	H	COMe	H	F	H	H
65	XXVII	H	H	H	COOH	H	F	H	H

## ES 2 353 159 T3

	-201								
5	XXVII -202	H	H	H	COOMe	H	F	H	H
	XXVII -203	H	H	H	CSOMe	H	F	H	H
10	XXVII -204	H	H	H	CSNH <sub>2</sub>	H	F	H	H
15	XXVII -205	H	H	H	CSNMe <sub>2</sub>	H	F	H	H
	XXVII -206	H	H	H	CSNHMe	H	F	H	H
20	XXVII -207	H	H	H	OMe	H	F	H	H
25	XXVII -208	H	H	H	OEt	H	F	H	H
	XXVII -209	H	H	H	OCOMe	H	F	H	H
30	XXVII -210	H	H	H	OCOOMe	H	F	H	H
35	XXVII -211	H	H	H	OCONHMe	H	F	H	H
	XXVII -212	H	H	H	OCONMe <sub>2</sub>	H	F	H	H
40	XXVII -213	H	H	H	OCSMe	H	F	H	H
45	XXVII -214	H	H	H	OCSNMe <sub>2</sub>	H	F	H	H
	XXVII -215	H	H	H	SMe	H	F	H	H
50	XXVII -216	H	H	H	SEt	H	F	H	H
55	XXVII -217	H	H	H	SCOMe	H	F	H	H
	XXVII -218	H	H	H	SCSNMe <sub>2</sub>	H	F	H	H
60	XXVII -219	H	H	H	SCSNHMe	H	F	H	H
	XXVII -220	H	H	H	NHMe	H	F	H	H
65	XXVII	H	H	H	NH <sub>2</sub>	H	F	H	H

ES 2 353 159 T3

	-221								
5	XXVII -222	H	H	H	NMe <sub>2</sub>	H	F	H	H
	XXVII -223	H	H	H	NHCOM e	H	F	H	H
10	XXVII -224	H	H	H	NHCON H <sub>2</sub>	H	F	H	H
15	XXVII -225	H	H	H	NHCON HMe	H	F	H	H
	XXVII -226	H	H	H	NHCON Me <sub>2</sub>	H	F	H	H
20	XXVII -227	H	H	H	fenil o	H	F	H	H
25	XXVII -228	H	H	H	2- cloro fenil o	H	F	H	H
30	XXVII -229	H	H	H	4- nitro fenil o	H	F	H	H
35	XXVII -230	H	H	H	2- pirid ilo	H	F	H	H
40	XXVII -231	H	H	H	3- pirid ilo	H	F	H	H
45	XXVII -232	H	H	H	4- pirid ilo	H	F	H	H
50	XXVII -233	H	H	H	2- fural o	H	F	H	H
55	XXVII -234	H	H	H	PhO	H	F	H	H
60	XXVII -235	H	Me	H	Me	H	F	H	H
	XXVII -236	H	Me	F	Me	H	F	H	H
65	XXVII	H	Me	H	F	H	F	H	H

ES 2 353 159 T3

	-237								
5	XXVII -238	H	Me	F	H	H	F	H	H
	XXVII -239	H	Me	Me	H	H	F	H	H
10	XXVII -240	H	F	H	Me	H	F	H	H
15	XXVII -241	H	F	H	F	H	F	H	H
	XXVII -242	Me	H	H	H	H	Me	H	H
20	XXVII -243	Et	H	H	H	H	Me	H	H
25	XXVII -244	vinil o	H	H	H	H	Me	H	H
	XXVII -245	alilo	H	H	H	H	Me	H	H
30	XXVII -246	ciclo propi lo	H	H	H	H	Me	H	H
35	XXVII -247	CN	H	H	H	H	Me	H	H
40	XXVII -248	CONH <sub>2</sub>	H	H	H	H	Me	H	H
	XXVII -249	CONHM e	H	H	H	H	Me	H	H
45	XXVII -250	CONMe 2	H	H	H	H	Me	H	H
50	XXVII -251	COMe	H	H	H	H	Me	H	H
	XXVII -252	COOH	H	H	H	H	Me	H	H
55	XXVII -253	COOMe	H	H	H	H	Me	H	H
60	XXVII -254	CSNHM e	H	H	H	H	Me	H	H
	XXVII -255	H	Me	H	H	H	Me	H	H
65	XXVII -256	H	Et	H	H	H	Me	H	H

ES 2 353 159 T3

	XXVII -257	H	vinil o	H	H	H	Me	H	H	H
5	XXVII -258	H	alilo	H	H	H	Me	H	H	H
10	XXVII -259	H	ciclo propi lo	H	H	H	Me	H	H	H
15	XXVII -260	H	F	H	H	H	Me	H	H	H
	XXVII -261	H	Cl	H	H	H	Me	H	H	H
20	XXVII -262	H	NO <sub>2</sub>	H	H	H	Me	H	H	H
25	XXVII -263	H	CN	H	H	H	Me	H	H	H
	XXVII -264	H	CONH <sub>2</sub>	H	H	H	Me	H	H	H
30	XXVII -265	H	CONHM e	H	H	H	Me	H	H	H
35	XXVII -266	H	CONMe 2	H	H	H	Me	H	H	H
	XXVII -267	H	COMe	H	H	H	Me	H	H	H
40	XXVII -268	H	COOH	H	H	H	Me	H	H	H
45	XXVII -269	H	COOMe	H	H	H	Me	H	H	H
	XXVII -270	H	CSOMe	H	H	H	Me	H	H	H
50	XXVII -271	H	CSNH <sub>2</sub>	H	H	H	Me	H	H	H
55	XXVII -272	H	CSNMe 2	H	H	H	Me	H	H	H
	XXVII -273	H	CSNHM e	H	H	H	Me	H	H	H
60	XXVII -274	H	OMe	H	H	H	Me	H	H	H
65	XXVII -275	H	OEt	H	H	H	Me	H	H	H
	XXVII	H	OCOMe	H	H	H	Me	H	H	H

ES 2 353 159 T3

		-276							
5	XXVII	H	OCOOM	H	H	H	Me	H	H
		-277	e						
	XXVII	H	OCONH	H	H	H	Me	H	H
10		-278	Me						
	XXVII	H	OCONM	H	H	H	Me	H	H
		-279	e <sub>2</sub>						
15	XXVII	H	OCSMe	H	H	H	Me	H	H
		-280							
	XXVII	H	OCSNM	H	H	H	Me	H	H
20		-281	e <sub>2</sub>						
	XXVII	H	SMe	H	H	H	Me	H	H
		-282							
25	XXVII	H	SEt	H	H	H	Me	H	H
		-283							
	XXVII	H	SCOMe	H	H	H	Me	H	H
		-284							
30	XXVII	H	SCSNM	H	H	H	Me	H	H
		-285	e <sub>2</sub>						
35	XXVII	H	SCSNH	H	H	H	Me	H	H
		-286	Me						
	XXVII	H	NHMe	H	H	H	Me	H	H
40		-287							
	XXVII	H	NH <sub>2</sub>	H	H	H	Me	H	H
		-288							
45	XXVII	H	NMe <sub>2</sub>	H	H	H	Me	H	H
		-289							
	XXVII	H	NHCOM	H	H	H	Me	H	H
50		-290	e						
	XXVII	H	NHCON	H	H	H	Me	H	H
		-291	H <sub>2</sub>						
55	XXVII	H	NHCON	H	H	H	Me	H	H
		-292	HMe						
	XXVII	H	NHCON	H	H	H	Me	H	H
60		-293	Me <sub>2</sub>						
	XXVII	H	fenil	H	H	H	Me	H	H
		-294	o						
65	XXVII	H	2-	H	H	H	Me	H	H
		-295	cloro						
			fenil						

ES 2 353 159 T3

		o								
5	XXVII -296	H	4- nitro fenil o	H	H	H	Me	H	H	H
10	XXVII -297	H	2- pirid ilo	H	H	H	Me	H	H	H
15	XXVII -298	H	3- pirid ilo	H	H	H	Me	H	H	H
20	XXVII -299	H	4- pirid ilo	H	H	H	Me	H	H	H
25	XXVII -300	H	2- furil o	H	H	H	Me	H	H	H
30	XXVII -301	H	PhO	H	H	H	Me	H	H	H
35	XXVII -302	CH <sub>2</sub>		H	H	H	Me	H	H	H
	XXVII -303	H	H	H	Me	H	Me	H	H	H
40	XXVII -304	H	H	H	Et	H	Me	H	H	H
45	XXVII -305	H	H	H	vinil o	H	Me	H	H	H
	XXVII -306	H	H	H	alilo	H	Me	H	H	H
50	XXVII -307	H	H	H	ciclo propi lo	H	Me	H	H	H
55	XXVII -308	H	H	H	F	H	Me	H	H	H
60	XXVII -309	H	H	H	Cl	H	Me	H	H	H
	XXVII -310	H	H	H	NO <sub>2</sub>	H	Me	H	H	H
65	XXVII -311	H	H	H	CN	H	Me	H	H	H

ES 2 353 159 T3

	XXVII -312	H	H	H	CONH <sub>2</sub>	H	Me	H	H	H
5	XXVII -313	H	H	H	CONHM e	H	Me	H	H	H
10	XXVII -314	H	H	H	CONMe 2	H	Me	H	H	H
	XXVII -315	H	H	H	COMe	H	Me	H	H	H
15	XXVII -316	H	H	H	COOH	H	Me	H	H	H
	XXVII -317	H	H	H	COOMe	H	Me	H	H	H
20	XXVII -318	H	H	H	CSOMe	H	Me	H	H	H
25	XXVII -319	H	H	H	CSNH <sub>2</sub>	H	Me	H	H	H
30	XXVII -320	H	H	H	CSNMe 2	H	Me	H	H	H
	XXVII -321	H	H	H	CSNHM e	H	Me	H	H	H
35	XXVII -322	H	H	H	OMe	H	Me	H	H	H
40	XXVII -323	H	H	H	OEt	H	Me	H	H	H
	XXVII -324	H	H	H	OCOMe	H	Me	H	H	H
45	XXVII -325	H	H	H	OCOOM e	H	Me	H	H	H
50	XXVII -326	H	H	H	OCONH Me	H	Me	H	H	H
	XXVII -327	H	H	H	OCONM e <sub>2</sub>	H	Me	H	H	H
55	XXVII -328	H	H	H	OCSMe	H	Me	H	H	H
60	XXVII -329	H	H	H	OCSNM e <sub>2</sub>	H	Me	H	H	H
	XXVII -330	H	H	H	SMe	H	Me	H	H	H
65	XXVII -331	H	H	H	SEt	H	Me	H	H	H

ES 2 353 159 T3

	XXVII -332	H	H	H	SCOMe	H	Me	H	H	H
5	XXVII -333	H	H	H	SCSNM e <sub>2</sub>	H	Me	H	H	H
10	XXVII -334	H	H	H	SCSNH Me	H	Me	H	H	H
	XXVII -335	H	H	H	NHMe	H	Me	H	H	H
15	XXVII -336	H	H	H	NH <sub>2</sub>	H	Me	H	H	H
20	XXVII -337	H	H	H	NMe <sub>2</sub>	H	Me	H	H	H
	XXVII -338	H	H	H	NHCOM e	H	Me	H	H	H
25	XXVII -339	H	H	H	NHCON H <sub>2</sub>	H	Me	H	H	H
30	XXVII -340	H	H	H	NHCON HMe	H	Me	H	H	H
	XXVII -341	H	H	H	NHCON Me <sub>2</sub>	H	Me	H	H	H
35	XXVII -342	H	H	H	fenil o	H	Me	H	H	H
40	XXVII -343	H	H	H	2- cloro fenil o	H	Me	H	H	H
45	XXVII -344	H	H	H	4- nitro fenil o	H	Me	H	H	H
50	XXVII -345	H	H	H	2- pirid ilo	H	Me	H	H	H
55	XXVII -346	H	H	H	3- pirid ilo	H	Me	H	H	H
60	XXVII -347	H	H	H	4- pirid ilo	H	Me	H	H	H
65	XXVII	H	H	H	2-	H	Me	H	H	H

ES 2 353 159 T3

	-348				furil o				
5	XXVII -349	H	H	H	PhO	H	Me	H	H
10	XXVII -350	H	Me	H	Me	H	Me	H	H
	XXVII -351	H	Me	F	Me	H	Me	H	H
15	XXVII -352	H	Me	H	F	H	Me	H	H
20	XXVII -353	H	Me	F	H	H	Me	H	H
	XXVII -354	H	Me	Me	H	H	Me	H	H
25	XXVII -355	H	F	H	Me	H	Me	H	H
30	XXVII -356	H	F	H	F	H	Me	H	H
	XXVII -357	Me	H	H	H	H	F	H	F
35	XXVII -358	Et	H	H	H	H	F	H	F
40	XXVII -359	vinil o	H	H	H	H	F	H	F
	XXVII -360	alilo	H	H	H	H	F	H	F
45	XXVII -361	ciclo propi lo	H	H	H	H	F	H	F
50	XXVII -362	CN	H	H	H	H	F	H	F
55	XXVII -363	CONH <sub>2</sub>	H	H	H	H	F	H	F
	XXVII -364	CONHM e	H	H	H	H	F	H	F
60	XXVII -365	CONMe 2	H	H	H	H	F	H	F
65	XXVII -366	COMe	H	H	H	H	F	H	F
	XXVII	COOH	H	H	H	H	F	H	F

ES 2 353 159 T3

	-367									
5	XXVII -368	COOMe	H	H	H	H	F	H	F	H
	XXVII -369	CSNHMe	H	H	H	H	F	H	F	H
10	XXVII -370	H	Me	H	H	H	F	H	F	H
15	XXVII -371	H	Et	H	H	H	F	H	F	H
	XXVII -372	H	vinilo	H	H	H	F	H	F	H
20	XXVII -373	H	alilo	H	H	H	F	H	F	H
25	XXVII -374	H	ciclopropilo	H	H	H	F	H	F	H
30	XXVII -375	H	F	H	H	H	F	H	F	H
	XXVII -376	H	Cl	H	H	H	F	H	F	H
35	XXVII -377	H	NO <sub>2</sub>	H	H	H	F	H	F	H
	XXVII -378	H	CN	H	H	H	F	H	F	H
40	XXVII -379	H	CONH <sub>2</sub>	H	H	H	F	H	F	H
45	XXVII -380	H	CONHMe	H	H	H	F	H	F	H
50	XXVII -381	H	CONMe <sub>2</sub>	H	H	H	F	H	F	H
	XXVII -382	H	COMe	H	H	H	F	H	F	H
55	XXVII -383	H	COOH	H	H	H	F	H	F	H
	XXVII -384	H	COOMe	H	H	H	F	H	F	H
60	XXVII -385	H	CSOMe	H	H	H	F	H	F	H
65	XXVII -386	H	CSNH <sub>2</sub>	H	H	H	F	H	F	H

## ES 2 353 159 T3

	XXVII -387	H	CSNMe <sub>2</sub>	H	H	H	F	H	F	H
5	XXVII -388	H	CSNHMe	H	H	H	F	H	F	H
10	XXVII -389	H	OMe	H	H	H	F	H	F	H
	XXVII -390	H	OEt	H	H	H	F	H	F	H
15	XXVII -391	H	OCOMe	H	H	H	F	H	F	H
20	XXVII -392		OCOOMe	H	H	H	F	H	F	H
25	XXVII -393	H	OCONHMe	H	H	H	F	H	F	H
	XXVII -394	H	OCONMe <sub>2</sub>	H	H	H	F	H	F	H
30	XXVII -395	H	OCSMe	H	H	H	F	H	F	H
	XXVII -396	H	OCSNMe <sub>2</sub>	H	H	H	F	H	F	H
35	XXVII -397	H	SMe	H	H	H	F	H	F	H
40	XXVII -398	H	SEt	H	H	H	F	H	F	H
	XXVII -399	H	SCOMe	H	H	H	F	H	F	H
45	XXVII -400	H	SCSNMe <sub>2</sub>	H	H	H	F	H	F	H
50	XXVII -401	H	SCSNHMe	H	H	H	F	H	F	H
	XXVII -402	H	NHMe	H	H	H	F	H	F	H
55	XXVII -403	H	NH <sub>2</sub>	H	H	H	F	H	F	H
60	XXVII -404	H	NMe <sub>2</sub>	H	H	H	F	H	F	H
	XXVII -405	H	NHCOMe	H	H	H	F	H	F	H
65	XXVII -406	H	NHCONH <sub>2</sub>	H	H	H	F	H	F	H

ES 2 353 159 T3

	XXVII	H	NHCON	H	H	H	F	H	F	H
5	-407		HMe							
	XXVII	H	NHCON	H	H	H	F	H	F	H
	-408		Me <sub>2</sub>							
10	XXVII	H	fenil	H	H	H	F	H	F	H
	-409		o							
15	XXVII	H	2-	H	H	H	F	H	F	H
	-410		cloro fenil o							
20	XXVII	H	4-	H	H	H	F	H	F	H
	-411		nitro fenil o							
25	XXVII	H	2-	H	H	H	F	H	F	H
	-412		pirid ilo							
30	XXVII	H	3-	H	H	H	F	H	F	H
	-413		pirid ilo							
35	XXVII	H	4-	H	H	H	F	H	F	H
	-414		pirid ilo							
40	XXVII	H	2-	H	H	H	F	H	F	H
	-415		furil o							
45	XXVII	H	PhO	H	H	H	F	H	F	H
	-416									
50	XXVII	CH <sub>2</sub>		H	H	H	F	H	F	H
	-417									
	XXVII	H	H	H	Me	H	F	H	F	H
	-418									
55	XXVII	H	H	H	Et	H	F	H	F	H
	-419									
60	XXVII	H	H	H	vinil	H	F	H	F	H
	-420				o					
	XXVII	H	H	H	alilo	H	F	H	F	H
	-421									
65	XXVII	H	H	H	ciclo	H	F	H	F	H
	-422				propi					

## ES 2 353 159 T3

				lo						
5	XXVII -423	H	H	H	F	H	F	H	F	H
	XXVII -424	H	H	H	Cl	H	F	H	F	H
10	XXVII -425	H	H	H	NO <sub>2</sub>	H	F	H	F	H
	XXVII -426	H	H	H	CN	H	F	H	F	H
15	XXVII -427	H	H	H	CONH <sub>2</sub>	H	F	H	F	H
	XXVII -428	H	H	H	CONHM e	H	F	H	F	H
20	XXVII -429	H	H	H	CONMe 2	H	F	H	F	H
	XXVII -430	H	H	H	COMe	H	F	H	F	H
25	XXVII -431	H	H	H	COOH	H	F	H	F	H
	XXVII -432	H	H	H	COOMe	H	F	H	F	H
30	XXVII -433	H	H	H	CSOMe	H	F	H	F	H
	XXVII -434	H	H	H	CSNH <sub>2</sub>	H	F	H	F	H
35	XXVII -435	H	H	H	CSNMe 2	H	F	H	F	H
	XXVII -436	H	H	H	CSNHM e	H	F	H	F	H
40	XXVII -437	H	H	H	OMe	H	F	H	F	H
	XXVII -438	H	H	H	OEt	H	F	H	F	H
45	XXVII -439	H	H	H	OCOMe	H	F	H	F	H
	XXVII -440	H	H	H	OCOOM e	H	F	H	F	H
50	XXVII -441	H	H	H	OCONH Me	H	F	H	F	H
	XXVII	H	H	H	OCONM	H	F	H	F	H
55										
60										
65										

ES 2 353 159 T3

	-442			$e_2$						
5	XXVII -443	H	H	H	OCSMe	H	F	H	F	H
	XXVII -444	H	H	H	OCSNM $e_2$	H	F	H	F	H
10	XXVII -445	H	H	H	SMe	H	F	H	F	H
15	XXVII -446	H	H	H	SEt	H	F	H	F	H
	XXVII -447	H	H	H	SCOMe	H	F	H	F	H
20	XXVII -448	H	H	H	SCSNM $e_2$	H	F	H	F	H
25	XXVII -449	H	H	H	SCSNH Me	H	F	H	F	H
	XXVII -450	H	H	H	NHMe	H	F	H	F	H
30	XXVII -451	H	H	H	NH <sub>2</sub>	H	F	H	F	H
35	XXVII -452	H	H	H	NMe <sub>2</sub>	H	F	H	F	H
	XXVII -453	H	H	H	NHCOM e	H	F	H	F	H
40	XXVII -454	H	H	H	NHCON H <sub>2</sub>	H	F	H	F	H
45	XXVII -455	H	H	H	NHCON HMe	H	F	H	F	H
	XXVII -456	H	H	H	NHCON Me <sub>2</sub>	H	F	H	F	H
50	XXVII -457	H	H	H	fenil o	H	F	H	F	H
55	XXVII -458	H	H	H	2- cloro fenil o	H	F	H	F	H
60	XXVII -459	H	H	H	4- nitro fenil o	H	F	H	F	H
65	XXVII	H	H	H	2-	H	F	H	F	H

ES 2 353 159 T3

	-460				pirid ilo					
5	XXVII -461	H	H	H	3- pirid ilo	H	F	H	F	H
10	XXVII -462	H	H	H	4- pirid ilo	H	F	H	F	H
15	XXVII -463	H	H	H	2- furil o	H	F	H	F	H
20	XXVII -464	H	H	H	PhO	H	F	H	F	H
25	XXVII -465	H	Me	H	Me	H	F	H	F	H
	XXVII -466	H	Me	F	Me	H	F	H	F	H
30	XXVII -467	H	Me	H	F	H	F	H	F	H
35	XXVII -468	H	Me	F	H	H	F	H	F	H
	XXVII -469	H	Me	Me	H	H	F	H	F	H
40	XXVII -470	H	F	H	Me	H	F	H	F	H
45	XXVII -471	H	F	H	F	H	F	H	F	H
	XXVII -472	H	H	H	H	H	Me	H	H	H
50	XXVII -473	H	H	H	H	H	Et	H	H	H
55	XXVII -474	H	H	H	H	H	vinil o	H	H	H
	XXVII -475	H	H	H	H	H	alilo	H	H	H
60	XXVII -476	H	H	H	H	H	ciclo pro pilo	H	H	H
65	XXVII -477	H	H	H	H	H	F	H	H	H

ES 2 353 159 T3

	XXVII -478	H	H	H	H	H	Cl	H	H	H
5	XXVII -479	H	H	H	H	H	NO <sub>2</sub>	H	H	H
10	XXVII -480	H	H	H	H	H	CN	H		H
	XXVII -481	H	H	H	H	H	CONH <sub>2</sub>	H	H	H
15	XXVII -482	H	H	H	H	H	CONHM e	H	H	H
20	XXVII -483	H	H	H	H	H	CONMe 2	H	H	H
	XXVII -484	H	H	H	H	H	COMe	H	H	H
25	XXVII -485	H	H	H	H	H	COOH	H	H	H
	XXVII -486	H	H	H	H	H	COOMe	H	H	H
30	XXVII -487	H	H	H	H	H	CSOMe	H	H	H
35	XXVII -488	H	H	H	H	H	CSNH <sub>2</sub>	H	H	H
40	XXVII -489	H	H	H	H	H	CSNMe 2	H	H	H
	XXVII -490	H	H	H	H	H	CSNHM e	H	H	H
45	XXVII -491	H	H	H	H	H	OMe	H	H	H
50	XXVII -492	H	H	H	H	H	OEt	H	H	H
	XXVII -493	H	H	H	H	H	OCOMe	H	H	H
55	XXVII -494	H	H	H	H	H	OCOOM e	H	H	H
60	XXVII -495	H	H	H	H	H	OCONH Me	H	H	H
	XXVII -496	H	H	H	H	H	OCONM e <sub>2</sub>	H	H	H
65	XXVII -497	H	H	H	H	H	OCSMe	H	H	H

## ES 2 353 159 T3

5	XXVII -498	H	H	H	H	H	OCSNM e <sub>2</sub>	H	H	H
	XXVII -499	H	H	H	H	H	SMe	H	H	H
10	XXVII -500	H	H	H	H	H	SEt	H	H	H
	XXVII -501	H	H	H	H	H	SCOMe	H	H	H
15	XXVII -502	H	H	H	H	H	SCSNM e <sub>2</sub>	H	H	H
	XXVII -503	H	H	H	H	H	SCSNH Me	H	H	H
20	XXVII -504	H	H	H	H	H	NHMe	H	H	H
25	XXVII -505	H	H	H	H	H	NH <sub>2</sub>	H	H	H
	XXVII -506	H	H	H	H	H	NMe <sub>2</sub>	H	H	H
30	XXVII -507	H	H	H	H	H	NHCOM e	H	H	H
35	XXVII -508	H	H	H	H	H	NHCON H <sub>2</sub>	H	H	H
	XXVII -509	H	H	H	H	H	NHCON HMe	H	H	H
40	XXVII -510	H	H	H	H	H	NHCON Me <sub>2</sub>	H	H	H
45	XXVII -511	H	H	H	H	H	fenil o	H	H	H
50	XXVII -512	H	H	H	H	H	2- cloro fenil o	H	H	H
55	XXVII -513	H	H	H	H	H	4- nitro fenil o	H	H	H
60	XXVII -514	H	H	H	H	H	2- pirid ilo	H	H	H
65	XXVII	H	H	H	H	H	3-	H	H	H

ES 2 353 159 T3

	-515					piridilo			
5	XXVII -516	H	H	H	H	4- piridilo	H	H	H
10	XXVII -517	H	H	H	H	2- furalo	H	H	H
15	XXVII -518	H	H	H	H	PhO	H	H	H
20	XXVII -519	H	H	H	H	H	H	Me	H
	XXVII -520	H	H	H	H	H	H	Et	H
25	XXVII -521	H	H	H	H	H	H	vinilo	H
30	XXVII -522	H	H	H	H	H	H	alilo	H
35	XXVII -523	H	H	H	H	H	H	ciclopropilo	H
	XXVII -524	H	H	H	H	H	H	F	H
40	XXVII -525	H	H	H	H	H	H	Cl	H
45	XXVII -526	H	H	H	H	H	H	NO <sub>2</sub>	H
	XXVII -527	H	H	H	H	H	H	CN	H
50	XXVII -528	H	H	H	H	H	H	CONH <sub>2</sub>	H
55	XXVII -529	H	H	H	H	H	H	CONHMe	H
	XXVII -530	H	H	H	H	H	H	CONMe <sub>2</sub>	H
60	XXVII -531	H	H	H	H	H	H	COMe	H
	XXVII -532	H	H	H	H	H	H	COOH	H
65	XXVII	H	H	H	H	H	H	COOMe	H

# ES 2 353 159 T3

	-533								
5	XXVII -534	H	H	H	H	H	H	CSOMe	H
	XXVII -535	H	H	H	H	H	H	CSNH <sub>2</sub>	H
10	XXVII -536	H	H	H	H	H	H	CSNMe <sub>2</sub>	H
15	XXVII -537	H	H	H	H	H	H	CSNHMe	H
	XXVII -538	H	H	H	H	H	H	OMe	H
20	XXVII -539	H	H	H	H	H	H	OEt	H
	XXVII -540	H	H	H	H	H	H	OCOMe	H
25	XXVII -541	H	H	H	H	H	H	OCOOMe	H
30	XXVII -542	H	H	H	H	H	H	OCONHMe	H
	XXVII -543	H	H	H	H	H	H	OCONMe <sub>2</sub>	H
35	XXVII -544	H	H	H	H	H	H	OCSMe	H
40	XXVII -545	H	H	H	H	H	H	OCSNMe <sub>2</sub>	H
	XXVII -546	H	H	H	H	H	H	SMe	H
45	XXVII -547	H	H	H	H	H	H	SEt	H
	XXVII -548	H	H	H	H	H	H	SCOMe	H
50	XXVII -549	H	H	H	H	H	H	SCSNMe <sub>2</sub>	H
55	XXVII -550	H	H	H	H	H	H	SCSNHMe	H
60	XXVII -551	H	H	H	H	H	H	NHMe	H
	XXVII -552	H	H	H	H	H	H	NH <sub>2</sub>	H
65	XXVII	H	H	H	H	H	H	NMe <sub>2</sub>	H

ES 2 353 159 T3

	-553								
5	XXVII -554	H	H	H	H	H	H	NHCOM e	H
	XXVII -555	H	H	H	H	H	H	NHCON H <sub>2</sub>	H
10	XXVII -556	H	H	H	H	H	H	NHCON HMe	H
15	XXVII -557	H	H	H	H	H	H	NHCON Me <sub>2</sub>	H
	XXVII -558	H	H	H	H	H	H	fenil o	H
20	XXVII -559	H	H	H	H	H	H	2- cloro fenil o	H
25									
	XXVII -560	H	H	H	H	H	H	4- nitro fenil o	H
30									
	XXVII -561	H	H	H	H	H	H	2- pirid ilo	H
35									
	XXVII -562	H	H	H	H	H	H	3- pirid ilo	H
40									
	XXVII -563	H	H	H	H	H	H	4- pirid ilo	H
45									
	XXVII -564	H	H	H	H	H	H	2- fural o	H
50									
	XXVII -565	H	H	H	H	H	H	PhO	H
55									
	XXVII -566	H	H	H	H	H	H	H	Me
60									
	XXVII -567	H	H	H	H	H	H	H	Et
65									
	XXVII -568	H	H	H	H	H	H	H	vinil o
	XXVII	H	H	H	H	H	H	H	alilo

ES 2 353 159 T3

	-569								
5	XXVII -570	H	H	H	H	H	H	H	ciclo propi lo
10	XXVII -571	H	H	H	H	H	H	H	F
15	XXVII -572	H	H	H	H	H	H	H	Cl
20	XXVII -573	H	H	H	H	H	H	H	NO <sub>2</sub>
25	XXVII -574	H	H	H	H	H	H	H	CN
30	XXVII -575	H	H	H	H	H	H	H	CONH <sub>2</sub>
35	XXVII -576	H	H	H	H	H	H	H	CONHM e
40	XXVII -577	H	H	H	H	H	H	H	CONMe 2
45	XXVII -578	H	H	H	H	H	H	H	COMe
50	XXVII -579	H	H	H	H	H	H	H	COOH
55	XXVII -580	H	H	H	H	H	H	H	COOMe
60	XXVII -581	H	H	H	H	H	H	H	CSOMe
65	XXVII -582	H	H	H	H	H	H	H	CSNH <sub>2</sub>
	XXVII -583	H	H	H	H	H	H	H	CSNMe 2
	XXVII -584	H	H	H	H	H	H	H	CSNHM e
	XXVII -585	H	H	H	H	H	H	H	OMe
	XXVII -586	H	H	H	H	H	H	H	OEt
	XXVII -587	H	H	H	H	H	H	H	OCOMe
	XXVII -588	H	H	H	H	H	H	H	OCOOM e

ES 2 353 159 T3

	XXVII -589	H	H	H	H	H	H	H	OCONH Me
5	XXVII -590	H	H	H	H	H	H	H	OCONM e <sub>2</sub>
10	XXVII -591	H	H	H	H	H	H	H	OCSMe
	XXVII -592	H	H	H	H	H	H	H	OCSNM e <sub>2</sub>
15	XXVII -593	H	H	H	H	H	H	H	SMe
20	XXVII -594	H	H	H	H	H	H	H	SEt
	XXVII -595	H	H	H	H	H	H	H	SCOMe
25	XXVII -596	H	H	H	H	H	H	H	SCSNM e <sub>2</sub>
30	XXVII -597	H	H	H	H	H	H	H	SCSNH Me
	XXVII -598	H	H	H	H	H	H	H	NHMe
35	XXVII -599	H	H	H	H	H	H	H	NH <sub>2</sub>
40	XXVII -600	H	H	H	H	H	H	H	NMe <sub>2</sub>
	XXVII -601	H	H	H	H	H	H	H	NHCOM e
45	XXVII -602	H	H	H	H	H	H	H	NHCON H <sub>2</sub>
50	XXVII -603	H	H	H	H	H	H	H	NHCON HMe
	XXVII -604	H	H	H	H	H	H	H	NHCON Me <sub>2</sub>
55	XXVII -605	H	H	H	H	H	H	H	fenil o
60	XXVII -606	H	H	H	H	H	H	H	2- cloro fenil o
65	XXVII -607	H	H	H	H	H	H	H	4- nitro

ES 2 353 159 T3

									fenil o
5	XXVII -608	H	H	H	H	H	H	H	2- pirid ilo
10	XXVII -609	H	H	H	H	H	H	H	3- pirid ilo
15	XXVII -610	H	H	H	H	H	H	H	4- pirid ilo
20	XXVII -611	H	H	H	H	H	H	H	2- furil o
25	XXVII -612	H	H	H	H	H	H	H	PhO

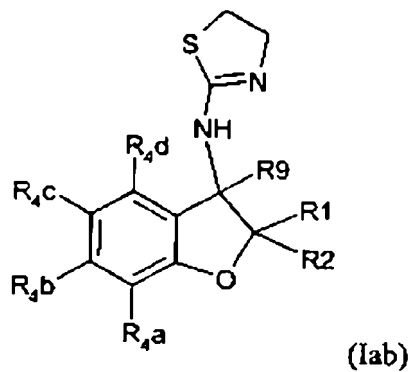
30

La tabla XXVIII estipula 422 compuestos de fórmula Iab

35

40

45



50

donde los valores de  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^{4a}$ ,  $R^{4b}$ ,  $R^{4c}$ ,  $R^{4d}$  y  $R^9$  se indican en la tabla 4.

55

TABLA 4

60

65

Compue sto N°	R9	R1	R2	R4a	R4b	R4c	R4d
XXVIII -1	Me	H	H	H	H	H	H
XXVIII	Et	H	H	H	H	H	H

ES 2 353 159 T3

	-2						
5	XXVIII -3	vinilo	H	H	H	H	H
	XXVIII -4	alilo	H	H	H	H	H
10	XXVIII -5	ciclop ropilo	H	H	H	H	H
15	XXVIII -6	CN	H	H	H	H	H
	XXVIII -7	CONH <sub>2</sub>	H	H	H	H	H
20	XXVIII -8	CONHMe	H	H	H	H	H
25	XXVIII -9	CONMe <sub>2</sub>	H	H	H	H	H
	XXVIII -10	COMe	H	H	H	H	H
30	XXVIII -11	COOH	H	H	H	H	H
35	XXVIII -12	COOMe	H	H	H	H	H
	XXVIII -13	CSNHMe	H	H	H	H	H
40	XXVIII -14	H	Me	H	H	H	H
45	XXVIII -15	H	Et	H	H	H	H
	XXVIII -16	H	vinilo	H	H	H	H
50	XXVIII -17	H	alilo	H	H	H	H
55	XXVIII -18	H	ciclop ropilo	H	H	H	H
	XXVIII -19	H	F	H	H	H	H
60	XXVIII -20	H	Cl	H	H	H	H
65	XXVIII -21	H	NO <sub>2</sub>	H	H	H	H
	XXVIII	H	CN	H	H	H	H

ES 2 353 159 T3

	-22						
5	XXVIII	H	CONH <sub>2</sub>	H	H	H	H
	-23						
	XXVIII	H	CONHMe	H	H	H	H
	-24						
10	XXVIII	H	CONMe <sub>2</sub>	H	H	H	H
	-25						
15	XXVIII	H	COMe	H	H	H	H
	-26						
	XXVIII	H	COOH	H	H	H	H
	-27						
20	XXVIII	H	COOMe	H	H	H	H
	-28						
25	XXVIII	H	CSOMe	H	H	H	H
	-29						
	XXVIII	H	CSNH <sub>2</sub>	H	H	H	H
	-30						
30	XXVIII	H	CSNMe <sub>2</sub>	H	H	H	H
	-31						
	XXVIII	H	CSNHMe	H	H	H	H
35	-32						
	XXVIII	H	OMe	H	H	H	H
	-33						
40	XXVIII	H	OEt	H	H	H	H
	-34						
	XXVIII	H	OCOMe	H	H	H	H
45	-35						
	XXVIII	H	OCOOMe	H	H	H	H
	-36						
50	XXVIII	H	OCONHM e	H	H	H	H
	-37						
	XXVIII	H	OCONMe <sub>2</sub>	H	H	H	H
55	-38						
	XXVIII	H	OCSMe	H	H	H	H
	-39						
60	XXVIII	H	OCSNMe <sub>2</sub>	H	H	H	H
	-40						
	XXVIII	H	SMe	H	H	H	H
65	-41						
	XXVIII	H	SEt	H	H	H	H

ES 2 353 159 T3

	-42						
5	XXVIII -43	H	SCOMe	H	H	H	H
	XXVIII -44	H	SCSNMe <sub>2</sub>	H	H	H	H
10	XXVIII -45	H	SCSNHMe	H	H	H	H
15	XXVIII -46	H	NHMe	H	H	H	H
	XXVIII -47	H	NH <sub>2</sub>	H	H	H	H
20	XXVIII -48	H	NMe <sub>2</sub>	H	H	H	H
	XXVIII -49	H	NHCOMe	H	H	H	H
25	XXVIII -50	H	NHCONH <sub>2</sub>	H	H	H	H
30	XXVIII -51	H	NHCONHMe	H	H	H	H
	XXVIII -52	H	NHCONMe <sub>2</sub>	H	H	H	H
35	XXVIII -53	H	fenilo	H	H	H	H
40	XXVIII -54	H	2-clorofenilo	H	H	H	H
45	XXVIII -55	H	4-nitrofenilo	H	H	H	H
50	XXVIII -56	H	2-piridilo	H	H	H	H
55	XXVIII -57	H	3-piridilo	H	H	H	H
60	XXVIII -58	H	4-piridilo	H	H	H	H
65	XXVIII -59	H	2-furilo	H	H	H	H

ES 2 353 159 T3

5	XXVIII -60	H	PhO	H	H	H	H	H
	XXVIII -61	CH <sub>2</sub>		H	H	H	H	H
10	XXVIII -62	H	=O		H	H	H	H
	XXVIII -63	H	=NOH		H	H	H	H
15	XXVIII -64	H	=NOMe		H	H	H	H
	XXVIII -65	H	=CH <sub>2</sub>		H	H	H	H
20	XXVIII -66	H	=CHMe		H	H	H	H
25	XXVIII -67	H	H	H	H	H	H	H
	XXVIII -68	H	Me	H	H	H	H	H
30	XXVIII -69	H	Me	F	H	H	H	H
35	XXVIII -70	H	Et	H	H	H	H	H
	XXVIII -71	H	Me	Me	H	H	H	H
40	XXVIII -72	Me	H	Me	H	H	H	H
45	XXVIII -73	H	F	H	H	H	H	H
	XXVIII -74	Me	F	H	H	H	H	H
50	XXVIII -75	Me	H	H	F	H	H	H
55	XXVIII -76	Et	H	H	F	H	H	H
	XXVIII -77	vinilo	H	H	F	H	H	H
60	XXVIII -78	alilo	H	H	F	H	H	H
65	XXVIII -79	ciclop ropilo	H	H	F	H	H	H

ES 2 353 159 T3

	XXVIII -80	CN	H	H	F	H	H	H
5	XXVIII -81	CONH <sub>2</sub>	H	H	F	H	H	H
10	XXVIII -82	CONHMe	H	H	F	H	H	H
	XXVIII -83	CONMe <sub>2</sub>	H	H	F	H	H	H
15	XXVIII -84	COMe	H	H	F	H	H	H
20	XXVIII -85	COOH	H	H	F	H	H	H
	XXVIII -86	COOMe	H	H	F	H	H	H
25	XXVIII -87	CSNHMe	H	H	F	H	H	H
30	XXVIII -88	H	Me	H	F	H	H	H
	XXVIII -89	H	Et	H	F	H	H	H
35	XXVIII -90	H	vinilo	H	F	H	H	H
40	XXVIII -91	H	alilo	H	F	H	H	H
	XXVIII -92	H	ciclop ropilo	H	F	H	H	H
45	XXVIII -93	H	F	H	F	H	H	H
50	XXVIII -94	H	Cl	H	F	H	H	H
	XXVIII -95	H	NO <sub>2</sub>	H	F	H	H	H
55	XXVIII -96	H	CN	H	F	H	H	H
60	XXVIII -97	H	CONH <sub>2</sub>	H	F	H	H	H
	XXVIII -98	H	CONHMe	H	F	H	H	H
65	XXVIII -99	H	CONMe <sub>2</sub>	H	F	H	H	H

ES 2 353 159 T3

	XXVIII -100	H	COMe	H	F	H	H	H
5	XXVIII -101	H	COOH	H	F	H	H	H
10	XXVIII -102	H	COOMe	H	F	H	H	H
	XXVIII -103	H	CSOMe	H	F	H	H	H
15	XXVIII -104	H	CSNH <sub>2</sub>	H	F	H	H	H
20	XXVIII -105	H	CSNMe <sub>2</sub>	H	F	H	H	H
	XXVIII -106	H	CSNHMe	H	F	H	H	H
25	XXVIII -107	H	OMe	H	F	H	H	H
	XXVIII -108	H	OEt	H	F	H	H	H
30	XXVIII -109	H	OCOMe	H	F	H	H	H
35	XXVIII -110	H	OCOOMe	H	F	H	H	H
	XXVIII -111	H	OCONHM e	H	F	H	H	H
40	XXVIII -112	H	OCONMe <sub>2</sub>	H	F	H	H	H
45	XXVIII -113	H	OCSMe	H	F	H	H	H
	XXVIII -114	H	OCSNMe <sub>2</sub>	H	F	H	H	H
50	XXVIII -115	H	SMe	H	F	H	H	H
55	XXVIII -116	H	SEt	H	F	H	H	H
	XXVIII -117	H	SCOMe	H	F	H	H	H
60	XXVIII -118	H	SCSNMe <sub>2</sub>	H	F	H	H	H
65	XXVIII -119	H	SCSNHM e	H	F	H	H	H

ES 2 353 159 T3

5	XXVIII -120	H	NHMe	H	F	H	H	H
	XXVIII -121	H	NH <sub>2</sub>	F	F	H	H	H
10	XXVIII -122	H	NMe <sub>2</sub>	H	F	H	H	H
	XXVIII -123	H	NHCOMe	F	F	H	H	H
15	XXVIII -124	H	NHCONH <sub>2</sub>	Me	F	H	H	H
	XXVIII -125	H	NHCONH Me	H	F	H	H	H
20	XXVIII -126	H	NHCONM e <sub>2</sub>	H	F	H	H	H
25	XXVIII -127	H	fenilo	H	F	H	H	H
	XXVIII -128	H	2- clorof enilo	H	F	H	H	H
30								
	XXVIII -129	H	4- nitrof enilo	H	F	H	H	H
35								
	XXVIII -130	H	2- piridi lo	H	F	H	H	H
40								
	XXVIII -131	H	3- piridi lo	H	F	H	H	H
45								
	XXVIII -132	H	4- piridi lo	H	F	H	H	H
50								
	XXVIII -133	H	2- furilo	H	F	H	H	H
55								
	XXVIII -134	H	PhO	H	F	H	H	H
60	XXVIII -135	CH <sub>2</sub>		H	F	H	H	H
	XXVIII -136	H	H	H	F	H	H	H
65								
	XXVIII	H	Me	H	F	H	H	H

ES 2 353 159 T3

	-137						
5	XXVIII -138	H Me	Me F	F F	H H	H H	H H
	XXVIII -139	H Et	Et H	H F	H H	H H	H H
10	XXVIII -140	H Me	Me Me	F F	H H	H H	H H
15	XXVIII -141	Me H	H Me	F F	H H	H H	H H
	XXVIII -142	H F	F H	H F	H H	H H	H H
20	XXVIII -143	Me F	F H	H F	H H	H H	H H
25	XXVIII -144	Me H	H H	Me Me	H H	H H	H H
	XXVIII -145	Et H	H H	Me Me	H H	H H	H H
30	XXVIII -146	vinilo H	H H	Me Me	H H	H H	H H
35	XXVIII -147	alilo H	H H	Me Me	H H	H H	H H
	XXVIII -148	ciclop ropilo	H H	Me Me	H H	H H	H H
40	XXVIII -149	CN H	H H	Me Me	H H	H H	H H
45	XXVIII -150	CONH2 H	H H	Me Me	H H	H H	H H
	XXVIII -151	CONHMe H	H H	Me Me	H H	H H	H H
50	XXVIII -152	CONMe2 H	H H	Me Me	H H	H H	H H
55	XXVIII -153	COMe H	H H	Me Me	H H	H H	H H
	XXVIII -154	COOH H	H H	Me Me	H H	H H	H H
60	XXVIII -155	COOMe H	H H	Me Me	H H	H H	H H
65	XXVIII -156	CSNHMe H	H H	Me Me	H H	H H	H H
	XXVIII	H Me	H H	Me Me	H H	H H	H H

ES 2 353 159 T3

	-157						
5	XXVIII -158	H	Et	H	Me	H	H
	XXVIII -159	H	vinilo	H	Me	H	H
10	XXVIII -160	H	alilo	H	Me	H	H
15	XXVIII -161	H	ciclop ropilo	H	Me	H	H
	XXVIII -162	H	F	H	Me	H	H
20	XXVIII -163	H	Cl	H	Me	H	H
25	XXVIII -164	H	NO <sub>2</sub>	H	Me	H	H
	XXVIII -165	H	CN	H	Me	H	H
30	XXVIII -166	H	CONH <sub>2</sub>	H	Me	H	H
35	XXVIII -167	H	CONHMe	H	Me	H	H
	XXVIII -168	H	CONMe <sub>2</sub>	H	Me	H	H
40	XXVIII -169	H	COMe	H	Me	H	H
45	XXVIII -170	H	COOH	H	Me	H	H
	XXVIII -171	H	COOMe	H	Me	H	H
50	XXVIII -172	H	CSOMe	H	Me	H	H
55	XXVIII -173	H	CSNH <sub>2</sub>	H	Me	H	H
	XXVIII -174	H	CSNMe <sub>2</sub>	H	Me	H	H
60	XXVIII -175	H	CSNHMe	H	Me	H	H
65	XXVIII -176	H	OMe	H	Me	H	H
	XXVIII	H	OEt	H	Me	H	H

ES 2 353 159 T3

	-177						
5	XXVIII -178	H	OCOMe	H	Me	H	H
	XXVIII -179	H	OCOOMe	H	Me	H	H
10	XXVIII -180	H	OCONHMe	H	Me	H	H
15	XXVIII -181	H	OCONMe <sub>2</sub>	H	Me	H	H
	XXVIII -182	H	OCSMe	H	Me	H	H
20	XXVIII -183	H	OCSNMe <sub>2</sub>	H	Me	H	H
	XXVIII -184	H	SMe	H	Me	H	H
25	XXVIII -185	H	SEt	H	Me	H	H
30	XXVIII -186	H	SCOMe	H	Me	H	H
	XXVIII -187	H	SCSNMe <sub>2</sub>		Me	H	H
35	XXVIII -188	H	SCSNHMe	H	Me	H	H
40	XXVIII -189	H	NHMe	H	Me	H	H
	XXVIII -190	H	NH <sub>2</sub>	H	Me	H	H
45	XXVIII -191	H	NMe <sub>2</sub>	H	Me	H	H
50	XXVIII -192	H	NHCOMe	H	Me	H	H
	XXVIII -193	H	NHCONH <sub>2</sub>	H	Me	H	H
55	XXVIII -194	H	NHCONHMe	H	Me	H	H
60	XXVIII -195	H	NHCONMe <sub>2</sub>	H	Me	H	H
	XXVIII -196	H	fenilo	H	Me	H	H
65	XXVIII	H	2-	H	Me	H	H

ES 2 353 159 T3

	-197		clorof enilo					
5	XXVIII -198	H	4- nitrof enilo	H	Me	H	H	H
10	XXVIII -199	H	2- piridi lo	H	Me	H	H	H
15	XXVIII -200	H	3- piridi lo	H	Me	H	H	H
20	XXVIII -201	H	4- piridi lo	H	Me	H	H	H
25	XXVIII -202	H	2- furilo	H	Me	H	H	H
30	XXVIII -203	H	PhO	H	Me	H	H	H
	XXVIII -204	CH <sub>2</sub>		H	Me	H	H	H
35	XXVIII -205	H	H	H	Me	H	H	H
40	XXVIII -206	H	Me	H	Me	H	H	H
	XXVIII -207	H	Me	F	Me	H	H	H
45	XXVIII -208	H	Et	H	Me	H	H	H
50	XXVIII -209	H	Me	Me	Me	H	H	H
	XXVIII -210	Me	H	Me	Me	H	H	H
55	XXVIII -211	H	F	H	Me	H	H	H
60	XXVIII -212	Me	F	H	Me	H	H	H
	XXVIII -213	Me	H	H	F	H	F	H
65	XXVIII -214	Et	H	H	F	H	F	H

ES 2 353 159 T3

5	XXVIII -215	vinilo	H	H	F	H	F	H
	XXVIII -216	alilo	H	H	F	H	F	H
10	XXVIII -217	ciclop ropilo	H	H	F	H	F	H
	XXVIII -218	CN	H	H	F	H	F	H
15	XXVIII -219	CONH2	H	H	F	H	F	H
	XXVIII -220	CONHMe	H	H	F	H	F	H
20	XXVIII -221	CONMe2	H	H	F	H	F	H
	XXVIII -222	COMe	H	H	F	H	F	H
25	XXVIII -223	COOH	H	H	F	H	F	H
	XXVIII -224	COOMe	H	H	F	H	F	H
30	XXVIII -225	CSNHMe	H	H	F	H	F	H
	XXVIII -226	H	Me	H	F	H	F	H
35	XXVIII -227	H	Et	H	F	H	F	H
	XXVIII -228	H	vinilo	H	F	H	F	H
40	XXVIII -229	H	alilo	H	F	H	F	H
	XXVIII -230	H	ciclop ropilo	H	F	H	F	H
45	XXVIII -231	H	F	H	F	H	F	H
	XXVIII -232	H	Cl	H	F	H	F	H
50	XXVIII -233	H	NO <sub>2</sub>	H	F	H	F	H
	XXVIII -234	H	CN	H	F	H	F	H
55								
60								
65								

ES 2 353 159 T3

5	XXVIII -235	H	CONH <sub>2</sub>	H	F	H	F	H
	XXVIII -236	H	CONHMe	H	F	H	F	H
10	XXVIII -237	H	CONMe <sub>2</sub>	H	F	H	F	H
	XXVIII -238	H	COMe	H	F	H	F	H
15	XXVIII -239	H	COOH	H	F	H	F	H
	XXVIII -240	H	COOMe	H	F	H	F	H
20	XXVIII -241	H	CSOMe	H	F	H	F	H
25	XXVIII -242	H	CSNH <sub>2</sub>	H	F	H	F	H
	XXVIII -243	H	CSNMe <sub>2</sub>	H	F	H	F	H
30	XXVIII -244	H	CSNHMe	H	F	H	F	H
35	XXVIII -245	H	OMe	H	F	H	F	H
	XXVIII -246	H	OEt	H	F	H	F	H
40	XXVIII -247	H	OCOMe	H	F	H	F	H
45	XXVIII -248	H	OCOOMe	H	F	H	F	H
	XXVIII -249	H	OCONHMe	H	F	H	F	H
50	XXVIII -250	H	OCONMe <sub>2</sub>	H	F	H	F	H
55	XXVIII -251	H	OCSMe	H	F	H	F	H
	XXVIII -252	H	OCSNMe <sub>2</sub>	H	F	H	F	H
60	XXVIII -253	H	SMe	H	F	H	F	H
65	XXVIII -254	H	SEt	H	F	H	F	H

## ES 2 353 159 T3

	XXVIII -255	H	SCOMe	H	F	H	F	H
5	XXVIII -256	H	SCSNMe <sub>2</sub>	H	F	H	F	H
10	XXVIII -257	H	SCSNHMe	H	F	H	F	H
	XXVIII -258	H	NHMe	H	F	H	F	H
15	XXVIII -259	H	NH <sub>2</sub>	H	F	H	F	H
20	XXVIII -260	H	NMe <sub>2</sub>	H	F	H	F	H
	XXVIII -261	H	NHCOMe	H	F	H	F	H
25	XXVIII -262	H	NHCONH <sub>2</sub>	H	F	H	F	H
	XXVIII -263	H	NHCONHMe	H	F	H	F	H
30	XXVIII -264	H	NHCONMe <sub>2</sub>	H	F	H	F	H
35	XXVIII -265	H	fenilo	H	F	H	F	H
	XXVIII -266	H	2-clorofenilo	H	F	H	F	H
40	XXVIII -267	H	4-nitrofenilo	H	F	H	F	H
45	XXVIII -268	H	2-piridilo	H	F	H	F	H
50	XXVIII -269	H	3-piridilo	H	F	H	F	H
55	XXVIII -270	H	4-piridilo	H	F	H	F	H
60	XXVIII -271	H	2-furilo	H	F	H	F	H
65	XXVIII	H	PhO	H	F	H	F	H

ES 2 353 159 T3

	-272						
5	XXVIII -273	CH <sub>2</sub>		H	F	H	F
	XXVIII -274	H	H	H	F	H	F
10	XXVIII -275	H	Me	H	F	H	F
15	XXVIII -276	H	Me	F	F	H	F
	XXVIII -277	H	Et	H	F	H	F
20	XXVIII -278	H	Me	Me	F	H	F
25	XXVIII -279	Me	H	Me	F	H	F
	XXVIII -280	H	F	H	F	H	F
30	XXVIII -281	Me	F	H	F	H	F
35	XXVIII -282	H	H	H	Me	H	H
	XXVIII -283	H	H	H	Et	H	H
40	XXVIII -284	H	H	H	vinilo	H	H
45	XXVIII -285	H	H	H	alilo	H	H
	XXVIII -286	H	H	H	ciclop ropilo	H	H
50	XXVIII -287	H	H	H	F	H	H
55	XXVIII -288	H	H	H	Cl	H	H
	XXVIII -289	H	H	H	NO <sub>2</sub>	H	H
60	XXVIII -290	H	H	H	CN	H	H
	XXVIII -291	H	H	H	CONH <sub>2</sub>	H	H
65	XXVIII	H	H	H	CONHMe	H	H

## ES 2 353 159 T3

	-292						
5	XXVIII -293	H	H	H	CONMe <sub>2</sub>	H	H
	XXVIII -294	H	H	H	COMe	H	H
10	XXVIII -295	H	H	H	COOH	H	H
15	XXVIII -296	H	H	H	COOMe	H	H
	XXVIII -297	H	H	H	CSOMe	H	H
20	XXVIII -298	H	H	H	CSNH <sub>2</sub>	H	H
	XXVIII -299	H	H	H	CSNMe <sub>2</sub>	H	H
25	XXVIII -300	H	H	H	CSNHMe	H	H
30	XXVIII -301	H	H	H	OMe	H	H
	XXVIII -302	H	H	H	OEt	H	H
35	XXVIII -303	H	H	H	OCOMe	H	H
40	XXVIII -304	H	H	H	OCOOMe	H	H
	XXVIII -305	H	H	H	OCONHMe	H	H
45	XXVIII -306	H	H	H	OCONMe <sub>2</sub>	H	H
50	XXVIII -307	H	H	H	OCSMe	H	H
	XXVIII -308	H	H	H	OCSNMe <sub>2</sub>	H	H
55	XXVIII -309	H	H	H	SMe	H	H
60	XXVIII -310	H	H	H	SEt	H	H
	XXVIII -311	H	H	H	SCOMe	H	H
65	XXVIII	H	H	H	SCSNMe <sub>2</sub>	H	H

ES 2 353 159 T3

	-312						
5	XXVIII -313	H	H	H	SCSNHM e	H	H
	XXVIII -314	H	H	H	NHMe	H	H
10	XXVIII -315	H	H	H	NH <sub>2</sub>	H	H
15	XXVIII -316	H	H	H	NMe <sub>2</sub>	H	H
	XXVIII -317	H	H	H	NHCOMe	H	H
20	XXVIII -318	H	H	H	NHCONH <sub>2</sub>	H	H
25	XXVIII -319	H	H	H	NHCONH Me	H	H
	XXVIII -320	H	H	H	NHCONM e <sub>2</sub>	H	H
30	XXVIII -321	H	H	H	fenilo	H	H
35	XXVIII -322	H	H	H	2- clorof enilo	H	H
40	XXVIII -323	H	H	H	4- nitrof enilo	H	H
45	XXVIII -324	H	H	H	2- piridi lo	H	H
50	XXVIII -325	H	H	H	3- piridi lo	H	H
55	XXVIII -326	H	H	H	4- piridi lo	H	H
60	XXVIII -327	H	H	H	2- furilo	H	H
	XXVIII -328	H	H	H	PhO	H	H
65	XXVIII -329	H	H	H	H	H	Me

ES 2 353 159 T3

5	XXVIII -330	H	H	H	H	H	Et	H
	XXVIII -331	H	H	H	H	H	vinilo	H
10	XXVIII -332	H	H	H	H	H	alilo	H
	XXVIII -333	H	H	H	H	H	ciclop ropilo	H
15	XXVIII -334	H	H	H	H	H	F	H
	XXVIII -335	H	H	H	H	H	Cl	H
20	XXVIII -336	H	H	H	H	H	NO <sub>2</sub>	H
	XXVIII -337	H	H	H	H	H	CN	H
25	XXVIII -338	H	H	H	H	H	CONH <sub>2</sub>	H
	XXVIII -339	H	H	H	H	H	CONHMe	H
30	XXVIII -340	H	H	H	H	H	CONMe <sub>2</sub>	H
	XXVIII -341	H	H	H	H	H	COMe	H
35	XXVIII -342	H	H	H	H	H	COOH	H
	XXVIII -343	H	H	H	H	H	COOMe	H
40	XXVIII -344	H	H	H	H	H	CSOMe	H
	XXVIII -345	H	H	H	H	H	CSNH <sub>2</sub>	H
45	XXVIII -346	H	H	H	H	H	CSNMe <sub>2</sub>	H
	XXVIII -347	H	H	H	H	H	CSNHMe	H
50	XXVIII -348	H	H	H	H	H	OMe	H
	XXVIII -349	H	H	H	H	H	OEt	H
55								
60								
65								

ES 2 353 159 T3

	XXVIII -350	H	H	H	H	H	OCOMe	H
5	XXVIII -351	H	H	H	H	H	OCOOMe	H
10	XXVIII -352	H	H	H	H	H	OCONHM e	H
	XXVIII -353	H	H	H	H	H	OCONMe <sub>2</sub>	H
15	XXVIII -354	H	H	H	H	H	OCSMe	H
20	XXVIII -355	H	H	H	H	H	OCSNMe <sub>2</sub>	H
	XXVIII -356	H	H	H	H	H	SMe	H
25	XXVIII -357	H	H	H	H	H	SEt	H
	XXVIII -358	H	H	H	H	H	SCOMe	H
30	XXVIII -359	H	H	H	H	H	SCSNMe <sub>2</sub>	H
35	XXVIII -360	H	H	H	H	H	SCSNHM e	H
40	XXVIII -361	H	H	H	H	H	NHMe	H
	XXVIII -362	H	H	H	H	H	NH <sub>2</sub>	H
45	XXVIII -363	H	H	H	H	H	NMe <sub>2</sub>	H
	XXVIII -364	H	H	H	H	H	NHCOMe	H
50	XXVIII -365	H	H	H	H	H	NHCONH <sub>2</sub>	H
55	XXVIII -366	H	H	H	H	H	NHCONH Me	H
	XXVIII -367	H	H	H	H	H	NHCONM e <sub>2</sub>	H
60	XXVIII -368	H	H	H	H	H	fenilo	H
65	XXVIII -369	H	H	H	H	H	2- clorof	H

ES 2 353 159 T3

						enilo	
5	XXVIII -370	H	H	H	H	4- nitrof enilo	H
10	XXVIII -371	H	H	H	H	2- piridi lo	H
15	XXVIII -372	H	H	H	H	3- piridi lo	H
20	XXVIII -373	H	H	H	H	4- piridi lo	H
25	XXVIII -374	H	H	H	H	2- furilo	H
30	XXVIII -375	H	H	H	H	PhO	H
35	XXVIII -376	H	H	H	H	H	Me
40	XXVIII -377	H	H	H	H	H	Et
45	XXVIII -378	H	H	H	H	H	vinilo
50	XXVIII -379	H	H	H	H	H	alilo
55	XXVIII -380	H	H	H	H	H	ciclop ropilo
60	XXVIII -381	H	H	H	H	H	F
65	XXVIII -382	H	H	H	H	H	Cl
	XXVIII -383	H	H	H	H	H	NO <sub>2</sub>
	XXVIII -384	H	H	H	H	H	CN
	XXVIII -385	H	H	H	H	H	CONH <sub>2</sub>
	XXVIII -386	H	H	H	H	H	CONHMe
	XXVIII	H	H	H	H	H	CONMe <sub>2</sub>

ES 2 353 159 T3

	-387						
5	XXVIII -388	H	H	H	H	H	COMe
	XXVIII -389	H	H	H	H	H	COOH
10	XXVIII -390	H	H	H	H	H	COOMe
15	XXVIII -391	H	H	H	H	H	CSOMe
	XXVIII -392	H	H	H	H	H	CSNH <sub>2</sub>
20	XXVIII -393	H	H	H	H	H	CSNMe <sub>2</sub>
25	XXVIII -394	H	H	H	H	H	CSNHMe
	XXVIII -395	H	H	H	H	H	OMe
30	XXVIII -396	H	H	H	H	H	OEt
	XXVIII -397	H	H	H	H	H	OCOMe
35	XXVIII -398	H	H	H	H	H	OCOOMe
40	XXVIII -399	H	H	H	H	H	OCONHMe
45	XXVIII -400	H	H	H	H	H	OCONMe <sub>2</sub>
	XXVIII -401	H	H	H	H	H	OCSMe
50	XXVIII -402	H	H	H	H	H	OCSNMe <sub>2</sub>
55	XXVIII -403	H	H	H	H	H	SMe
	XXVIII -404	H	H	H	H	H	SEt
60	XXVIII -405	H	H	H	H	H	SCOMe
65	XXVIII -406	H	H	H	H	H	SCSNMe <sub>2</sub>
	XXVIII	H	H	H	H	H	SCSNHM

## ES 2 353 159 T3

	-407						e
5	XXVIII -408	H	H	H	H	H	NHMe
	XXVIII -409	H	H	H	H	H	NH <sub>2</sub>
10	XXVIII -410	H	H	H	H	H	NMe <sub>2</sub>
	XXVIII -411	H	H	H	H	H	NHCOMe
15	XXVIII -412	H	H	H	H	H	NHCONH <sub>2</sub>
	XXVIII -413	H	H	H	H	H	NHCONH Me
20	XXVIII -414	H	H	H	H	H	NHCONM e <sub>2</sub>
25	XXVIII -415	H	H	H	H	H	fenilo
	XXVIII -416	H	H	H	H	H	2- clorof enilo
30	XXVIII -417	H	H	H	H	H	4- nitrof enilo
35	XXVIII -418	H	H	H	H	H	2- piridi lo
40	XXVIII -419	H	H	H	H	H	3- piridi lo
45	XXVIII -420	H	H	H	H	H	4- piridi lo
50	XXVIII -421	H	H	H	H	H	2- furilo
55	XXVIII -422	H	H	H	H	H	PhO
60							

65

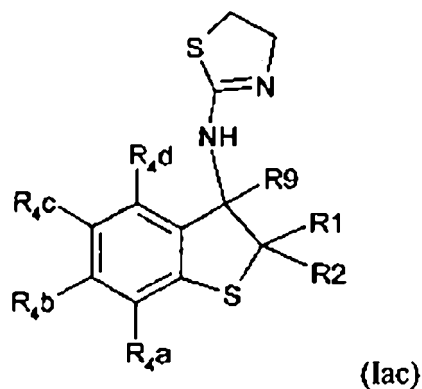
## ES 2 353 159 T3

La tabla XXIX estipula 422 compuestos de fórmula Iac

5

10

15



20

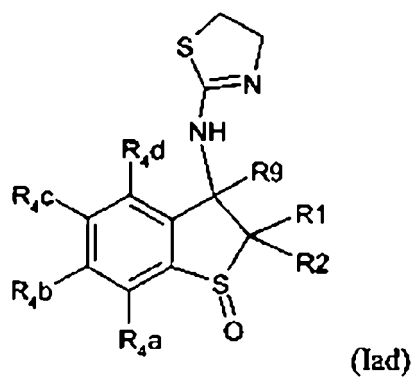
donde los valores de  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^{4a}$ ,  $R^{4b}$ ,  $R^{4c}$ ,  $R^{4d}$  y  $R^9$  se indican en la tabla 4.

La tabla XXX estipula 422 compuestos de fórmula Iad

25

30

35



40

donde los valores de  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^{4a}$ ,  $R^{4b}$ ,  $R^{4c}$ ,  $R^{4d}$  y  $R^9$  se indican en la tabla 4.

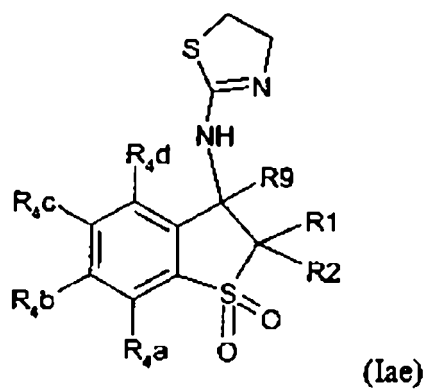
La tabla XXXI estipula 422 compuestos de fórmula Iae

45

50

55

60



donde los valores de  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^{4a}$ ,  $R^{4b}$ ,  $R^{4c}$ ,  $R^{4d}$  y  $R^9$  se indican en la tabla 4.

65

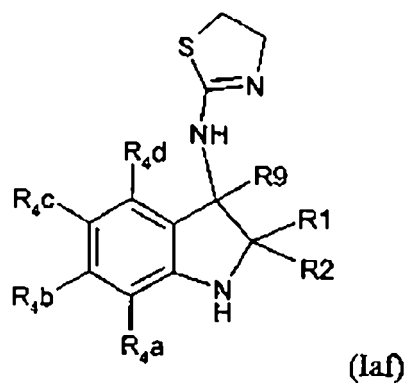
# ES 2 353 159 T3

La tabla XXXII estipula 422 compuestos de fórmula Ia<sub>f</sub>

5

10

15



20

donde los valores de R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>4a</sup>, R<sup>4b</sup>, R<sup>4c</sup>, R<sup>4d</sup> y R<sup>9</sup> se indican en la tabla 4.

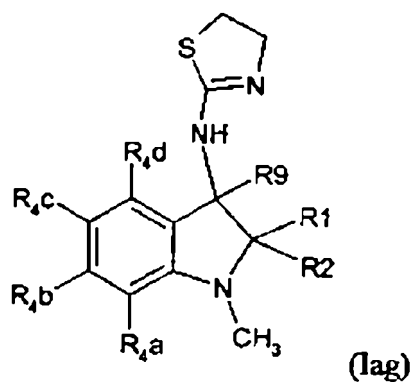
La tabla XXXIII estipula 422 compuestos de fórmula Ia<sub>g</sub>

25

30

35

40



donde los valores de R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>4a</sup>, R<sup>4b</sup>, R<sup>4c</sup>, R<sup>4d</sup> y R<sup>9</sup> se indican en la tabla 4.

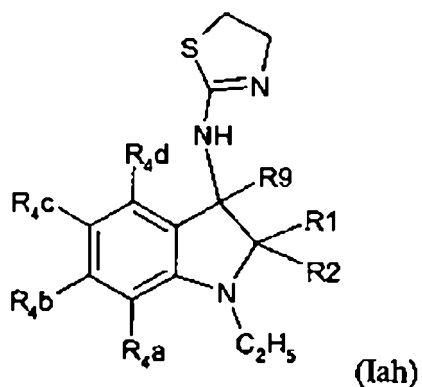
45

La tabla XXXIV estipula 422 compuestos de fórmula Ia<sub>h</sub>

50

55

60



donde los valores de R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>4a</sup>, R<sup>4b</sup>, R<sup>4c</sup>, R<sup>4d</sup> y R<sup>9</sup> se indican en la tabla 4.

65

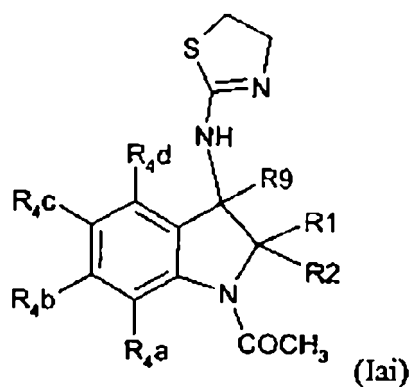
ES 2 353 159 T3

La tabla XXXV estipula 422 compuestos de fórmula Iai

5

10

15



20

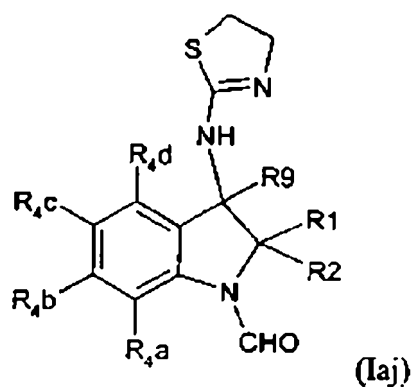
donde los valores de  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^{4a}$ ,  $R^{4b}$ ,  $R^{4c}$ ,  $R^{4d}$  y  $R^9$  se indican en la tabla 4.

La tabla XXXVI estipula 422 compuestos de fórmula Iaj

25

30

35



40

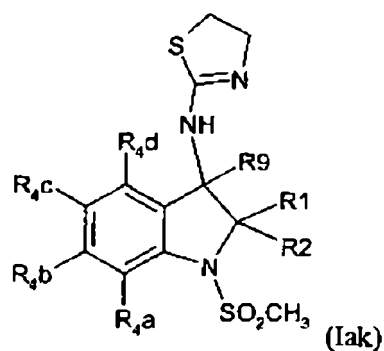
donde los valores de  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^{4a}$ ,  $R^{4b}$ ,  $R^{4c}$ ,  $R^{4d}$  y  $R^9$  se indican en la tabla 4.

La tabla XXXVII estipula 422 compuestos de fórmula Iak

45

50

55



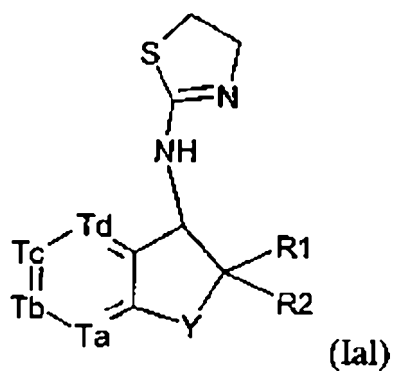
60

donde los valores de  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^{4a}$ ,  $R^{4b}$ ,  $R^{4c}$ ,  $R^{4d}$  y  $R^9$  se indican en la tabla 4.

65

# ES 2 353 159 T3

La tabla XXXVIII estipula 391 compuestos de fórmula Ial



20 donde los valores de Y, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, T<sup>a</sup>, T<sup>b</sup>, T<sup>c</sup> y T<sup>d</sup> se indican en la tabla 5.

25 TABLA 5

30  
35  
40  
45  
50  
55

Compuesto N°	Y	R <sup>1</sup>	R <sup>2</sup>	T <sup>a</sup>	T <sup>b</sup>	T <sup>c</sup>	T <sup>d</sup>
XXXVIII-1	CH <sub>2</sub>	H	H	N	CH	CH	CH
XXXVIII-2	CHMe	H	H	N	CH	CH	CH
XXXVIII-3	CHEt	H	H	N	CH	CH	CH
XXXVIII-4	CHF	H	H	N	CH	CH	CH
XXXVIII-5	C=CH <sub>2</sub>	H	H	N	CH	CH	CH
XXXVIII-6	O	H	H	N	CH	CH	CH
XXXVIII-7	S	H	H	N	CH	CH	CH
XXXVIII-8	NH	H	H	N	CH	CH	CH
XXXVIII-9	NMe	H	H	N	CH	CH	CH
XXXVIII-10	NCHO	H	H	N	CH	CH	CH
XXXVIII-11	NCOMe	H	H	N	CH	CH	CH
XXXVIII-12	CH <sub>2</sub>	Me	H	N	CH	CH	CH
XXXVIII-13	O	Me	H	N	CH	CH	CH
XXXVIII-14	CHMe	Me	H	N	CH	CH	CH
XXXVIII-15	CH <sub>2</sub>	=O		N	CH	CH	CH
XXXVIII-16	CH <sub>2</sub>	=CH <sub>2</sub>		N	CH	CH	CH

60

65

ES 2 353 159 T3

	XXXVIII-17	CH <sub>2</sub>	=CHMe		N	CH	CH	CH
	XXXVIII-18	CH <sub>2</sub>	H	H	N	CH	CF	CH
5	XXXVIII-19	CHMe	H	H	N	CH	CF	CH
	XXXVIII-20	CHEt	H	H	N	CH	CF	CH
	XXXVIII-21	CHF	H	H	N	CH	CF	CH
10	XXXVIII-22	C=CH <sub>2</sub>	H	H	N	CH	CF	CH
	XXXVIII-23	O	H	H	N	CH	CF	CH
	XXXVIII-24	S	H	H	N	CH	CF	CH
15	XXXVIII-25	NH	H	H	N	CH	CF	CH
	XXXVIII-26	NMe	H	H	N	CH	CF	CH
	XXXVIII-27	NCHO	H	H	N	CH	CF	CH
20	XXXVIII-28	NCOMe	H	H	N	CH	CF	CH
	XXXVIII-29	CH <sub>2</sub>	Me	H	N	CH	CF	CH
	XXXVIII-30	O	Me	H	N	CH	CF	CH
25	XXXVIII-31	CHMe	Me	H	N	CH	CF	CH
	XXXVIII-32	CH <sub>2</sub>	=O		N	CH	CF	CH
	XXXVIII-33	CH <sub>2</sub>	=CH <sub>2</sub>		N	CH	CF	CH
30	XXXVIII-34	CH <sub>2</sub>	=CHMe		N	CH	CF	CH
	XXXVIII-35	CH <sub>2</sub>	H	H	N	CH	CH	CF
	XXXVIII-36	CHMe	H	H	N	CH	CH	CF
35	XXXVIII-37	CHEt	H	H	N	CH	CH	CF
	XXXVIII-38	CHF	H	H	N	CH	CH	CF
	XXXVIII-39	C=CH <sub>2</sub>	H	H	N	CH	CH	CF
40	XXXVIII-40	O	H	H	N	CH	CH	CF
	XXXVIII-41	S	H	H	N	CH	CH	CF
	XXXVIII-42	NH	H	H	N	CH	CH	CF
45	XXXVIII-43	NMe	H	H	N	CH	CH	CF
	XXXVIII-44	NCHO	H	H	N	CH	CH	CF
	XXXVIII-45	NCOMe	H	H	N	CH	CH	CF
50	XXXVIII-46	CH <sub>2</sub>	Me	H	N	CH	CH	CF
	XXXVIII-47	O	Me	H	N	CH	CH	CF
	XXXVIII-48	CHMe	Me	H	N	CH	CH	CF
55	XXXVIII-49	CH <sub>2</sub>	=O		N	CH	CH	CF
	XXXVIII-50	CH <sub>2</sub>	=CH <sub>2</sub>		N	CH	CH	CF
60	XXXVIII-51	CH <sub>2</sub>	=CHMe		N	CH	CH	CF
	XXXVIII-52	CH <sub>2</sub>	H	H	CH	N	CH	CH
	XXXVIII-53	CHMe	H	H	CH	N	CH	CH
65	XXXVIII-54	CHEt	H	H	CH	N	CH	CH
	XXXVIII-55	CHF	H	H	CH	N	CH	CH

ES 2 353 159 T3

	XXXVIII-56	C=CH <sub>2</sub>	H	H	CH	N	CH	CH
5	XXXVIII-57	O	H	H	CH	N	CH	CH
	XXXVIII-58	S	H	H	CH	N	CH	CH
	XXXVIII-59	NH	H	H	CH	N	CH	CH
	XXXVIII-60	NMe	H	H	CH	N	CH	CH
10	XXXVIII-61	NCHO	H	H	CH	N	CH	CH
	XXXVIII-62	NCOMe	H	H	CH	N	CH	CH
	XXXVIII-63	CH <sub>2</sub>	Me	H	CH	N	CH	CH
15	XXXVIII-64	O	Me	H	CH	N	CH	CH
	XXXVIII-65	CHMe	Me	H	CH	N	CH	CH
	XXXVIII-66	CH <sub>2</sub>	=O		CH	N	CH	CH
20	XXXVIII-67	CH <sub>2</sub>	=CH <sub>2</sub>		CH	N	CH	CH
	XXXVIII-68	CH <sub>2</sub>	=CHMe		CH	N	CH	CH
	XXXVIII-69	CH <sub>2</sub>	H	H	CF	N	CH	CH
25	XXXVIII-70	CHMe	H	H	CF	N	CH	CH
	XXXVIII-71	CHEt	H	H	CF	N	CH	CH
	XXXVIII-72	CHF	H	H	CF	N	CH	CH
30	XXXVIII-73	C=CH <sub>2</sub>	H	H	CF	N	CH	CH
	XXXVIII-74	O	H	H	CF	N	CH	CH
	XXXVIII-75	S	H	H	CF	N	CH	CH
35	XXXVIII-76	NH	H	H	CF	N	CH	CH
	XXXVIII-77	NMe	H	H	CF	N	CH	CH
	XXXVIII-78	NCHO	H	H	CF	N	CH	CH
40	XXXVIII-79	NCOMe	H	H	CF	N	CH	CH
	XXXVIII-80	CH <sub>2</sub>	Me	H	CF	N	CH	CH
	XXXVIII-81	O	Me	H	CF	N	CH	CH
45	XXXVIII-82	CHMe	Me	H	CF	N	CH	CH
	XXXVIII-83	CH <sub>2</sub>	=O		CF	N	CH	CH
	XXXVIII-84	CH <sub>2</sub>	=CH <sub>2</sub>		CF	N	CH	CH
50	XXXVIII-85	CH <sub>2</sub>	=CHMe		CF	N	CH	CH
	XXXVIII-86	CH <sub>2</sub>	H	H	CMe	N	CH	CH
55	XXXVIII-87	CHMe	H	H	CMe	N	CH	CH
	XXXVIII-88	CHEt	H	H	CMe	N	CH	CH
	XXXVIII-89	CHF	H	H	CMe	N	CH	CH
60	XXXVIII-90	C=CH <sub>2</sub>	H	H	CMe	N	CH	CH
	XXXVIII-91	O	H	H	CMe	N	CH	CH
	XXXVIII-92	S	H	H	CMe	N	CH	CH
65	XXXVIII-93	NH	H	H	CMe	N	CH	CH
	XXXVIII-94	NMe	H	H	CMe	N	CH	CH

ES 2 353 159 T3

	XXXVIII-95	NCHO	H	H	CMe	N	CH	CH
	XXXVIII-96	NCOMe	H	H	CMe	N	CH	CH
5	XXXVIII-97	CH <sub>2</sub>	Me	H	CMe	N	CH	CH
	XXXVIII-98	O	Me	H	CMe	N	CH	CH
	XXXVIII-99	CHMe	Me	H	CMe	N	CH	CH
10	XXXVIII-100	CH <sub>2</sub>	=O		CMe	N	CH	CH
	XXXVIII-101	CH <sub>2</sub>	=CH <sub>2</sub>		CMe	N	CH	CH
	XXXVIII-102	CH <sub>2</sub>	=CHMe		CMe	N	CH	CH
15	XXXVIII-103	CH <sub>2</sub>	H	H	CH	N	CF	CH
	XXXVIII-104	CHMe	H	H	CH	N	CF	CH
	XXXVIII-105	CHEt	H	H	CH	N	CF	CH
20	XXXVIII-106	CHF	H	H	CH	N	CF	CH
	XXXVIII-107	C=CH <sub>2</sub>	H	H	CH	N	CF	CH
	XXXVIII-108	O	H	H	CH	N	CF	CH
25	XXXVIII-109	S	H	H	CH	N	CF	CH
	XXXVIII-110	NH	H	H	CH	N	CF	CH
	XXXVIII-111	NMe	H	H	CH	N	CF	CH
30	XXXVIII-112	NCHO	H	H	CH	N	CF	CH
	XXXVIII-113	NCOMe	H	H	CH	N	CF	CH
	XXXVIII-114	CH <sub>2</sub>	Me	H	CH	N	CF	CH
35	XXXVIII-115	O	Me	H	CH	N	CF	CH
	XXXVIII-116	CHMe	Me	H	CH	N	CF	CH
40	XXXVIII-117	CH <sub>2</sub>	=O		CH	N	CF	CH
	XXXVIII-118	CH <sub>2</sub>	=CH <sub>2</sub>		CH	N	CF	CH
	XXXVIII-119	CH <sub>2</sub>	=CHMe		CH	N	CF	CH
45	XXXVIII-120	CH <sub>2</sub>	H	H	CH	N	CH	CF
	XXXVIII-121	CHMe	H	H	CH	N	CH	CF
	XXXVIII-122	CHEt	H	H	CH	N	CH	CF
50	XXXVIII-123	CHF	H	H	CH	N	CH	CF
	XXXVIII-124	C=CH <sub>2</sub>	H	H	CH	N	CH	CF
	XXXVIII-125	O	H	H	CH	N	CH	CF
55	XXXVIII-126	S	H	H	CH	N	CH	CF
	XXXVIII-127	NH	H	H	CH	N	CH	CF
	XXXVIII-128	NMe	H	H	CH	N	CH	CF
60	XXXVIII-129	NCHO	H	H	CH	N	CH	CF
	XXXVIII-130	NCOMe	H	H	CH	N	CH	CF
	XXXVIII-131	CH <sub>2</sub>	Me	H	CH	N	CH	CF
65	XXXVIII-132	O	Me	H	CH	N	CH	CF
	XXXVIII-133	CHMe	Me	H	CH	N	CH	CF

## ES 2 353 159 T3

	XXXVIII-134	CH <sub>2</sub>	=O		CH	N	CH	CF
	XXXVIII-135	CH <sub>2</sub>	=CH <sub>2</sub>		CH	N	CH	CF
5	XXXVIII-136	CH <sub>2</sub>	=CHMe		CH	N	CH	CF
	XXXVIII-137	CH <sub>2</sub>	H	H	CH	CH	N	CH
	XXXVIII-138	CHMe	H	H	CH	CH	N	CH
10	XXXVIII-139	CHEt	H	H	CH	CH	N	CH
	XXXVIII-140	CHF	H	H	CH	CH	N	CH
	XXXVIII-141	C=CH <sub>2</sub>	H	H	CH	CH	N	CH
15	XXXVIII-142	O	H	H	CH	CH	N	CH
	XXXVIII-143	S	H	H	CH	CH	N	CH
	XXXVIII-144	NH	H	H	CH	CH	N	CH
20	XXXVIII-145	NMe	H	H	CH	CH	N	CH
	XXXVIII-146	NCHO	H	H	CH	CH	N	CH
	XXXVIII-147	NCOMe	H	H	CH	CH	N	CH
25	XXXVIII-148	CH <sub>2</sub>	Me	H	CH	CH	N	CH
	XXXVIII-149	O	Me	H	CH	CH	N	CH
	XXXVIII-150	CHMe	Me	H	CH	CH	N	CH
30	XXXVIII-151	CH <sub>2</sub>	=O		CH	CH	N	CH
	XXXVIII-152	CH <sub>2</sub>	=CH <sub>2</sub>		CH	CH	N	CH
	XXXVIII-153	CH <sub>2</sub>	=CHMe		CH	CH	N	CH
35	XXXVIII-154	CH <sub>2</sub>	H	H	CF	CH	N	CH
	XXXVIII-155	CHMe	H	H	CF	CH	N	CH
	XXXVIII-156	CHEt	H	H	CF	CH	N	CH
40	XXXVIII-157	CHF	H	H	CF	CH	N	CH
	XXXVIII-158	C=CH <sub>2</sub>	H	H	CF	CH	N	CH
	XXXVIII-159	O	H	H	CF	CH	N	CH
45	XXXVIII-160	S	H	H	CF	CH	N	CH
	XXXVIII-161	NH	H	H	CF	CH	N	CH
	XXXVIII-162	NMe	H	H	CF	CH	N	CH
50	XXXVIII-163	NCHO	H	H	CF	CH	N	CH
	XXXVIII-164	NCOMe	H	H	CF	CH	N	CH
	XXXVIII-165	CH <sub>2</sub>	Me	H	CF	CH	N	CH
55	XXXVIII-166	O	Me	H	CF	CH	N	CH
	XXXVIII-167	CHMe	Me	H	CF	CH	N	CH
60	XXXVIII-168	CH <sub>2</sub>	=O		CF	CH	N	CH
	XXXVIII-169	CH <sub>2</sub>	=CH <sub>2</sub>		CF	CH	N	CH
	XXXVIII-170	CH <sub>2</sub>	=CHMe		CF	CH	N	CH
65	XXXVIII-171	CH <sub>2</sub>	H	H	CMe	CH	N	CH
	XXXVIII-172	CHMe	H	H	CMe	CH	N	CH

ES 2 353 159 T3

	XXXVIII-173	CHEt	H	H	CMe	CH	N	CH
	XXXVIII-174	CHF	H	H	CMe	CH	N	CH
5	XXXVIII-175	C=CH <sub>2</sub>	H	H	CMe	CH	N	CH
	XXXVIII-176	O	H	H	CMe	CH	N	CH
	XXXVIII-177	S	H	H	CMe	CH	N	CH
10	XXXVIII-178	NH	H	H	CMe	CH	N	CH
	XXXVIII-179	NMe	H	H	CMe	CH	N	CH
	XXXVIII-180	NCHO	H	H	CMe	CH	N	CH
15	XXXVIII-181	NCOMe	H	H	CMe	CH	N	CH
	XXXVIII-182	CH <sub>2</sub>	Me	H	CMe	CH	N	CH
	XXXVIII-183	O	Me	H	CMe	CH	N	CH
20	XXXVIII-184	CHMe	Me	H	CMe	CH	N	CH
	XXXVIII-185	CH <sub>2</sub>	=O		CMe	CH	N	CH
	XXXVIII-186	CH <sub>2</sub>	=CH <sub>2</sub>		CMe	CH	N	CH
25	XXXVIII-187	CH <sub>2</sub>	=CHMe		CMe	CH	N	CH
	XXXVIII-188	CH <sub>2</sub>	H	H	CH	CH	N	CF
	XXXVIII-189	CHMe	H	H	CH	CH	N	CF
30	XXXVIII-190	CHEt	H	H	CH	CH	N	CF
	XXXVIII-191	CHF	H	H	CH	CH	N	CF
	XXXVIII-192	C=CH <sub>2</sub>	H	H	CH	CH	N	CF
35	XXXVIII-193	O	H	H	CH	CH	N	CF
	XXXVIII-194	S	H	H	CH	CH	N	CF
	XXXVIII-195	NH	H	H	CH	CH	N	CF
40	XXXVIII-196	NMe	H	H	CH	CH	N	CF
	XXXVIII-197	NCHO	H	H	CH	CH	N	CF
	XXXVIII-198	NCOMe	H	H	CH	CH	N	CF
45	XXXVIII-199	CH <sub>2</sub>	Me	H	CH	CH	N	CF
	XXXVIII-200	O	Me	H	CH	CH	N	CF
	XXXVIII-201	CHMe	Me	H	CH	CH	N	CF
50	XXXVIII-202	CH <sub>2</sub>	=O		CH	CH	N	CF
	XXXVIII-203	CH <sub>2</sub>	=CH <sub>2</sub>		CH	CH	N	CF
	XXXVIII-204	CH <sub>2</sub>	=CHMe		CH	CH	N	CF
55	XXXVIII-205	CH <sub>2</sub>	H	H	CH	CH	CH	N
	XXXVIII-206	CHMe	H	H	CH	CH	CH	N
	XXXVIII-207	CHEt	H	H	CH	CH	CH	N
60	XXXVIII-208	CHF	H	H	CH	CH	CH	N
	XXXVIII-209	C=CH <sub>2</sub>	H	H	CH	CH	CH	N
	XXXVIII-210	O	H	H	CH	CH	CH	N
65	XXXVIII-211	S	H	H	CH	CH	CH	N

ES 2 353 159 T3

	XXXVIII-212	NH	H	H	CH	CH	CH	N
	XXXVIII-213	NMe	H	H	CH	CH	CH	N
5	XXXVIII-214	NCHO	H	H	CH	CH	CH	N
	XXXVIII-215	NCOMe	H	H	CH	CH	CH	N
	XXXVIII-216	CH <sub>2</sub>	Me	H	CH	CH	CH	N
10	XXXVIII-217	O	Me	H	CH	CH	CH	N
	XXXVIII-218	CHMe	Me	H	CH	CH	CH	N
	XXXVIII-219	CH <sub>2</sub>	=O		CH	CH	CH	N
15	XXXVIII-220	CH <sub>2</sub>	=CH <sub>2</sub>		CH	CH	CH	N
	XXXVIII-221	CH <sub>2</sub>	=CHMe		CH	CH	CH	N
	XXXVIII-222	CH <sub>2</sub>	H	H	CF	CH	CH	N
20	XXXVIII-223	CHMe	H	H	CF	CH	CH	N
	XXXVIII-224	CHEt	H	H	CF	CH	CH	N
	XXXVIII-225	CHF	H	H	CF	CH	CH	N
25	XXXVIII-226	C=CH <sub>2</sub>	H	H	CF	CH	CH	N
	XXXVIII-227	O	H	H	CF	CH	CH	N
	XXXVIII-228	S	H	H	CF	CH	CH	N
30	XXXVIII-229	NH	H	H	CF	CH	CH	N
	XXXVIII-230	NMe	H	H	CF	CH	CH	N
	XXXVIII-231	NCHO	H	H	CF	CH	CH	N
35	XXXVIII-232	NCOMe	H	H	CF	CH	CH	N
	XXXVIII-233	CH <sub>2</sub>	Me	H	CF	CH	CH	N
	XXXVIII-234	O	Me	H	CF	CH	CH	N
40	XXXVIII-235	CHMe	Me	H	CF	CH	CH	N
	XXXVIII-236	CH <sub>2</sub>	=O		CF	CH	CH	N
	XXXVIII-237	CH <sub>2</sub>	=CH <sub>2</sub>		CF	CH	CH	N
45	XXXVIII-238	CH <sub>2</sub>	=CHMe		CF	CH	CH	N
	XXXVIII-239	CH <sub>2</sub>	H	H	CMe	CH	CH	N
50	XXXVIII-240	CHMe	H	H	CMe	CH	CH	N
	XXXVIII-241	CHEt	H	H	CMe	CH	CH	N
	XXXVIII-242	CHF	H	H	CMe	CH	CH	N
55	XXXVIII-243	C=CH <sub>2</sub>	H	H	CMe	CH	CH	N
	XXXVIII-244	O	H	H	CMe	CH	CH	N
	XXXVIII-245	S	H	H	CMe	CH	CH	N
60	XXXVIII-246	NH	H	H	CMe	CH	CH	N
	XXXVIII-247	NMe	H	H	CMe	CH	CH	N
	XXXVIII-248	NCHO	H	H	CMe	CH	CH	N
65	XXXVIII-249	NCOMe	H	H	CMe	CH	CH	N
	XXXVIII-250	CH <sub>2</sub>	Me	H	CMe	CH	CH	N

ES 2 353 159 T3

	XXXVIII-251	O	Me	H	CMe	CH	CH	N
	XXXVIII-252	CHMe	Me	H	CMe	CH	CH	N
5	XXXVIII-253	CH <sub>2</sub>	=O		CMe	CH	CH	N
	XXXVIII-254	CH <sub>2</sub>	=CH <sub>2</sub>		CMe	CH	CH	N
	XXXVIII-255	CH <sub>2</sub>	=CHMe		CMe	CH	CH	N
10	XXXVIII-256	CH <sub>2</sub>	H	H	CH	CH	CF	N
	XXXVIII-257	CHMe	H	H	CH	CH	CF	N
	XXXVIII-258	CHet	H	H	CH	CH	CF	N
15	XXXVIII-259	CHF	H	H	CH	CH	CF	N
	XXXVIII-260	C=CH <sub>2</sub>	H	H	CH	CH	CF	N
	XXXVIII-261	O	H	H	CH	CH	CF	N
20	XXXVIII-262	S	H	H	CH	CH	CF	N
	XXXVIII-263	NH	H	H	CH	CH	CF	N
	XXXVIII-264	NMe	H	H	CH	CH	CF	N
25	XXXVIII-265	NCHO	H	H	CH	CH	CF	N
	XXXVIII-266	NCOMe	H	H	CH	CH	CF	N
	XXXVIII-267	CH <sub>2</sub>	Me	H	CH	CH	CF	N
30	XXXVIII-268	O	Me	H	CH	CH	CF	N
	XXXVIII-269	CHMe	Me	H	CH	CH	CF	N
	XXXVIII-270	CH <sub>2</sub>	=O		CH	CH	CF	N
35	XXXVIII-271	CH <sub>2</sub>	=CH <sub>2</sub>		CH	CH	CF	N
	XXXVIII-272	CH <sub>2</sub>	=CHMe		CH	CH	CF	N
	XXXVIII-273	CH <sub>2</sub>	H	H	N	CH	N	CH
40	XXXVIII-274	CHMe	H	H	N	CH	N	CH
	XXXVIII-275	CHet	H	H	N	CH	N	CH
	XXXVIII-276	CHF	H	H	N	CH	N	CH
45	XXXVIII-277	C=CH <sub>2</sub>	H	H	N	CH	N	CH
	XXXVIII-278	O	H	H	N	CH	N	CH
	XXXVIII-279	S	H	H	N	CH	N	CH
50	XXXVIII-280	NH	H	H	N	CH	N	CH
	XXXVIII-281	NMe	H	H	N	CH	N	CH
	XXXVIII-282	NCHO	H	H	N	CH	N	CH
55	XXXVIII-283	NCOMe	H	H	N	CH	N	CH
	XXXVIII-284	CH <sub>2</sub>	Me	H	N	CH	N	CH
	XXXVIII-285	O	Me	H	N	CH	N	CH
60	XXXVIII-286	CHMe	Me	H	N	CH	N	CH
	XXXVIII-287	CH <sub>2</sub>	=O		N	CH	N	CH
	XXXVIII-288	CH <sub>2</sub>	=CH <sub>2</sub>		N	CH	N	CH
65	XXXVIII-289	CH <sub>2</sub>	=CHMe		N	CH	N	CH

ES 2 353 159 T3

	XXXVIII-290	CH <sub>2</sub>	H	H	N	CH	N	CF
	XXXVIII-291	CHMe	H	H	N	CH	N	CF
5	XXXVIII-292	CHEt	H	H	N	CH	N	CF
	XXXVIII-293	CHF	H	H	N	CH	N	CF
	XXXVIII-294	C=CH <sub>2</sub>	H	H	N	CH	N	CF
10	XXXVIII-295	O	H	H	N	CH	N	CF
	XXXVIII-296	S	H	H	N	CH	N	CF
	XXXVIII-297	NH	H	H	N	CH	N	CF
15	XXXVIII-298	NMe	H	H	N	CH	N	CF
	XXXVIII-299	NCHO	H	H	N	CH	N	CF
	XXXVIII-300	NCOMe	H	H	N	CH	N	CF
20	XXXVIII-301	CH <sub>2</sub>	Me	H	N	CH	N	CF
	XXXVIII-302	O	Me	H	N	CH	N	CF
	XXXVIII-303	CHMe	Me	H	N	CH	N	CF
25	XXXVIII-304	CH <sub>2</sub>	=O		N	CH	N	CF
	XXXVIII-305	CH <sub>2</sub>	=CH <sub>2</sub>		N	CH	N	CF
	XXXVIII-306	CH <sub>2</sub>	=CHMe		N	CH	N	CF
30	XXXVIII-307	CH <sub>2</sub>	H	H	N	N	CH	CH
	XXXVIII-308	CHMe	H	H	N	N	CH	CH
	XXXVIII-309	CHEt	H	H	N	N	CH	CH
35	XXXVIII-310	CHF	H	H	N	N	CH	CH
	XXXVIII-311	C=CH <sub>2</sub>	H	H	N	N	CH	CH
	XXXVIII-312	O	H	H	N	N	CH	CH
40	XXXVIII-313	S	H	H	N	N	CH	CH
	XXXVIII-314	NH	H	H	N	N	CH	CH
	XXXVIII-315	NMe	H	H	N	N	CH	CH
45	XXXVIII-316	NCHO	H	H	N	N	CH	CH
	XXXVIII-317	NCOMe	H	H	N	N	CH	CH
	XXXVIII-318	CH <sub>2</sub>	Me	H	N	N	CH	CH
50	XXXVIII-319	O	Me	H	N	N	CH	CH
	XXXVIII-320	CHMe	Me	H	N	N	CH	CH
	XXXVIII-321	CH <sub>2</sub>	=O		N	N	CH	CH
55	XXXVIII-322	CH <sub>2</sub>	=CH <sub>2</sub>		N	N	CH	CH
	XXXVIII-323	CH <sub>2</sub>	=CHMe		N	N	CH	CH
60	XXXVIII-324	CH <sub>2</sub>	H	H	N	N	CF	CH
	XXXVIII-325	CHMe	H	H	N	N	CF	CH
	XXXVIII-326	CHEt	H	H	N	N	CF	CH
	XXXVIII-327	CHF	H	H	N	N	CF	CH
65	XXXVIII-328	C=CH <sub>2</sub>	H	H	N	N	CF	CH

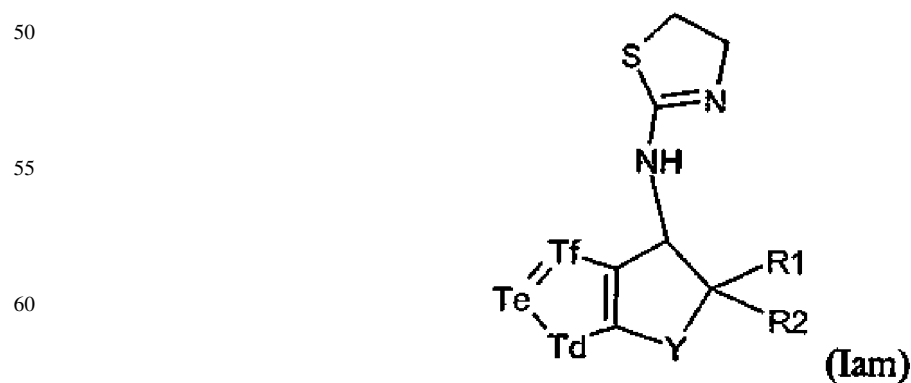
ES 2 353 159 T3

	XXXVIII-329	O	H	H	N	N	CF	CH
	XXXVIII-330	S	H	H	N	N	CF	CH
5	XXXVIII-331	NH	H	H	N	N	CF	CH
	XXXVIII-332	NMe	H	H	N	N	CF	CH
	XXXVIII-333	NCHO	H	H	N	N	CF	CH
10	XXXVIII-334	NCOMe	H	H	N	N	CF	CH
	XXXVIII-335	CH <sub>2</sub>	Me	H	N	N	CF	CH
	XXXVIII-336	O	Me	H	N	N	CF	CH
15	XXXVIII-337	CHMe	Me	H	N	N	CF	CH
	XXXVIII-338	CH <sub>2</sub>	=O		N	N	CF	CH
	XXXVIII-339	CH <sub>2</sub>	=CH <sub>2</sub>		N	N	CF	CH
20	XXXVIII-340	CH <sub>2</sub>	=CHMe		N	N	CF	CH
	XXXVIII-341	CH <sub>2</sub>	H	H	N	N	CH	CF
	XXXVIII-342	CHMe	H	H	N	N	CH	CF
25	XXXVIII-343	CH <sub>2</sub> Et	H	H	N	N	CH	CF
	XXXVIII-344	CHF	H	H	N	N	CH	CF
	XXXVIII-345	C=CH <sub>2</sub>	H	H	N	N	CH	CF
30	XXXVIII-346	O	H	H	N	N	CH	CF
	XXXVIII-347	S	H	H	N	N	CH	CF
	XXXVIII-348	NH	H	H	N	N	CH	CF
35	XXXVIII-349	NMe	H	H	N	N	CH	CF
	XXXVIII-350	NCHO	H	H	N	N	CH	CF
	XXXVIII-351	NCOMe	H	H	N	N	CH	CF
40	XXXVIII-352	CH <sub>2</sub>	Me	H	N	N	CH	CF
	XXXVIII-353	O	Me	H	N	N	CH	CF
	XXXVIII-354	CHMe	Me	H	N	N	CH	CF
45	XXXVIII-355	CH <sub>2</sub>	=O		N	N	CH	CF
	XXXVIII-356	CH <sub>2</sub>	=CH <sub>2</sub>		N	N	CH	CF
	XXXVIII-357	CH <sub>2</sub>	=CHMe		N	N	CH	CF
50	XXXVIII-358	CH <sub>2</sub>	H	H	N	CH	CH	N
	XXXVIII-359	CHMe	H	H	N	CH	CH	N
55	XXXVIII-360	CH <sub>2</sub> Et	H	H	N	CH	CH	N
	XXXVIII-361	CHF	H	H	N	CH	CH	N
	XXXVIII-362	C=CH <sub>2</sub>	H	H	N	CH	CH	N
60	XXXVIII-363	O	H	H	N	CH	CH	N
	XXXVIII-364	S	H	H	N	CH	CH	N
	XXXVIII-365	NH	H	H	N	CH	CH	N
65	XXXVIII-366	NMe	H	H	N	CH	CH	N
	XXXVIII-367	NCHO	H	H	N	CH	CH	N

ES 2 353 159 T3

5	XXXVIII-368	NCOMe	H	H	N	CH	CH	N
	XXXVIII-369	CH <sub>2</sub>	Me	H	N	CH	CH	N
	XXXVIII-370	O	Me	H	N	CH	CH	N
	XXXVIII-371	CHMe	Me	H	N	CH	CH	N
10	XXXVIII-372	CH <sub>2</sub>	=O		N	CH	CH	N
	XXXVIII-373	CH <sub>2</sub>	=CH <sub>2</sub>		N	CH	CH	N
	XXXVIII-374	CH <sub>2</sub>	=CHMe		N	CH	CH	N
15	XXXVIII-375	CH <sub>2</sub>	H	H	CH	N	CH	N
	XXXVIII-376	CHMe	H	H	CH	N	CH	N
	XXXVIII-377	CHEt	H	H	CH	N	CH	N
20	XXXVIII-378	CHF	H	H	CH	N	CH	N
	XXXVIII-379	C=CH <sub>2</sub>	H	H	CH	N	CH	N
	XXXVIII-380	O	H	H	CH	N	CH	N
25	XXXVIII-381	S	H	H	CH	N	CH	N
	XXXVIII-382	NH	H	H	CH	N	CH	N
	XXXVIII-383	NMe	H	H	CH	N	CH	N
30	XXXVIII-384	NCHO	H	H	CH	N	CH	N
	XXXVIII-385	NCOMe	H	H	CH	N	CH	N
	XXXVIII-386	CH <sub>2</sub>	Me	H	CH	N	CH	N
35	XXXVIII-387	O	Me	H	CH	N	CH	N
	XXXVIII-388	CHMe	Me	H	CH	N	CH	N
	XXXVIII-389	CH <sub>2</sub>	=O		CH	N	CH	N
40	XXXVIII-390	CH <sub>2</sub>	=CH <sub>2</sub>		CH	N	CH	N
	XXXVIII-391	CH <sub>2</sub>	=CHMe		CH	N	CH	N

45 La tabla XXXIX estipula 578 compuestos de fórmula Iam



donde los valores de Y, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, T<sup>d</sup>, T<sup>e</sup> y T<sup>f</sup> se indican en la tabla 6.

## ES 2 353 159 T3

TABLA 6

Compuesto N°	Y	R1	R2	Td	Te	Tf
XXXIX-1	CH <sub>2</sub>	H	H	NH	CH	CH
XXXIX-2	CHMe	H	H	NH	CH	CH
XXXIX-3	CHEt	H	H	NH	CH	CH
XXXIX-4	CHF	H	H	NH	CH	CH
XXXIX-5	C=CH <sub>2</sub>	H	H	NH	CH	CH
XXXIX-6	O	H	H	NH	CH	CH
XXXIX-7	S	H	H	NH	CH	CH
XXXIX-8	NH	H	H	NH	CH	CH
XXXIX-9	NMe	H	H	NH	CH	CH
XXXIX-10	NCHO	H	H	NH	CH	CH
XXXIX-11	NCOMe	H	H	NH	CH	CH
XXXIX-12	CH <sub>2</sub>	Me	H	NH	CH	CH
XXXIX-13	O	Me	H	NH	CH	CH
XXXIX-14	CHMe	Me	H	NH	CH	CH
XXXIX-15	CH <sub>2</sub>		=O	NH	CH	CH
XXXIX-16	CH <sub>2</sub>		=CH <sub>2</sub>	NH	CH	CH
XXXIX-17	CH <sub>2</sub>		=CHMe	NH	CH	CH
XXXIX-18	CH <sub>2</sub>	H	H	NH	CF	CH
XXXIX-19	CHMe	H	H	NH	CF	CH
XXXIX-20	CHEt	H	H	NH	CF	CH
XXXIX-21	CHF	H	H	NH	CF	CH
XXXIX-22	C=CH <sub>2</sub>	H	H	NH	CF	CH
XXXIX-23	O	H	H	NH	CF	CH
XXXIX-24	S	H	H	NH	CF	CH
XXXIX-25	NH	H	H	NH	CF	CH
XXXIX-26	NMe	H	H	NH	CF	CH
XXXIX-27	NCHO	H	H	NH	CF	CH
XXXIX-28	NCOMe	H	H	NH	CF	CH
XXXIX-29	CH <sub>2</sub>	Me	H	NH	CF	CH
XXXIX-30	O	Me	H	NH	CF	CH
XXXIX-31	CHMe	Me	H	NH	CF	CH
XXXIX-32	CH <sub>2</sub>		=O	NH	CF	CH
XXXIX-33	CH <sub>2</sub>		=CH <sub>2</sub>	NH	CF	CH
XXXIX-34	CH <sub>2</sub>		=CHMe	NH	CF	CH
XXXIX-35	CH <sub>2</sub>	H	H	NH	CMe	CH
XXXIX-36	CHMe	H	H	NH	CMe	CH
XXXIX-37	CHEt	H	H	NH	CMe	CH
XXXIX-38	CHF	H	H	NH	CMe	CH
XXXIX-39	C=CH <sub>2</sub>	H	H	NH	CMe	CH
XXXIX-40	O	H	H	NH	CMe	CH
XXXIX-41	S	H	H	NH	CMe	CH
XXXIX-42	NH	H	H	NH	CMe	CH
XXXIX-43	NMe	H	H	NH	CMe	CH
XXXIX-44	NCHO	H	H	NH	CMe	CH
XXXIX-45	NCOMe	H	H	NH	CMe	CH

## ES 2 353 159 T3

Compuesto N°	Y	R1	R2	Td	Te	Tf
XXXXIX-46	CH <sub>2</sub>	Me	H	NH	CMe	CH
XXXXIX-47	O	Me	H	NH	CMe	CH
XXXXIX-48	CHMe	Me	H	NH	CMe	CH
XXXXIX-49	CH <sub>2</sub>		=O	NH	CMe	CH
XXXXIX-50	CH <sub>2</sub>		=CH <sub>2</sub>	NH	CMe	CH
XXXXIX-51	CH <sub>2</sub>		=CHMe	NH	CMe	CH
XXXXIX-52	CH <sub>2</sub>	H	H	NH	CH	CMe
XXXXIX-53	CHMe	H	H	NH	CH	CMe
XXXXIX-54	CHEt	H	H	NH	CH	CMe
XXXXIX-55	CHF	H	H	NH	CH	CMe
XXXXIX-56	C=CH <sub>2</sub>	H	H	NH	CH	CMe
XXXXIX-57	O	H	H	NH	CH	CMe
XXXXIX-58	S	H	H	NH	CH	CMe
XXXXIX-59	NH	H	H	NH	CH	CMe
XXXXIX-60	NMe	H	H	NH	CH	CMe
XXXXIX-61	NCHO	H	H	NH	CH	CMe
XXXXIX-62	NCOMe	H	H	NH	CH	CMe
XXXXIX-63	CH <sub>2</sub>	Me	H	NH	CH	CMe
XXXXIX-64	O	Me	H	NH	CH	CMe
XXXXIX-65	CHMe	Me	H	NH	CH	CMe
XXXXIX-66	CH <sub>2</sub>		=O	NH	CH	CMe
XXXXIX-67	CH <sub>2</sub>		=CH <sub>2</sub>	NH	CH	CMe
XXXXIX-68	CH <sub>2</sub>		=CHMe	NH	CH	CMe
XXXXIX-69	CH <sub>2</sub>	H	H	NMe	CH	CH
XXXXIX-70	CHMe	H	H	NMe	CH	CH
XXXXIX-71	CHEt	H	H	NMe	CH	CH
XXXXIX-72	CHF	H	H	NMe	CH	CH
XXXXIX-73	C=CH <sub>2</sub>	H	H	NMe	CH	CH
XXXXIX-74	O	H	H	NMe	CH	CH
XXXXIX-75	S	H	H	NMe	CH	CH
XXXXIX-76	NH	H	H	NMe	CH	CH
XXXXIX-77	NMe	H	H	NMe	CH	CH
XXXXIX-78	NCHO	H	H	NMe	CH	CH
XXXXIX-79	NCOMe	H	H	NMe	CH	CH
XXXXIX-80	CH <sub>2</sub>	Me	H	NMe	CH	CH
XXXXIX-81	O	Me	H	NMe	CH	CH
XXXXIX-82	CHMe	Me	H	NMe	CH	CH
XXXXIX-83	CH <sub>2</sub>		=O	NMe	CH	CH
XXXXIX-84	CH <sub>2</sub>		=CH <sub>2</sub>	NMe	CH	CH
XXXXIX-85	CH <sub>2</sub>		=CHMe	NMe	CH	CH
XXXXIX-86	CH <sub>2</sub>	H	H	NMe	CF	CH
XXXXIX-87	CHMe	H	H	NMe	CF	CH
XXXXIX-88	CHEt	H	H	NMe	CF	CH
XXXXIX-89	CHF	H	H	NMe	CF	CH
XXXXIX-90	C=CH <sub>2</sub>	H	H	NMe	CF	CH
XXXXIX-91	O	H	H	NMe	CF	CH
XXXXIX-92	S	H	H	NMe	CF	CH

65

## ES 2 353 159 T3

Compuesto N°	Y	R1	R2	Td	Te	Tf	
5	XXXXIX-93	NH	H	H	NMe	CF	CH
	XXXXIX-94	NMe	H	H	NMe	CF	CH
	XXXXIX-95	NCHO	H	H	NMe	CF	CH
	XXXXIX-96	NCOMe	H	H	NMe	CF	CH
10	XXXXIX-97	CH <sub>2</sub>	Me	H	NMe	CF	CH
	XXXXIX-98	O	Me	H	NMe	CF	CH
	XXXXIX-99	CHMe	Me	H	NMe	CF	CH
	XXXXIX-100	CH <sub>2</sub>		=O	NMe	CF	CH
15	XXXXIX-101	CH <sub>2</sub>		=CH <sub>2</sub>	NMe	CF	CH
	XXXXIX-102	CH <sub>2</sub>		=CHMe	NMe	CF	CH
	XXXXIX-103	CH <sub>2</sub>	H	H	NMe	CMe	CH
	XXXXIX-104	CHMe	H	H	NMe	CMe	CH
20	XXXXIX-105	CHCl	H	H	NMe	CMe	CH
	XXXXIX-106	CHF	H	H	NMe	CMe	CH
	XXXXIX-107	C=CH <sub>2</sub>	H	H	NMe	CMe	CH
	XXXXIX-108	O	H	H	NMe	CMe	CH
25	XXXXIX-109	S	H	H	NMe	CMe	CH
	XXXXIX-110	NH	H	H	NMe	CMe	CH
	XXXXIX-111	NMe	H	H	NMe	CMe	CH
	XXXXIX-112	NCHO	H	H	NMe	CMe	CH
30	XXXXIX-113	NCOMe	H	H	NMe	CMe	CH
	XXXXIX-114	CH <sub>2</sub>	Me	H	NMe	CMe	CH
	XXXXIX-115	O	Me	H	NMe	CMe	CH
	XXXXIX-116	CHMe	Me	H	NMe	CMe	CH
35	XXXXIX-117	CH <sub>2</sub>		=O	NMe	CMe	CH
	XXXXIX-118	CH <sub>2</sub>		=CH <sub>2</sub>	NMe	CMe	CH
	XXXXIX-119	CH <sub>2</sub>		=CHMe	NMe	CMe	CH
40	XXXXIX-120	CH <sub>2</sub>	H	H	NMe	CH	CMe
	XXXXIX-121	CHMe	H	H	NMe	CH	CMe
	XXXXIX-122	CHCl	H	H	NMe	CH	CMe
	XXXXIX-123	CHF	H	H	NMe	CH	CMe
45	XXXXIX-124	C=CH <sub>2</sub>	H	H	NMe	CH	CMe
	XXXXIX-125	O	H	H	NMe	CH	CMe
	XXXXIX-126	S	H	H	NMe	CH	CMe
	XXXXIX-127	NH	H	H	NMe	CH	CMe
50	XXXXIX-128	NMe	H	H	NMe	CH	CMe
	XXXXIX-129	NCHO	H	H	NMe	CH	CMe
	XXXXIX-130	NCOMe	H	H	NMe	CH	CMe
	XXXXIX-131	CH <sub>2</sub>	Me	H	NMe	CH	CMe
55	XXXXIX-132	O	Me	H	NMe	CH	CMe
	XXXXIX-133	CHMe	Me	H	NMe	CH	CMe
	XXXXIX-134	CH <sub>2</sub>		=O	NMe	CH	CMe
	XXXXIX-135	CH <sub>2</sub>		=CH <sub>2</sub>	NMe	CH	CMe
60	XXXXIX-136	CH <sub>2</sub>		=CHMe	NMe	CH	CMe
	XXXXIX-137	CH <sub>2</sub>	H	H	O	CH	CH
	XXXXIX-138	CHMe	H	H	O	CH	CH
	XXXXIX-139	CHCl	H	H	O	CH	CH
65							

## ES 2 353 159 T3

Compuesto N°	Y	R1	R2	Td	Ta	Tf	
5	XXXIX-140	CHF	H	H	O	CH	CH
	XXXIX-141	C=CH <sub>2</sub>	H	H	O	CH	CH
	XXXIX-142	O	H	H	O	CH	CH
	XXXIX-143	S	H	H	O	CH	CH
10	XXXIX-144	NH	H	H	O	CH	CH
	XXXIX-145	NMe	H	H	O	CH	CH
	XXXIX-146	NCHO	H	H	O	CH	CH
	XXXIX-147	NCOMe	H	H	O	CH	CH
15	XXXIX-148	CH <sub>2</sub>	Me	H	O	CH	CH
	XXXIX-149	O	Me	H	O	CH	CH
	XXXIX-150	CHMe	Me	H	O	CH	CH
20	XXXIX-151	CH <sub>2</sub>		=O	O	CH	CH
	XXXIX-152	CH <sub>2</sub>		=CH <sub>2</sub>	O	CH	CH
	XXXIX-153	CH <sub>2</sub>		=CHMe	O	CH	CH
	XXXIX-154	CH <sub>2</sub>	H	H	O	CF	CH
	XXXIX-155	CHMe	H	H	O	CF	CH
25	XXXIX-156	CHEt	H	H	O	CF	CH
	XXXIX-157	CHF	H	H	O	CF	CH
	XXXIX-158	C=CH <sub>2</sub>	H	H	O	CF	CH
30	XXXIX-159	O	H	H	O	CF	CH
	XXXIX-160	S	H	H	O	CF	CH
	XXXIX-161	NH	H	H	O	CF	CH
	XXXIX-162	NMe	H	H	O	CF	CH
35	XXXIX-163	NCHO	H	H	O	CF	CH
	XXXIX-164	NCOMe	H	H	O	CF	CH
	XXXIX-165	CH <sub>2</sub>	Me	H	O	CF	CH
	XXXIX-166	O	Me	H	O	CF	CH
40	XXXIX-167	CHMe	Me	H	O	CF	CH
	XXXIX-168	CH <sub>2</sub>		=O	O	CF	CH
	XXXIX-169	CH <sub>2</sub>		=CH <sub>2</sub>	O	CF	CH
	XXXIX-170	CH <sub>2</sub>		=CHMe	O	CF	CH
45	XXXIX-171	CH <sub>2</sub>	H	H	O	CMe	CH
	XXXIX-172	CHMe	H	H	O	CMe	CH
	XXXIX-173	CHEt	H	H	O	CMe	CH
	XXXIX-174	CHF	H	H	O	CMe	CH
50	XXXIX-175	C=CH <sub>2</sub>	H	H	O	CMe	CH
	XXXIX-176	O	H	H	O	CMe	CH
	XXXIX-177	S	H	H	O	CMe	CH
	XXXIX-178	NH	H	H	O	CMe	CH
55	XXXIX-179	NMe	H	H	O	CMe	CH
	XXXIX-180	NCHO	H	H	O	CMe	CH
	XXXIX-181	NCOMe	H	H	O	CMe	CH
	XXXIX-182	CH <sub>2</sub>	Me	H	O	CMe	CH
60	XXXIX-183	O	Me	H	O	CMe	CH
	XXXIX-184	CHMe	Me	H	O	CMe	CH
	XXXIX-185	CH <sub>2</sub>		=O	O	CMe	CH
65	XXXIX-186	CH <sub>2</sub>		=CH <sub>2</sub>	O	CMe	CH

## ES 2 353 159 T3

Compuesto N°	Y	R1	R2	Td	Te	Tf
5	XXXIX-187	CH <sub>2</sub>	=CHMe	O	OMe	CH
	XXXIX-188	CH <sub>2</sub>	H	O	CH	OMe
	XXXIX-189	CHMe	H	O	CH	OMe
	XXXIX-190	CHEt	H	O	CH	OMe
10	XXXIX-191	CHF	H	O	CH	OMe
	XXXIX-192	C=CH <sub>2</sub>	H	O	CH	OMe
	XXXIX-193	O	H	O	CH	OMe
	XXXIX-194	S	H	O	CH	OMe
15	XXXIX-195	NH	H	O	CH	OMe
	XXXIX-196	NMe	H	O	CH	OMe
	XXXIX-197	NCHO	H	O	CH	OMe
	XXXIX-198	NCOMe	H	O	CH	OMe
20	XXXIX-199	CH <sub>2</sub>	Me	O	CH	OMe
	XXXIX-200	O	Me	O	CH	OMe
	XXXIX-201	CHMe	Me	O	CH	OMe
25	XXXIX-202	CH <sub>2</sub>	=O	O	CH	OMe
	XXXIX-203	CH <sub>2</sub>	=CH <sub>2</sub>	O	CH	OMe
	XXXIX-204	CH <sub>2</sub>	=CHMe	O	CH	OMe
	XXXIX-205	CH <sub>2</sub>	H	S	CH	CH
30	XXXIX-206	CHMe	H	S	CH	CH
	XXXIX-207	CHEt	H	S	CH	CH
	XXXIX-208	CHF	H	S	CH	CH
	XXXIX-209	C=CH <sub>2</sub>	H	S	CH	CH
35	XXXIX-210	O	H	S	CH	CH
	XXXIX-211	S	H	S	CH	CH
	XXXIX-212	NH	H	S	CH	CH
	XXXIX-213	NMe	H	S	CH	CH
40	XXXIX-214	NCHO	H	S	CH	CH
	XXXIX-215	NCOMe	H	S	CH	CH
	XXXIX-216	CH <sub>2</sub>	Me	S	CH	CH
	XXXIX-217	O	Me	S	CH	CH
45	XXXIX-218	CHMe	Me	S	CH	CH
	XXXIX-219	CH <sub>2</sub>	=O	S	CH	CH
	XXXIX-220	CH <sub>2</sub>	=CH <sub>2</sub>	S	CH	CH
	XXXIX-221	CH <sub>2</sub>	=CHMe	S	CH	CH
50	XXXIX-222	CH <sub>2</sub>	H	S	CF	CH
	XXXIX-223	CHMe	H	S	CF	CH
	XXXIX-224	CHEt	H	S	CF	CH
	XXXIX-225	CHF	H	S	CF	CH
55	XXXIX-226	C=CH <sub>2</sub>	H	S	CF	CH
	XXXIX-227	O	H	S	CF	CH
	XXXIX-228	S	H	S	CF	CH
	XXXIX-229	NH	H	S	CF	CH
60	XXXIX-230	NMe	H	S	CF	CH
	XXXIX-231	NCHO	H	S	CF	CH
	XXXIX-232	NCOMe	H	S	CF	CH
65	XXXIX-233	CH <sub>2</sub>	Me	S	CF	CH

## ES 2 353 159 T3

Compuesto N°	Y	R1	R2	Td	Te	Tf
5 XXXIX-234	O	Me	H	S	CF	CH
XXXIX-235	CHMe	Me	H	S	CF	CH
XXXIX-236	CH <sub>2</sub>		=O	S	CF	CH
XXXIX-237	CH <sub>2</sub>		=CH <sub>2</sub>	S	CF	CH
10 XXXIX-238	CH <sub>2</sub>		=CHMe	S	CF	CH
XXXIX-239	CH <sub>2</sub>	H	H	S	CMe	CH
XXXIX-240	CHMe	H	H	S	CMe	CH
XXXIX-241	CHEt	H	H	S	CMe	CH
15 XXXIX-242	CHF	H	H	S	CMe	CH
XXXIX-243	C=CH <sub>2</sub>	H	H	S	CMe	CH
XXXIX-244	O	H	H	S	CMe	CH
20 XXXIX-245	S	H	H	S	CMe	CH
XXXIX-246	NH	H	H	S	CMe	CH
XXXIX-247	NMe	H	H	S	CMe	CH
XXXIX-248	NCHO	H	H	S	CMe	CH
25 XXXIX-249	NCOMe	H	H	S	CMe	CH
XXXIX-250	CH <sub>2</sub>	Me	H	S	CMe	CH
XXXIX-251	O	Me	H	S	CMe	CH
XXXIX-252	CHMe	Me	H	S	CMe	CH
30 XXXIX-253	CH <sub>2</sub>		=O	S	CMe	CH
XXXIX-254	CH <sub>2</sub>		=CH <sub>2</sub>	S	CMe	CH
XXXIX-255	CH <sub>2</sub>		=CHMe	S	CMe	CH
XXXIX-256	CH <sub>2</sub>	H	H	S	CH	CMe
35 XXXIX-257	CHMe	H	H	S	CH	CMe
XXXIX-258	CHEt	H	H	S	CH	CMe
XXXIX-259	CHF	H	H	S	CH	CMe
XXXIX-260	C=CH <sub>2</sub>	H	H	S	CH	CMe
40 XXXIX-261	O	H	H	S	CH	CMe
XXXIX-262	S	H	H	S	CH	CMe
XXXIX-263	NH	H	H	S	CH	CMe
45 XXXIX-264	NMe	H	H	S	CH	CMe
XXXIX-265	NCHO	H	H	S	CH	CMe
XXXIX-266	NCOMe	H	H	S	CH	CMe
XXXIX-267	CH <sub>2</sub>	Me	H	S	CH	CMe
50 XXXIX-268	O	Me	H	S	CH	CMe
XXXIX-269	CHMe	Me	H	S	CH	CMe
XXXIX-270	CH <sub>2</sub>		=O	S	CH	CMe
XXXIX-271	CH <sub>2</sub>		=CH <sub>2</sub>	S	CH	CMe
55 XXXIX-272	CH <sub>2</sub>		=CHMe	S	CH	CMe
XXXIX-273	CH <sub>2</sub>	H	H	NH	N	CH
XXXIX-274	CHMe	H	H	NH	N	CH
XXXIX-275	CHEt	H	H	NH	N	CH
60 XXXIX-276	CHF	H	H	NH	N	CH
XXXIX-277	C=CH <sub>2</sub>	H	H	NH	N	CH
XXXIX-278	O	H	H	NH	N	CH
XXXIX-279	S	H	H	NH	N	CH
65 XXXIX-280	NH	H	H	NH	N	CH

## ES 2 353 159 T3

Compuesto N°	Y	R1	R2	Td	Te	Tf
XXXXIX-281	NMe	H	H	NH	N	CH
XXXXIX-282	NCHO	H	H	NH	N	CH
XXXXIX-283	NCOMe	H	H	NH	N	CH
XXXXIX-284	CH <sub>2</sub>	Me	H	NH	N	CH
XXXXIX-285	O	Me	H	NH	N	CH
XXXXIX-286	CHMe	Me	H	NH	N	CH
XXXXIX-287	CH <sub>2</sub>		=O	NH	N	CH
XXXXIX-288	CH <sub>2</sub>		=CH <sub>2</sub>	NH	N	CH
XXXXIX-289	CH <sub>2</sub>		=CHMe	NH	N	CH
XXXXIX-290	CH <sub>2</sub>	H	H	NH	N	CMe
XXXXIX-291	CHMe	H	H	NH	N	CMe
XXXXIX-292	CHEt	H	H	NH	N	CMe
XXXXIX-293	CHF	H	H	NH	N	CMe
XXXXIX-294	C=CH <sub>2</sub>	H	H	NH	N	CMe
XXXXIX-295	O	H	H	NH	N	CMe
XXXXIX-296	S	H	H	NH	N	CMe
XXXXIX-297	NH	H	H	NH	N	CMe
XXXXIX-298	NMe	H	H	NH	N	CMe
XXXXIX-299	NCHO	H	H	NH	N	CMe
XXXXIX-300	NCOMe	H	H	NH	N	CMe
XXXXIX-301	CH <sub>2</sub>	Me	H	NH	N	CMe
XXXXIX-302	O	Me	H	NH	N	CMe
XXXXIX-303	CHMe	Me	H	NH	N	CMe
XXXXIX-304	CH <sub>2</sub>		=O	NH	N	CMe
XXXXIX-305	CH <sub>2</sub>		=CH <sub>2</sub>	NH	N	CMe
XXXXIX-306	CH <sub>2</sub>		=CHMe	NH	N	CMe
XXXXIX-307	CH <sub>2</sub>	H	H	NMe	N	CH
XXXXIX-308	CHMe	H	H	NMe	N	CH
XXXXIX-309	CHEt	H	H	NMe	N	CH
XXXXIX-310	CHF	H	H	NMe	N	CH
XXXXIX-311	C=CH <sub>2</sub>	H	H	NMe	N	CH
XXXXIX-312	O	H	H	NMe	N	CH
XXXXIX-313	S	H	H	NMe	N	CH
XXXXIX-314	NH	H	H	NMe	N	CH
XXXXIX-315	NMe	H	H	NMe	N	CH
XXXXIX-316	NCHO	H	H	NMe	N	CH
XXXXIX-317	NCOMe	H	H	NMe	N	CH
XXXXIX-318	CH <sub>2</sub>	Me	H	NMe	N	CH
XXXXIX-319	O	Me	H	NMe	N	CH
XXXXIX-320	CHMe	Me	H	NMe	N	CH
XXXXIX-321	CH <sub>2</sub>		=O	NMe	N	CH
XXXXIX-322	CH <sub>2</sub>		=CH <sub>2</sub>	NMe	N	CH
XXXXIX-323	CH <sub>2</sub>		=CHMe	NMe	N	CH
XXXXIX-324	CH <sub>2</sub>	H	H	NMe	N	CMe
XXXXIX-325	CHMe	H	H	NMe	N	CMe
XXXXIX-326	CHEt	H	H	NMe	N	CMe
XXXXIX-327	CHF	H	H	NMe	N	CMe

65

## ES 2 353 159 T3

Compuesto N°	Y	R1	R2	Td	Te	Tf	
5	XXXXIX-328	C=CH <sub>2</sub>	H	H	NMe	N	CMe
	XXXXIX-329	O	H	H	NMe	N	CMe
	XXXXIX-330	S	H	H	NMe	N	CMe
	XXXXIX-331	NH	H	H	NMe	N	CMe
10	XXXXIX-332	NMe	H	H	NMe	N	CMe
	XXXXIX-333	NCHO	H	H	NMe	N	CMe
	XXXXIX-334	NCOMe	H	H	NMe	N	CMe
	XXXXIX-335	CH <sub>2</sub>	Me	H	NMe	N	CMe
15	XXXXIX-336	O	Me	H	NMe	N	CMe
	XXXXIX-337	CHMe	Me	H	NMe	N	CMe
	XXXXIX-338	CH <sub>2</sub>		=O	NMe	N	CMe
	XXXXIX-339	CH <sub>2</sub>		=CH <sub>2</sub>	NMe	N	CMe
20	XXXXIX-340	CH <sub>2</sub>		=CHMe	NMe	N	CMe
	XXXXIX-341	CH <sub>2</sub>	H	H	O	N	CH
	XXXXIX-342	CHMe	H	H	O	N	CH
	XXXXIX-343	CH <i>Et</i>	H	H	O	N	CH
25	XXXXIX-344	CHF	H	H	O	N	CH
	XXXXIX-345	C=CH <sub>2</sub>	H	H	O	N	CH
	XXXXIX-346	O	H	H	O	N	CH
	XXXXIX-347	S	H	H	O	N	CH
30	XXXXIX-348	NH	H	H	O	N	CH
	XXXXIX-349	NMe	H	H	O	N	CH
	XXXXIX-350	NCHO	H	H	O	N	CH
35	XXXXIX-351	NCOMe	H	H	O	N	CH
	XXXXIX-352	CH <sub>2</sub>	Me	H	O	N	CH
	XXXXIX-353	O	Me	H	O	N	CH
	XXXXIX-354	CHMe	Me	H	O	N	CH
40	XXXXIX-355	CH <sub>2</sub>		=O	O	N	CH
	XXXXIX-356	CH <sub>2</sub>		=CH <sub>2</sub>	O	N	CH
	XXXXIX-357	CH <sub>2</sub>		=CHMe	O	N	CH
	XXXXIX-358	CH <sub>2</sub>	H	H	O	N	CMe
45	XXXXIX-359	CHMe	H	H	O	N	CMe
	XXXXIX-360	CH <i>Et</i>	H	H	O	N	CMe
	XXXXIX-361	CHF	H	H	O	N	CMe
	XXXXIX-362	C=CH <sub>2</sub>	H	H	O	N	CMe
50	XXXXIX-363	O	H	H	O	N	CMe
	XXXXIX-364	S	H	H	O	N	CMe
	XXXXIX-365	NH	H	H	O	N	CMe
	XXXXIX-366	NMe	H	H	O	N	CMe
55	XXXXIX-367	NCHO	H	H	O	N	CMe
	XXXXIX-368	NCOMe	H	H	O	N	CMe
	XXXXIX-369	CH <sub>2</sub>	Me	H	O	N	CMe
	XXXXIX-370	O	Me	H	O	N	CMe
60	XXXXIX-371	CHMe	Me	H	O	N	CMe
	XXXXIX-372	CH <sub>2</sub>		=O	O	N	CMe
	XXXXIX-373	CH <sub>2</sub>		=CH <sub>2</sub>	O	N	CMe
65	XXXXIX-374	CH <sub>2</sub>		=CHMe	O	N	CMe

## ES 2 353 159 T3

Compuesto N°	Y	R1	R2	Td	Te	Tf	
5	XXXIX-375	CH <sub>2</sub>	H	H	S	N	CH
	XXXIX-376	CHMe	H	H	S	N	CH
	XXXIX-377	CHEt	H	H	S	N	CH
	XXXIX-378	CHF	H	H	S	N	CH
10	XXXIX-379	C=CH <sub>2</sub>	H	H	S	N	CH
	XXXIX-380	O	H	H	S	N	CH
	XXXIX-381	S	H	H	S	N	CH
	XXXIX-382	NH	H	H	S	N	CH
15	XXXIX-383	NMe	H	H	S	N	CH
	XXXIX-384	NCHO	H	H	S	N	CH
	XXXIX-385	NCOMe	H	H	S	N	CH
	XXXIX-386	CH <sub>2</sub>	Me	H	S	N	CH
20	XXXIX-387	O	Me	H	S	N	CH
	XXXIX-388	CHMe	Me	H	S	N	CH
	XXXIX-389	CH <sub>2</sub>		=O	S	N	CH
	XXXIX-390	CH <sub>2</sub>		=CH <sub>2</sub>	S	N	CH
25	XXXIX-391	CH <sub>2</sub>		=CHMe	S	N	CH
	XXXIX-392	CH <sub>2</sub>	H	H	S	N	CMe
	XXXIX-393	CHMe	H	H	S	N	CMe
	XXXIX-394	CHEt	H	H	S	N	CMe
30	XXXIX-395	CHF	H	H	S	N	CMe
	XXXIX-396	C=CH <sub>2</sub>	H	H	S	N	CMe
	XXXIX-397	O	H	H	S	N	CMe
	XXXIX-398	S	H	H	S	N	CMe
35	XXXIX-399	NH	H	H	S	N	CMe
	XXXIX-400	NMe	H	H	S	N	CMe
	XXXIX-401	NCHO	H	H	S	N	CMe
	XXXIX-402	NCOMe	H	H	S	N	CMe
40	XXXIX-403	CH <sub>2</sub>	Me	H	S	N	CMe
	XXXIX-404	O	Me	H	S	N	CMe
	XXXIX-405	CHMe	Me	H	S	N	CMe
45	XXXIX-406	CH <sub>2</sub>		=O	S	N	CMe
	XXXIX-407	CH <sub>2</sub>		=CH <sub>2</sub>	S	N	CMe
	XXXIX-408	CH <sub>2</sub>		=CHMe	S	N	CMe
	XXXIX-409	CH <sub>2</sub>	H	H	NH	CH	N
50	XXXIX-410	CHMe	H	H	NH	CH	N
	XXXIX-411	CHEt	H	H	NH	CH	N
	XXXIX-412	CHF	H	H	NH	CH	N
	XXXIX-413	C=CH <sub>2</sub>	H	H	NH	CH	N
55	XXXIX-414	O	H	H	NH	CH	N
	XXXIX-415	S	H	H	NH	CH	N
	XXXIX-416	NH	H	H	NH	CH	N
	XXXIX-417	NMe	H	H	NH	CH	N
60	XXXIX-418	NCHO	H	H	NH	CH	N
	XXXIX-419	NCOMe	H	H	NH	CH	N
	XXXIX-420	CH <sub>2</sub>	Me	H	NH	CH	N
	XXXIX-421	O	Me	H	NH	CH	N

65

## ES 2 353 159 T3

Compuesto N°	Y	R1	R2	Td	Te	Tf
XXXIX-422	CHMe	Me	H	NH	CH	N
XXXIX-423	CH <sub>2</sub>		=O	NH	CH	N
XXXIX-424	CH <sub>2</sub>		=CH <sub>2</sub>	NH	CH	N
XXXIX-425	CH <sub>2</sub>		=CHMe	NH	CH	N
XXXIX-426	CH <sub>2</sub>	H	H	NH	CMe	N
XXXIX-427	CHMe	H	H	NH	CMe	N
XXXIX-428	CHEt	H	H	NH	CMe	N
XXXIX-429	CHF	H	H	NH	CMe	N
XXXIX-430	C=CH <sub>2</sub>	H	H	NH	CMe	N
XXXIX-431	O	H	H	NH	CMe	N
XXXIX-432	S	H	H	NH	CMe	N
XXXIX-433	NH	H	H	NH	CMe	N
XXXIX-434	NMe	H	H	NH	CMe	N
XXXIX-435	NCHO	H	H	NH	CMe	N
XXXIX-436	NCOMe	H	H	NH	CMe	N
XXXIX-437	CH <sub>2</sub>	Me	H	NH	CMe	N
XXXIX-438	O	Me	H	NH	CMe	N
XXXIX-439	CHMe	Me	H	NH	CMe	N
XXXIX-440	CH <sub>2</sub>		=O	NH	CMe	N
XXXIX-441	CH <sub>2</sub>		=CH <sub>2</sub>	NH	CMe	N
XXXIX-442	CH <sub>2</sub>		=CHMe	NH	CMe	N
XXXIX-443	CH <sub>2</sub>	H	H	O	CH	N
XXXIX-444	CHMe	H	H	O	CH	N
XXXIX-445	CHEt	H	H	O	CH	N
XXXIX-446	CHF	H	H	O	CH	N
XXXIX-447	C=CH <sub>2</sub>	H	H	O	CH	N
XXXIX-448	O	H	H	O	CH	N
XXXIX-449	S	H	H	O	CH	N
XXXIX-450	NH	H	H	O	CH	N
XXXIX-451	NMe	H	H	O	CH	N
XXXIX-452	NCHO	H	H	O	CH	N
XXXIX-453	NCOMe	H	H	O	CH	N
XXXIX-454	CH <sub>2</sub>	Me	H	O	CH	N
XXXIX-455	O	Me	H	O	CH	N
XXXIX-456	CHMe	Me	H	O	CH	N
XXXIX-457	CH <sub>2</sub>		=O	O	CH	N
XXXIX-458	CH <sub>2</sub>		=CH <sub>2</sub>	O	CH	N
XXXIX-459	CH <sub>2</sub>		=CHMe	O	CH	N
XXXIX-460	CH <sub>2</sub>	H	H	O	CMe	N
XXXIX-461	CHMe	H	H	O	CMe	N
XXXIX-462	CHEt	H	H	O	CMe	N
XXXIX-463	CHF	H	H	O	CMe	N
XXXIX-464	C=CH <sub>2</sub>	H	H	O	CMe	N
XXXIX-465	O	H	H	O	CMe	N
XXXIX-466	S	H	H	O	CMe	N
XXXIX-467	NH	H	H	O	CMe	N
XXXIX-468	NMe	H	H	O	CMe	N

	Compuesto N°	Y	R1	R2	Td	Te	Tf
5	XXXIX-469	NCHO	H	H	O	CMe	N
	XXXIX-470	NCOMe	H	H	O	CMe	N
	XXXIX-471	CH <sub>2</sub>	Me	H	O	CMe	N
	XXXIX-472	O	Me	H	O	CMe	N
10	XXXIX-473	CHMe	Me	H	O	CMe	N
	XXXIX-474	CH <sub>2</sub>		=O	O	CMe	N
	XXXIX-475	CH <sub>2</sub>		=CH <sub>2</sub>	O	CMe	N
	XXXIX-476	CH <sub>2</sub>		=CHMe	O	CMe	N
15	XXXIX-477	CH <sub>2</sub>	H	H	S	CH	N
	XXXIX-478	CHMe	H	H	S	CH	N
	XXXIX-479	CHEt	H	H	S	CH	N
	XXXIX-480	CHF	H	H	S	CH	N
20	XXXIX-481	C=CH <sub>2</sub>	H	H	S	CH	N
	XXXIX-482	O	H	H	S	CH	N
	XXXIX-483	S	H	H	S	CH	N
25	XXXIX-484	NH	H	H	S	CH	N
	XXXIX-485	NMe	H	H	S	CH	N
	XXXIX-486	NCHO	H	H	S	CH	N
	XXXIX-487	NCOMe	H	H	S	CH	N
30	XXXIX-488	CH <sub>2</sub>	Me	H	S	CH	N
	XXXIX-489	O	Me	H	S	CH	N
	XXXIX-490	CHMe	Me	H	S	CH	N
	XXXIX-491	CH <sub>2</sub>		=O	S	CH	N
35	XXXIX-492	CH <sub>2</sub>		=CH <sub>2</sub>	S	CH	N
	XXXIX-493	CH <sub>2</sub>		=CHMe	S	CH	N
	XXXIX-494	CH <sub>2</sub>	H	H	S	CMe	N
	XXXIX-495	CHMe	H	H	S	CMe	N
40	XXXIX-496	CHEt	H	H	S	CMe	N
	XXXIX-497	CHF	H	H	S	CMe	N
	XXXIX-498	C=CH <sub>2</sub>	H	H	S	CMe	N
	XXXIX-499	O	H	H	S	CMe	N
45	XXXIX-500	S	H	H	S	CMe	N
	XXXIX-501	NH	H	H	S	CMe	N
	XXXIX-502	NMe	H	H	S	CMe	N
	XXXIX-503	NCHO	H	H	S	CMe	N
50	XXXIX-504	NCOMe	H	H	S	CMe	N
	XXXIX-505	CH <sub>2</sub>	Me	H	S	CMe	N
	XXXIX-506	O	Me	H	S	CMe	N
	XXXIX-507	CHMe	Me	H	S	CMe	N
55	XXXIX-508	CH <sub>2</sub>		=O	S	CMe	N
	XXXIX-509	CH <sub>2</sub>		=CH <sub>2</sub>	S	CMe	N
	XXXIX-510	CH <sub>2</sub>		=CHMe	S	CMe	N
60	XXXIX-511	CH <sub>2</sub>	H	H	NH	N	N
	XXXIX-512	CHMe	H	H	NH	N	N
	XXXIX-513	CHEt	H	H	NH	N	N
	XXXIX-514	CHF	H	H	NH	N	N
65	XXXIX-515	C=CH <sub>2</sub>	H	H	NH	N	N

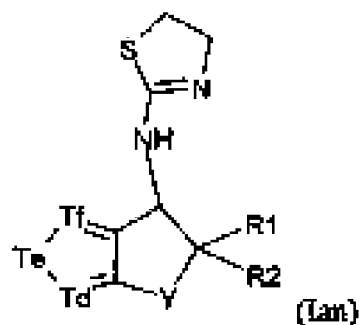
## ES 2 353 159 T3

Compuesto N°	Y	R1	R2	Td	Te	Tf
XXXIX-516	O	H	H	NH	N	N
XXXIX-517	S	H	H	NH	N	N
XXXIX-518	NH	H	H	NH	N	N
XXXIX-519	NMe	H	H	NH	N	N
XXXIX-520	NCHO	H	H	NH	N	N
XXXIX-521	NCOMe	H	H	NH	N	N
XXXIX-522	CH <sub>2</sub>	Me	H	NH	N	N
XXXIX-523	O	Me	H	NH	N	N
XXXIX-524	CHMe	Me	H	NH	N	N
XXXIX-525	CH <sub>2</sub>		=O	NH	N	N
XXXIX-526	CH <sub>2</sub>		=CH <sub>2</sub>	NH	N	N
XXXIX-527	CH <sub>2</sub>		=CHMe	NH	N	N
XXXIX-528	CH <sub>2</sub>	H	H	NMe	N	N
XXXIX-529	CHMe	H	H	NMe	N	N
XXXIX-530	CHEt	H	H	NMe	N	N
XXXIX-531	CHF	H	H	NMe	N	N
XXXIX-532	C=CH <sub>2</sub>	H	H	NMe	N	N
XXXIX-533	O	H	H	NMe	N	N
XXXIX-534	S	H	H	NMe	N	N
XXXIX-535	NH	H	H	NMe	N	N
XXXIX-536	NMe	H	H	NMe	N	N
XXXIX-537	NCHO	H	H	NMe	N	N
XXXIX-538	NCOMe	H	H	NMe	N	N
XXXIX-539	CH <sub>2</sub>	Me	H	NMe	N	N
XXXIX-540	O	Me	H	NMe	N	N
XXXIX-541	CHMe	Me	H	NMe	N	N
XXXIX-542	CH <sub>2</sub>		=O	NMe	N	N
XXXIX-543	CH <sub>2</sub>		=CH <sub>2</sub>	NMe	N	N
XXXIX-544	CH <sub>2</sub>		=CHMe	NMe	N	N
XXXIX-545	CH <sub>2</sub>	H	H	O	N	N
XXXIX-546	CHMe	H	H	O	N	N
XXXIX-547	CHEt	H	H	O	N	N
XXXIX-548	CHF	H	H	O	N	N
XXXIX-549	C=CH <sub>2</sub>	H	H	O	N	N
XXXIX-550	O	H	H	O	N	N
XXXIX-551	S	H	H	O	N	N
XXXIX-552	NH	H	H	O	N	N
XXXIX-553	NMe	H	H	O	N	N
XXXIX-554	NCHO	H	H	O	N	N
XXXIX-555	NCOMe	H	H	O	N	N
XXXIX-556	CH <sub>2</sub>	Me	H	O	N	N
XXXIX-557	O	Me	H	O	N	N
XXXIX-558	CHMe	Me	H	O	N	N
XXXIX-559	CH <sub>2</sub>		=O	O	N	N
XXXIX-560	CH <sub>2</sub>		=CH <sub>2</sub>	O	N	N
XXXIX-561	CH <sub>2</sub>		=CHMe	O	N	N
XXXIX-562	CH <sub>2</sub>	H	H	S	N	N

65

Compuesto N°	Y	R1	R2	Td	Te	Tf
XXXIX-563	CHMe	H	H	S	N	N
XXXIX-564	CHEt	H	H	S	N	N
XXXIX-565	CHF	H	H	S	N	N
XXXIX-566	C=CH <sub>2</sub>	H	H	S	N	N
XXXIX-567	O	H	H	S	N	N
XXXIX-568	S	H	H	S	N	N
XXXIX-569	NH	H	H	S	N	N
XXXIX-570	NMe	H	H	S	N	N
XXXIX-571	NCHO	H	H	S	N	N
XXXIX-572	NCOMe	H	H	S	N	N
XXXIX-573	CH <sub>2</sub>	Me	H	S	N	N
XXXIX-574	O	Me	H	S	N	N
XXXIX-575	CHMe	Me	H	S	N	N
XXXIX-576	CH <sub>2</sub>		=O	S	N	N
XXXIX-577	CH <sub>2</sub>		=CH <sub>2</sub>	S	N	N
XXXIX-578	CH <sub>2</sub>		=CHMe	S	N	N

La tabla XL estipula 392 compuestos de fórmula Iaa



donde los valores de Y, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, T<sup>d</sup>, T<sup>e</sup> y T<sup>f</sup> se indican en la tabla 7.

TABLA 7

Compuesto N°	Y	R1	R2	Td	Te	Tf
XL-1	CH <sub>2</sub>	H	H	CH	NH	CH
XL-2	CHMe	H	H	CH	NH	CH
XL-3	CHEt	H	H	CH	NH	CH
XL-4	CHF	H	H	CH	NH	CH
XL-5	C=CH <sub>2</sub>	H	H	CH	NH	CH
XL-6	O	H	H	CH	NH	CH
XL-7	S	H	H	CH	NH	CH
XL-8	NH	H	H	CH	NH	CH
XL-9	Nme	H	H	CH	NH	CH
XL-10	NCHO	H	H	CH	NH	CH
XL-11	NCOMe	H	H	CH	NH	CH
XL-12	CH <sub>2</sub>	Me	H	CH	NH	CH
XL-13	O	Me	H	CH	NH	CH
XL-14	CHMe	Me	H	CH	NH	CH

## ES 2 353 159 T3

Compuesto N°	Y	R1	R2	Td	Te	Tf	
5	XL-15	CH <sub>3</sub>	H	H	CMe	NH	CH
	XL-16	CHMe	H	H	CMe	NH	CH
	XL-17	CHEt	H	H	CMe	NH	CH
	XL-18	CHF	H	H	CMe	NH	CH
	XL-19	C=CH <sub>2</sub>	H	H	CMe	NH	CH
10	XL-20	O	H	H	CMe	NH	CH
	XL-21	S	H	H	CMe	NH	CH
	XL-22	NH	H	H	CMe	NH	CH
15	XL-23	Nme	H	H	CMe	NH	CH
	XL-24	NCHO	H	H	CMe	NH	CH
	XL-25	NCOMe	H	H	CMe	NH	CH
	XL-26	CH <sub>2</sub>	Me	H	CMe	NH	CH
20	XL-27	O	Me	H	CMe	NH	CH
	XL-28	CHMe	Me	H	CMe	NH	CH
	XL-29	CH <sub>2</sub>	H	H	CH	NH	CMe
	XL-30	CHMe	H	H	CH	NH	CMe
25	XL-31	CHEt	H	H	CH	NH	CMe
	XL-32	CHF	H	H	CH	NH	CMe
	XL-33	C=CH <sub>2</sub>	H	H	CH	NH	CMe
	XL-34	O	H	H	CH	NH	CMe
30	XL-35	S	H	H	CH	NH	CMe
	XL-36	NH	H	H	CH	NH	CMe
	XL-37	Nme	H	H	CH	NH	CMe
	XL-38	NCHO	H	H	CH	NH	CMe
35	XL-39	NCOMe	H	H	CH	NH	CMe
	XL-40	CH <sub>2</sub>	Me	H	CH	NH	CMe
	XL-41	O	Me	H	CH	NH	CMe
40	XL-42	CHMe	Me	H	CH	NH	CMe
	XL-43	CH <sub>2</sub>	H	H	CMe	NH	CMe
	XL-44	CHMe	H	H	CMe	NH	CMe
	XL-45	CHEt	H	H	CMe	NH	CMe
45	XL-46	CHF	H	H	CMe	NH	CMe
	XL-47	C=CH <sub>2</sub>	H	H	CMe	NH	CMe
	XL-48	O	H	H	CMe	NH	CMe
	XL-49	S	H	H	CMe	NH	CMe
50	XL-50	NH	H	H	CMe	NH	CMe
	XL-51	NMe	H	H	CMe	NH	CMe
	XL-52	NCHO	H	H	CMe	NH	CMe
	XL-53	NCOMe	H	H	CMe	NH	CMe
55	XL-54	CH <sub>2</sub>	Me	H	CMe	NH	CMe
	XL-55	O	Me	H	CMe	NH	CMe
	XL-56	CHMe	Me	H	CMe	NH	CMe
60	XL-57	CH <sub>2</sub>	H	H	CH	NMe	CH
	XL-58	CHMe	H	H	CH	NMe	CH
	XL-59	CHEt	H	H	CH	NMe	CH
	XL-60	CHF	H	H	CH	NMe	CH
65	XL-61	C=CH <sub>2</sub>	H	H	CH	NMe	CH

## ES 2 353 159 T3

Compuesto N°	Y	R1	R2	Td	Ta	Tf	
5	XL-62	O	H	H	CH	NMe	CH
	XL-63	S	H	H	CH	NMe	CH
	XL-64	NH	H	H	CH	NMe	CH
	XL-65	NMe	H	H	CH	NMe	CH
10	XL-66	NCHO	H	H	CH	NMe	CH
	XL-67	NCOMe	H	H	CH	NMe	CH
	XL-68	CH <sub>2</sub>	Me	H	CH	NMe	CH
	XL-69	O	Me	H	CH	NMe	CH
15	XL-70	CHMe	Me	H	CH	NMe	CH
	XL-71	CH <sub>2</sub>	H	H	CMe	NMe	CH
	XL-72	CHMe	H	H	CMe	NMe	CH
	XL-73	CHEt	H	H	CMe	NMe	CH
20	XL-74	CHF	H	H	CMe	NMe	CH
	XL-75	C=CH <sub>2</sub>	H	H	CMe	NMe	CH
	XL-76	O	H	H	CMe	NMe	CH
	XL-77	S	H	H	CMe	NMe	CH
25	XL-78	NH	H	H	CMe	NMe	CH
	XL-79	NMe	H	H	CMe	NMe	CH
	XL-80	NCHO	H	H	CMe	NMe	CH
	XL-81	NCOMe	H	H	CMe	NMe	CH
30	XL-82	CH <sub>2</sub>	Me	H	CMe	NMe	CH
	XL-83	O	Me	H	CMe	NMe	CH
	XL-84	CHMe	Me	H	CMe	NMe	CH
35	XL-85	CH <sub>2</sub>	H	H	CH	NMe	CMe
	XL-86	CHMe	H	H	CH	NMe	CMe
	XL-87	CHEt	H	H	CH	NMe	CMe
	XL-88	CHF	H	H	CH	NMe	CMe
40	XL-89	C=CH <sub>2</sub>	H	H	CH	NMe	CMe
	XL-90	O	H	H	CH	NMe	CMe
	XL-91	S	H	H	CH	NMe	CMe
	XL-92	NH	H	H	CH	NMe	CMe
45	XL-93	NMe	H	H	CH	NMe	CMe
	XL-94	NCHO	H	H	CH	NMe	CMe
	XL-95	NCOMe	H	H	CH	NMe	CMe
50	XL-96	CH <sub>2</sub>	Me	H	CH	NMe	CMe
	XL-97	O	Me	H	CH	NMe	CMe
	XL-98	CHMe	Me	H	CH	NMe	CMe
	XL-99	CH <sub>2</sub>	H	H	CMe	NMe	CMe
55	XL-100	CHMe	H	H	CMe	NMe	CMe
	XL-101	CHEt	H	H	CMe	NMe	CMe
	XL-102	CHF	H	H	CMe	NMe	CMe
	XL-103	C=CH <sub>2</sub>	H	H	CMe	NMe	CMe
60	XL-104	O	H	H	CMe	NMe	CMe
	XL-105	S	H	H	CMe	NMe	CMe
	XL-106	NH	H	H	CMe	NMe	CMe
	XL-107	NMe	H	H	CMe	NMe	CMe
65	XL-108	NCHO	H	H	CMe	NMe	CMe

## ES 2 353 159 T3

Compuesto N°	Y	R1	R2	Td	Te	Tf	
5	XL-109	NCOMe	H	H	CMe	NMe	CMe
	XL-110	CH <sub>2</sub>	Me	H	CMe	NMe	CMe
	XL-111	O	Me	H	CMe	NMe	CMe
	XL-112	CHMe	Me	H	CMe	NMe	CMe
10	XL-113	CH <sub>2</sub>	H	H	CH	O	CH
	XL-114	CHMe	H	H	CH	O	CH
	XL-115	CHEt	H	H	CH	O	CH
	XL-116	CHF	H	H	CH	O	CH
15	XL-117	C=CH <sub>2</sub>	H	H	CH	O	CH
	XL-118	O	H	H	CH	O	CH
	XL-119	S	H	H	CH	O	CH
20	XL-120	NH	H	H	CH	O	CH
	XL-121	NMe	H	H	CH	O	CH
	XL-122	NCHO	H	H	CH	O	CH
	XL-123	NCOMe	H	H	CH	O	CH
25	XL-124	CH <sub>2</sub>	Me	H	CH	O	CH
	XL-125	O	Me	H	CH	O	CH
	XL-126	CHMe	Me	H	CH	O	CH
	XL-127	CH <sub>2</sub>	H	H	CMe	O	CH
30	XL-128	CHMe	H	H	CMe	O	CH
	XL-129	CHEt	H	H	CMe	O	CH
	XL-130	CHF	H	H	CMe	O	CH
	XL-131	C=CH <sub>2</sub>	H	H	CMe	O	CH
35	XL-132	O	H	H	CMe	O	CH
	XL-133	S	H	H	CMe	O	CH
	XL-134	NH	H	H	CMe	O	CH
	XL-135	NMe	H	H	CMe	O	CH
40	XL-136	NCHO	H	H	CMe	O	CH
	XL-137	NCOMe	H	H	CMe	O	CH
	XL-138	CH <sub>2</sub>	Me	H	CMe	O	CH
	XL-139	O	Me	H	CMe	O	CH
45	XL-140	CHMe	Me	H	CMe	O	CH
	XL-141	CH <sub>2</sub>	H	H	CH	O	CMe
	XL-142	CHMe	H	H	CH	O	CMe
	XL-143	CHEt	H	H	CH	O	CMe
50	XL-144	CHF	H	H	CH	O	CMe
	XL-145	C=CH <sub>2</sub>	H	H	CH	O	CMe
	XL-146	O	H	H	CH	O	CMe
55	XL-147	S	H	H	CH	O	CMe
	XL-148	NH	H	H	CH	O	CMe
	XL-149	NMe	H	H	CH	O	CMe
	XL-150	NCHO	H	H	CH	O	CMe
60	XL-151	NCOMe	H	H	CH	O	CMe
	XL-152	CH <sub>2</sub>	Me	H	CH	O	CMe
	XL-153	O	Me	H	CH	O	CMe
	XL-154	CHMe	Me	H	CH	O	CMe
65	XL-155	CH <sub>2</sub>	H	H	CMe	O	CMe

## ES 2 353 159 T3

Compuesto N°	Y	R1	R2	Td	Te	Tf	
5	XL-156	CHMe	H	H	CMe	O	CMe
	XL-157	CHEt	H	H	CMe	O	CMe
	XL-158	CHF	H	H	CMe	O	CMe
	XL-159	C=CH <sub>2</sub>	H	H	CMe	O	CMe
	XL-160	O	H	H	CMe	O	CMe
10	XL-161	S	H	H	CMe	O	CMe
	XL-162	NH	H	H	CMe	O	CMe
	XL-163	NMe	H	H	CMe	O	CMe
	XL-164	NCHO	H	H	CMe	O	CMe
15	XL-165	NCOMe	H	H	CMe	O	CMe
	XL-166	CH <sub>2</sub>	Me	H	CMe	O	CMe
	XL-167	O	Me	H	CMe	O	CMe
20	XL-168	CHMe	Me	H	CMe	O	CMe
	XL-169	CH <sub>2</sub>	H	H	CH	S	CH
	XL-170	CHMe	H	H	CH	S	CH
	XL-171	CHEt	H	H	CH	S	CH
25	XL-172	CHF	H	H	CH	S	CH
	XL-173	C=CH <sub>2</sub>	H	H	CH	S	CH
	XL-174	O	H	H	CH	S	CH
	XL-175	S	H	H	CH	S	CH
30	XL-176	NH	H	H	CH	S	CH
	XL-177	NMe	H	H	CH	S	CH
	XL-178	NCHO	H	H	CH	S	CH
	XL-179	NCOMe	H	H	CH	S	CH
35	XL-180	CH <sub>2</sub>	Me	H	CH	S	CH
	XL-181	O	Me	H	CH	S	CH
	XL-182	CHMe	Me	H	CH	S	CH
40	XL-183	CH <sub>2</sub>	H	H	CMe	S	CH
	XL-184	CHMe	H	H	CMe	S	CH
	XL-185	CHEt	H	H	CMe	S	CH
	XL-186	CHF	H	H	CMe	S	CH
45	XL-187	C=CH <sub>2</sub>	H	H	CMe	S	CH
	XL-188	O	H	H	CMe	S	CH
	XL-189	S	H	H	CMe	S	CH
	XL-190	NH	H	H	CMe	S	CH
50	XL-191	NMe	H	H	CMe	S	CH
	XL-192	NCHO	H	H	CMe	S	CH
	XL-193	NCOMe	H	H	CMe	S	CH
	XL-194	CH <sub>2</sub>	Me	H	CMe	S	CH
55	XL-195	O	Me	H	CMe	S	CH
	XL-196	CHMe	Me	H	CMe	S	CH
	XL-197	CH <sub>2</sub>	H	H	CH	S	CMe
	XL-198	CHMe	H	H	CH	S	CMe
60	XL-199	CHEt	H	H	CH	S	CMe
	XL-200	CHF	H	H	CH	S	CMe
	XL-201	C=CH <sub>2</sub>	H	H	CH	S	CMe
65	XL-202	O	H	H	CH	S	CMe

## ES 2 353 159 T3

Compuesto N°	Y	R1	R2	Td	Te	Tf	
5	XL-203	S	H	H	CH	S	CMe
	XL-204	NH	H	H	CH	S	CMe
	XL-205	NMe	H	H	CH	S	CMe
	XL-206	NCHO	H	H	CH	S	CMe
10	XL-207	NCOMe	H	H	CH	S	CMe
	XL-208	CH <sub>2</sub>	Me	H	CH	S	CMe
	XL-209	O	Me	H	CH	S	CMe
	XL-210	CHMe	Me	H	CH	S	CMe
15	XL-211	CH <sub>2</sub>	H	H	CMe	S	CMe
	XL-212	CHMe	H	H	CMe	S	CMe
	XL-213	CHEt	H	H	CMe	S	CMe
	XL-214	CHF	H	H	CMe	S	CMe
20	XL-215	C=CH <sub>2</sub>	H	H	CMe	S	CMe
	XL-216	O	H	H	CMe	S	CMe
	XL-217	S	H	H	CMe	S	CMe
	XL-218	NH	H	H	CMe	S	CMe
25	XL-219	NMe	H	H	CMe	S	CMe
	XL-220	NCHO	H	H	CMe	S	CMe
	XL-221	NCOMe	H	H	CMe	S	CMe
	XL-222	CH <sub>2</sub>	Me	H	CMe	S	CMe
30	XL-223	O	Me	H	CMe	S	CMe
	XL-224	CHMe	Me	H	CMe	S	CMe
	XL-225	CH <sub>2</sub>	H	H	N	NMe	CH
	XL-226	CHMe	H	H	N	NMe	CH
35	XL-227	CHEt	H	H	N	NMe	CH
	XL-228	CHF	H	H	N	NMe	CH
	XL-229	C=CH <sub>2</sub>	H	H	N	NMe	CH
40	XL-230	O	H	H	N	NMe	CH
	XL-231	S	H	H	N	NMe	CH
	XL-232	NH	H	H	N	NMe	CH
	XL-233	NMe	H	H	N	NMe	CH
45	XL-234	NCHO	H	H	N	NMe	CH
	XL-235	NCOMe	H	H	N	NMe	CH
	XL-236	CH <sub>2</sub>	Me	H	N	NMe	CH
	XL-237	O	Me	H	N	NMe	CH
50	XL-238	CHMe	Me	H	N	NMe	CH
	XL-239	CH <sub>2</sub>	H	H	N	NMe	CMe
	XL-240	CHMe	H	H	N	NMe	CMe
	XL-241	CHEt	H	H	N	NMe	CMe
55	XL-242	CHF	H	H	N	NMe	CMe
	XL-243	C=CH <sub>2</sub>	H	H	N	NMe	CMe
	XL-244	O	H	H	N	NMe	CMe
	XL-245	S	H	H	N	NMe	CMe
60	XL-246	NH	H	H	N	NMe	CMe
	XL-247	NMe	H	H	N	NMe	CMe
	XL-248	NCHO	H	H	N	NMe	CMe
65	XL-249	NCOMe	H	H	N	NMe	CMe

## ES 2 353 159 T3

Compuesto N°	Y	R1	R2	Td	Te	Tf	
5	XL-250	CH <sub>2</sub>	Me	H	N	NMe	CMe
	XL-251	O	Me	H	N	NMe	CMe
	XL-252	CHMe	Me	H	N	NMe	CMe
	XL-253	CH <sub>2</sub>	H	H	N	O	CH
	XL-254	CHMe	H	H	N	O	CH
10	XL-255	CHEt	H	H	N	O	CH
	XL-256	CHF	H	H	N	O	CH
	XL-257	C=CH <sub>2</sub>	H	H	N	O	CH
15	XL-258	O	H	H	N	O	CH
	XL-259	S	H	H	N	O	CH
	XL-260	NH	H	H	N	O	CH
	XL-261	NMe	H	H	N	O	CH
20	XL-262	NCHO	H	H	N	O	CH
	XL-263	NCOMe	H	H	N	O	CH
	XL-264	CH <sub>2</sub>	Me	H	N	O	CH
	XL-265	O	Me	H	N	O	CH
25	XL-266	CHMe	Me	H	N	O	CH
	XL-267	CH <sub>2</sub>	H	H	N	O	CMe
	XL-268	CHMe	H	H	N	O	CMe
	XL-269	CHEt	H	H	N	O	CMe
30	XL-270	CHF	H	H	N	O	CMe
	XL-271	C=CH <sub>2</sub>	H	H	N	O	CMe
	XL-272	O	H	H	N	O	CMe
	XL-273	S	H	H	N	O	CMe
35	XL-274	NH	H	H	N	O	CMe
	XL-275	NMe	H	H	N	O	CMe
	XL-276	NCHO	H	H	N	O	CMe
	XL-277	NCOMe	H	H	N	O	CMe
40	XL-278	CH <sub>2</sub>	Me	H	N	O	CMe
	XL-279	O	Me	H	N	O	CMe
	XL-280	CHMe	Me	H	N	O	CMe
45	XL-281	CH <sub>2</sub>	H	H	N	S	CH
	XL-282	CHMe	H	H	N	S	CH
	XL-283	CHEt	H	H	N	S	CH
	XL-284	CHF	H	H	N	S	CH
50	XL-285	C=CH <sub>2</sub>	H	H	N	S	CH
	XL-286	O	H	H	N	S	CH
	XL-287	S	H	H	N	S	CH
	XL-288	NH	H	H	N	S	CH
55	XL-289	NMe	H	H	N	S	CH
	XL-290	NCHO	H	H	N	S	CH
	XL-291	NCOMe	H	H	N	S	CH
	XL-292	CH <sub>2</sub>	Me	H	N	S	CH
60	XL-293	O	Me	H	N	S	CH
	XL-294	CHMe	Me	H	N	S	CH
	XL-295	CH <sub>2</sub>	H	H	N	S	CMe
	XL-296	CHMe	H	H	N	S	CMe

65

## ES 2 353 159 T3

Compuesto N°	Y	R1	R2	Td	Te	Tf	
5	XL-297	CHEI	H	H	N	S	CMe
	XL-298	CHF	H	H	N	S	CMe
	XL-299	C=CH <sub>2</sub>	H	H	N	S	CMe
	XL-300	O	H	H	N	S	CMe
10	XL-301	S	H	H	N	S	CMe
	XL-302	NH	H	H	N	S	CMe
	XL-303	NMe	H	H	N	S	CMe
	XL-304	NCHO	H	H	N	S	CMe
15	XL-305	NCOMe	H	H	N	S	CMe
	XL-306	CH <sub>2</sub>	Me	H	N	S	CMe
	XL-307	O	Me	H	N	S	CMe
	XL-308	CHMe	Me	H	N	S	CMe
20	XL-309	CH <sub>2</sub>	H	H	CH	NMe	N
	XL-310	CHMe	H	H	CH	NMe	N
	XL-311	CHEI	H	H	CH	NMe	N
	XL-312	CHF	H	H	CH	NMe	N
25	XL-313	C=CH <sub>2</sub>	H	H	CH	NMe	N
	XL-314	O	H	H	CH	NMe	N
	XL-315	S	H	H	CH	NMe	N
30	XL-316	NH	H	H	CH	NMe	N
	XL-317	NMe	H	H	CH	NMe	N
	XL-318	NCHO	H	H	CH	NMe	N
	XL-319	NCOMe	H	H	CH	NMe	N
35	XL-320	CH <sub>2</sub>	Me	H	CH	NMe	N
	XL-321	O	Me	H	CH	NMe	N
	XL-322	CHMe	Me	H	CH	NMe	N
	XL-323	CH <sub>2</sub>	H	H	CMe	NMe	N
40	XL-324	CHMe	H	H	CMe	NMe	N
	XL-325	CHEI	H	H	CMe	NMe	N
	XL-326	CHF	H	H	CMe	NMe	N
	XL-327	C=CH <sub>2</sub>	H	H	CMe	NMe	N
45	XL-328	O	H	H	CMe	NMe	N
	XL-329	S	H	H	CMe	NMe	N
	XL-330	NH	H	H	CMe	NMe	N
	XL-331	NMe	H	H	CMe	NMe	N
50	XL-332	NCHO	H	H	CMe	NMe	N
	XL-333	NCOMe	H	H	CMe	NMe	N
	XL-334	CH <sub>2</sub>	Me	H	CMe	NMe	N
	XL-335	O	Me	H	CMe	NMe	N
55	XL-336	CHMe	Me	H	CMe	NMe	N
	XL-337	CH <sub>2</sub>	H	H	CH	O	N
	XL-338	CHMe	H	H	CH	O	N
	XL-339	CHEI	H	H	CH	O	N
60	XL-340	CHF	H	H	CH	O	N
	XL-341	C=CH <sub>2</sub>	H	H	CH	O	N
	XL-342	O	H	H	CH	O	N
65	XL-343	S	H	H	CH	O	N

## ES 2 353 159 T3

Compuesto N°	Y	R1	R2	Td	T6	Tf	
5	XL-344	NH	H	H	CH	O	N
	XL-345	NMe	H	H	CH	O	N
	XL-346	NCHO	H	H	CH	O	N
	XL-347	NCOMe	H	H	CH	O	N
10	XL-348	CH <sub>2</sub>	Me	H	CH	O	N
	XL-349	O	Me	H	CH	O	N
	XL-350	CHMe	Me	H	CH	O	N
15	XL-351	CH <sub>2</sub>	H	H	CMe	O	N
	XL-352	CHMe	H	H	CMe	O	N
	XL-353	CHEt	H	H	CMe	O	N
	XL-354	CHF	H	H	CMe	O	N
	XL-355	C=CH <sub>2</sub>	H	H	CMe	O	N
20	XL-356	O	H	H	CMe	O	N
	XL-357	S	H	H	CMe	O	N
	XL-358	NH	H	H	CMe	O	N
	XL-359	NMe	H	H	CMe	O	N
25	XL-360	NCHO	H	H	CMe	O	N
	XL-361	NCOMe	H	H	CMe	O	N
	XL-362	CH <sub>2</sub>	Me	H	CMe	O	N
	XL-363	O	Me	H	CMe	O	N
30	XL-364	CHMe	Me	H	CMe	O	N
	XL-365	CH <sub>2</sub>	H	H	CH	S	N
	XL-366	CHMe	H	H	CH	S	N
	XL-367	CHEt	H	H	CH	S	N
35	XL-368	CHF	H	H	CH	S	N
	XL-369	C=CH <sub>2</sub>	H	H	CH	S	N
	XL-370	O	H	H	CH	S	N
	XL-371	S	H	H	CH	S	N
40	XL-372	NH	H	H	CH	S	N
	XL-373	NMe	H	H	CH	S	N
	XL-374	NCHO	H	H	CH	S	N
	XL-375	NCOMe	H	H	CH	S	N
45	XL-376	CH <sub>2</sub>	Me	H	CH	S	N
	XL-377	O	Me	H	CH	S	N
	XL-378	CHMe	Me	H	CH	S	N
50	XL-379	CH <sub>2</sub>	H	H	CMe	S	N
	XL-380	CHMe	H	H	CMe	S	N
	XL-381	CHEt	H	H	CMe	S	N
	XL-382	CHF	H	H	CMe	S	N
55	XL-383	C=CH <sub>2</sub>	H	H	CMe	S	N
	XL-384	O	H	H	CMe	S	N
	XL-385	S	H	H	CMe	S	N
	XL-386	NH	H	H	CMe	S	N
60	XL-387	NMe	H	H	CMe	S	N
	XL-388	NCHO	H	H	CMe	S	N
	XL-389	NCOMe	H	H	CMe	S	N
	XL-390	CH <sub>2</sub>	Me	H	CMe	S	N

65

ES 2 353 159 T3

Compuesto N°	Y	R1	R2	Td	Te	Tf
XL-391	O	Me	H	CMe	S	N
XL-392	CHMe	Me	H	CMe	S	N

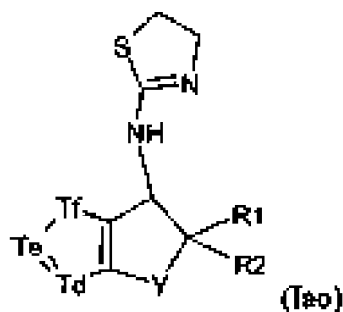
5

La tabla XLI estipula 336 compuestos de fórmula Iao

10

15

20



donde los valores de Y, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, T<sup>d</sup>, T<sup>e</sup> y T<sup>f</sup> se indican en la tabla 8.

25

TABLA 8

Compuesto N°	Y	R1	R2	Td	Te	Tf
XLI-1	CH <sub>2</sub>	H	H	CH	CH	NH
XLI-2	CHMe	H	H	CH	CH	NH
XLI-3	CHEt	H	H	CH	CH	NH
XLI-4	CHF	H	H	CH	CH	NH
XLI-5	C=CH <sub>2</sub>	H	H	CH	CH	NH
XLI-6	O	H	H	CH	CH	NH
XLI-7	S	H	H	CH	CH	NH
XLI-8	NH	H	H	CH	CH	NH
XLI-9	NMe	H	H	CH	CH	NH
XLI-10	NCHO	H	H	CH	CH	NH
XLI-11	NCOMe	H	H	CH	CH	NH
XLI-12	CH <sub>2</sub>	Me	H	CH	CH	NH
XLI-13	O	Me	H	CH	CH	NH
XLI-14	CHMe	Me	H	CH	CH	NH
XLI-15	CH <sub>2</sub>	H	H	CMe	CH	NH
XLI-16	CHMe	H	H	CMe	CH	NH
XLI-17	CHEt	H	H	CMe	CH	NH
XLI-18	CHF	H	H	CMe	CH	NH
XLI-19	C=CH <sub>2</sub>	H	H	CMe	CH	NH
XLI-20	O	H	H	CMe	CH	NH
XLI-21	S	H	H	CMe	CH	NH
XLI-22	NH	H	H	CMe	CH	NH
XLI-23	NMe	H	H	CMe	CH	NH
XLI-24	NCHO	H	H	CMe	CH	NH
XLI-25	NCOMe	H	H	CMe	CH	NH
XLI-26	CH <sub>2</sub>	Me	H	CMe	CH	NH
XLI-27	O	Me	H	CMe	CH	NH

65

Compuesto N°	Y	R1	R2	Td	Te	Tf	
5	XLI-28	CHMe	Me	H	CMe	CH	NH
	XLI-29	CH <sub>2</sub>	H	H	CH	CMe	NH
	XLI-30	CHMe	H	H	CH	CMe	NH
	XLI-31	CHEI	H	H	CH	CMe	NH
	XLI-32	CHF	H	H	CH	CMe	NH
10	XLI-33	C=CH <sub>2</sub>	H	H	CH	CMe	NH
	XLI-34	O	H	H	CH	CMe	NH
	XLI-35	S	H	H	CH	CMe	NH
15	XLI-36	NH	H	H	CH	CMe	NH
	XLI-37	NMe	H	H	CH	CMe	NH
	XLI-38	NCHO	H	H	CH	CMe	NH
	XLI-39	NCOMe	H	H	CH	CMe	NH
20	XLI-40	CH <sub>2</sub>	Me	H	CH	CMe	NH
	XLI-41	O	Me	H	CH	CMe	NH
	XLI-42	CHMe	Me	H	CH	CMe	NH
25	XLI-43	CH <sub>2</sub>	H	H	CH	CH	NMe
	XLI-44	CHMe	H	H	CH	CH	NMe
	XLI-45	CHEI	H	H	CH	CH	NMe
	XLI-46	CHF	H	H	CH	CH	NMe
	XLI-47	C=CH <sub>2</sub>	H	H	CH	CH	NMe
30	XLI-48	O	H	H	CH	CH	NMe
	XLI-49	S	H	H	CH	CH	NMe
	XLI-50	NH	H	H	CH	CH	NMe
35	XLI-51	NMe	H	H	CH	CH	NMe
	XLI-52	NCHO	H	H	CH	CH	NMe
	XLI-53	NCOMe	H	H	CH	CH	NMe
	XLI-54	CH <sub>2</sub>	Me	H	CH	CH	NMe
40	XLI-55	O	Me	H	CH	CH	NMe
	XLI-56	CHMe	Me	H	CH	CH	NMe
	XLI-57	CH <sub>2</sub>	H	H	CMe	CH	NMe
	XLI-58	CHMe	H	H	CMe	CH	NMe
45	XLI-59	CHEI	H	H	CMe	CH	NMe
	XLI-60	CHF	H	H	CMe	CH	NMe
	XLI-61	C=CH <sub>2</sub>	H	H	CMe	CH	NMe
	XLI-62	O	H	H	CMe	CH	NMe
50	XLI-63	S	H	H	CMe	CH	NMe
	XLI-64	NH	H	H	CMe	CH	NMe
	XLI-65	NMe	H	H	CMe	CH	NMe
	XLI-66	NCHO	H	H	CMe	CH	NMe
55	XLI-67	NCOMe	H	H	CMe	CH	NMe
	XLI-68	CH <sub>2</sub>	Me	H	CMe	CH	NMe
	XLI-69	O	Me	H	CMe	CH	NMe
60	XLI-70	CHMe	Me	H	CMe	CH	NMe
	XLI-71	CH <sub>2</sub>	H	H	CH	CMe	NMe
	XLI-72	CHMe	H	H	CH	CMe	NMe
	XLI-73	CHEI	H	H	CH	CMe	NMe

65

## ES 2 353 159 T3

Compuesto N°	Y	R1	R2	Td	Te	Tf	
5	XLI-74	CHF	H	H	CH	CMe	NMe
	XLI-75	C=CH <sub>2</sub>	H	H	CH	CMe	NMe
	XLI-76	O	H	H	CH	CMe	NMe
	XLI-77	S	H	H	CH	CMe	NMe
	XLI-78	NH	H	H	CH	CMe	NMe
10	XLI-79	NMe	H	H	CH	CMe	NMe
	XLI-80	NCHO	H	H	CH	CMe	NMe
	XLI-81	NCOMe	H	H	CH	CMe	NMe
15	XLI-82	CH <sub>2</sub>	Me	H	CH	CMe	NMe
	XLI-83	O	Me	H	CH	CMe	NMe
	XLI-84	CHMe	Me	H	CH	CMe	NMe
	XLI-85	CH <sub>2</sub>	H	H	CH	CH	O
20	XLI-86	CHMe	H	H	CH	CH	O
	XLI-87	CHEt	H	H	CH	CH	O
	XLI-88	CHF	H	H	CH	CH	O
	XLI-89	C=CH <sub>2</sub>	H	H	CH	CH	O
25	XLI-90	O	H	H	CH	CH	O
	XLI-91	S	H	H	CH	CH	O
	XLI-92	NH	H	H	CH	CH	O
	XLI-93	NMe	H	H	CH	CH	O
30	XLI-94	NCHO	H	H	CH	CH	O
	XLI-95	NCOMe	H	H	CH	CH	O
	XLI-96	CH <sub>2</sub>	Me	H	CH	CH	O
	XLI-97	O	Me	H	CH	CH	O
35	XLI-98	CHMe	Me	H	CH	CH	O
	XLI-99	CH <sub>2</sub>	H	H	CMe	CH	O
	XLI-100	CHMe	H	H	CMe	CH	O
40	XLI-101	CHEt	H	H	CMe	CH	O
	XLI-102	CHF	H	H	CMe	CH	O
	XLI-103	C=CH <sub>2</sub>	H	H	CMe	CH	O
	XLI-104	O	H	H	CMe	CH	O
45	XLI-105	S	H	H	CMe	CH	O
	XLI-106	NH	H	H	CMe	CH	O
	XLI-107	NMe	H	H	CMe	CH	O
	XLI-108	NCHO	H	H	CMe	CH	O
50	XLI-109	NCOMe	H	H	CMe	CH	O
	XLI-110	CH <sub>2</sub>	Me	H	CMe	CH	O
	XLI-111	O	Me	H	CMe	CH	O
	XLI-112	CHMe	Me	H	CMe	CH	O
55	XLI-113	CH <sub>2</sub>	H	H	CH	CMe	O
	XLI-114	CHMe	H	H	CH	CMe	O
	XLI-115	CHEt	H	H	CH	CMe	O
	XLI-116	CHF	H	H	CH	CMe	O
60	XLI-117	C=CH <sub>2</sub>	H	H	CH	CMe	O
	XLI-118	O	H	H	CH	CMe	O
	XLI-119	S	H	H	CH	CMe	O
65	XLI-120	NH	H	H	CH	CMe	O

## ES 2 353 159 T3

Compuesto N°	Y	R1	R2	Td	Te	Tf	
5	XLI-121	NMe	H	H	CH	CMe	O
	XLI-122	NCHO	H	H	CH	CMe	O
	XLI-123	NCOMe	H	H	CH	CMe	O
	XLI-124	CH <sub>2</sub>	Me	H	CH	CMe	O
	XLI-125	O	Me	H	CH	CMe	O
10	XLI-126	CHMe	Me	H	CH	CMe	O
	XLI-127	CH <sub>2</sub>	H	H	CH	CH	S
	XLI-128	CHMe	H	H	CH	CH	S
15	XLI-129	CHEt	H	H	CH	CH	S
	XLI-130	CHF	H	H	CH	CH	S
	XLI-131	C≡CH <sub>2</sub>	H	H	CH	CH	S
	XLI-132	O	H	H	CH	CH	S
20	XLI-133	S	H	H	CH	CH	S
	XLI-134	NH	H	H	CH	CH	S
	XLI-135	NMe	H	H	CH	CH	S
	XLI-136	NCHO	H	H	CH	CH	S
25	XLI-137	NCOMe	H	H	CH	CH	S
	XLI-138	CH <sub>2</sub>	Me	H	CH	CH	S
	XLI-139	O	Me	H	CH	CH	S
	XLI-140	CHMe	Me	H	CH	CH	S
30	XLI-141	CH <sub>2</sub>	H	H	CMe	CH	S
	XLI-142	CHMe	H	H	CMe	CH	S
	XLI-143	CHEt	H	H	CMe	CH	S
	XLI-144	CHF	H	H	CMe	CH	S
35	XLI-145	C≡CH <sub>2</sub>	H	H	CMe	CH	S
	XLI-146	O	H	H	CMe	CH	S
	XLI-147	S	H	H	CMe	CH	S
	XLI-148	NH	H	H	CMe	CH	S
40	XLI-149	NMe	H	H	CMe	CH	S
	XLI-150	NCHO	H	H	CMe	CH	S
	XLI-151	NCOMe	H	H	CMe	CH	S
45	XLI-152	CH <sub>2</sub>	Me	H	CMe	CH	S
	XLI-153	O	Me	H	CMe	CH	S
	XLI-154	CHMe	Me	H	CMe	CH	S
	XLI-155	CH <sub>2</sub>	H	H	CH	CMe	S
	XLI-156	CHMe	H	H	CH	CMe	S
50	XLI-157	CHEt	H	H	CH	CMe	S
	XLI-158	CHF	H	H	CH	CMe	S
	XLI-159	C≡CH <sub>2</sub>	H	H	CH	CMe	S
55	XLI-160	O	H	H	CH	CMe	S
	XLI-161	S	H	H	CH	CMe	S
	XLI-162	NH	H	H	CH	CMe	S
	XLI-163	NMe	H	H	CH	CMe	S
60	XLI-164	NCHO	H	H	CH	CMe	S
	XLI-165	NCOMe	H	H	CH	CMe	S
	XLI-166	CH <sub>2</sub>	Me	H	CH	CMe	S
	XLI-167	O	Me	H	CH	CMe	S
65							

## ES 2 353 159 T3

Compuesto N°	Y	R1	R2	Td	Te	Tf
XLI-168	CHMe	Me	H	CH	CMe	S
5 XLI-169	CH <sub>2</sub>	H	H	N	CH	NMe
XLI-170	CHMe	H	H	N	CH	NMe
XLI-171	CHEt	H	H	N	CH	NMe
XLI-172	CHF	H	H	N	CH	NMe
10 XLI-173	C=CH <sub>2</sub>	H	H	N	CH	NMe
XLI-174	O	H	H	N	CH	NMe
XLI-175	S	H	H	N	CH	NMe
15 XLI-176	NH	H	H	N	CH	NMe
XLI-177	NMe	H	H	N	CH	NMe
XLI-178	NCHO	H	H	N	CH	NMe
XLI-179	NCOMe	H	H	N	CH	NMe
20 XLI-180	CH <sub>2</sub>	Me	H	N	CH	NMe
XLI-181	O	Me	H	N	CH	NMe
XLI-182	CHMe	Me	H	N	CH	NMe
XLI-183	CH <sub>2</sub>	H	H	N	CMe	NMe
25 XLI-184	CHMe	H	H	N	CMe	NMe
XLI-185	CHEt	H	H	N	CMe	NMe
XLI-186	CHF	H	H	N	CMe	NMe
XLI-187	C=CH <sub>2</sub>	H	H	N	CMe	NMe
30 XLI-188	O	H	H	N	CMe	NMe
XLI-189	S	H	H	N	CMe	NMe
XLI-190	NH	H	H	N	CMe	NMe
XLI-191	NMe	H	H	N	CMe	NMe
35 XLI-192	NCHO	H	H	N	CMe	NMe
XLI-193	NCOMe	H	H	N	CMe	NMe
XLI-194	CH <sub>2</sub>	Me	H	N	CMe	NMe
40 XLI-195	O	Me	H	N	CMe	NMe
XLI-196	CHMe	Me	H	N	CMe	NMe
XLI-197	CH <sub>2</sub>	H	H	N	CH	O
XLI-198	CHMe	H	H	N	CH	O
XLI-199	CHEt	H	H	N	CH	O
45 XLI-200	CHF	H	H	N	CH	O
XLI-201	C=CH <sub>2</sub>	H	H	N	CH	O
XLI-202	O	H	H	N	CH	O
50 XLI-203	S	H	H	N	CH	O
XLI-204	NH	H	H	N	CH	O
XLI-205	NMe	H	H	N	CH	O
XLI-206	NCHO	H	H	N	CH	O
55 XLI-207	NCOMe	H	H	N	CH	O
XLI-208	CH <sub>2</sub>	Me	H	N	CH	O
XLI-209	O	Me	H	N	CH	O
XLI-210	CHMe	Me	H	N	CH	O
60 XLI-211	CH <sub>2</sub>	H	H	N	CMe	O
XLI-212	CHMe	H	H	N	CMe	O
XLI-213	CHEt	H	H	N	CMe	O
65 XLI-214	CHF	H	H	N	CMe	O

## ES 2 353 159 T3

Compuesto N°	Y	R1	R2	Td	Te	Tf	
5	XLI-215	C=CH <sub>2</sub>	H	H	N	CMe	O
	XLI-216	O	H	H	N	CMe	O
	XLI-217	S	H	H	N	CMe	O
	XLI-218	NH	H	H	N	CMe	O
	XLI-219	NMe	H	H	N	CMe	O
10	XLI-220	NCHO	H	H	N	CMe	O
	XLI-221	NCOMe	H	H	N	CMe	O
	XLI-222	CH <sub>2</sub>	Me	H	N	CMe	O
15	XLI-223	O	Me	H	N	CMe	O
	XLI-224	CHMe	Me	H	N	CMe	O
	XLI-225	CH <sub>2</sub>	H	H	N	CH	S
	XLI-226	CHMe	H	H	N	CH	S
20	XLI-227	CHEt	H	H	N	CH	S
	XLI-228	CHF	H	H	N	CH	S
	XLI-229	C=CH <sub>2</sub>	H	H	N	CH	S
	XLI-230	O	H	H	N	CH	S
25	XLI-231	S	H	H	N	CH	S
	XLI-232	NH	H	H	N	CH	S
	XLI-233	NMe	H	H	N	CH	S
	XLI-234	NCHO	H	H	N	CH	S
30	XLI-235	NCOMe	H	H	N	CH	S
	XLI-236	CH <sub>2</sub>	Me	H	N	CH	S
	XLI-237	O	Me	H	N	CH	S
	XLI-238	CHMe	Me	H	N	CH	S
35	XLI-239	CH <sub>2</sub>	H	H	N	CMe	S
	XLI-240	CHMe	H	H	N	CMe	S
	XLI-241	CHEt	H	H	N	CMe	S
	XLI-242	CHF	H	H	N	CMe	S
40	XLI-243	C=CH <sub>2</sub>	H	H	N	CMe	S
	XLI-244	O	H	H	N	CMe	S
	XLI-245	S	H	H	N	CMe	S
	XLI-246	NH	H	H	N	CMe	S
45	XLI-247	NMe	H	H	N	CMe	S
	XLI-248	NCHO	H	H	N	CMe	S
	XLI-249	NCOMe	H	H	N	CMe	S
	XLI-250	CH <sub>2</sub>	Me	H	N	CMe	S
50	XLI-251	O	Me	H	N	CMe	S
	XLI-252	CHMe	Me	H	N	CMe	S
	XLI-253	CH <sub>2</sub>	H	H	CH	N	NMe
	XLI-254	CHMe	H	H	CH	N	NMe
55	XLI-255	CHEt	H	H	CH	N	NMe
	XLI-256	CHF	H	H	CH	N	NMe
	XLI-257	C=CH <sub>2</sub>	H	H	CH	N	NMe
60	XLI-258	O	H	H	CH	N	NMe
	XLI-259	S	H	H	CH	N	NMe
	XLI-260	NH	H	H	CH	N	NMe
	XLI-261	NMe	H	H	CH	N	NMe

65

## ES 2 353 159 T3

Compuesto N°	Y	R1	R2	Td	Te	Tf	
5	XLI-262	NCHO	H	H	CH	N	NMe
	XLI-263	NCOMe	H	H	CH	N	NMe
	XLI-264	CH <sub>2</sub>	Me	H	CH	N	NMe
	XLI-265	O	Me	H	CH	N	NMe
	XLI-266	CHMe	Me	H	CH	N	NMe
10	XLI-267	CH <sub>2</sub>	H	H	CMe	N	NMe
	XLI-268	CHMe	H	H	CMe	N	NMe
	XLI-269	CHEt	H	H	CMe	N	NMe
	XLI-270	CHF	H	H	CMe	N	NMe
15	XLI-271	C=CH <sub>2</sub>	H	H	CMe	N	NMe
	XLI-272	O	H	H	CMe	N	NMe
	XLI-273	S	H	H	CMe	N	NMe
	XLI-274	NH	H	H	CMe	N	NMe
20	XLI-275	NMe	H	H	CMe	N	NMe
	XLI-276	NCHO	H	H	CMe	N	NMe
	XLI-277	NCOMe	H	H	CMe	N	NMe
	XLI-278	CH <sub>2</sub>	Me	H	CMe	N	NMe
25	XLI-279	O	Me	H	CMe	N	NMe
	XLI-280	CHMe	Me	H	CMe	N	NMe
	XLI-281	CH <sub>2</sub>	H	H	CH	N	O
30	XLI-282	CHMe	H	H	CH	N	O
	XLI-283	CHEt	H	H	CH	N	O
	XLI-284	CHF	H	H	CH	N	O
	XLI-285	C=CH <sub>2</sub>	H	H	CH	N	O
35	XLI-286	O	H	H	CH	N	O
	XLI-287	S	H	H	CH	N	O
	XLI-288	NH	H	H	CH	N	O
	XLI-289	NMe	H	H	CH	N	O
40	XLI-290	NCHO	H	H	CH	N	O
	XLI-291	NCOMe	H	H	CH	N	O
	XLI-292	CH <sub>2</sub>	Me	H	CH	N	O
	XLI-293	O	Me	H	CH	N	O
45	XLI-294	CHMe	Me	H	CH	N	O
	XLI-295	CH <sub>2</sub>	H	H	CMe	N	O
	XLI-296	CHMe	H	H	CMe	N	O
	XLI-297	CHEt	H	H	CMe	N	O
50	XLI-298	CHF	H	H	CMe	N	O
	XLI-299	C=CH <sub>2</sub>	H	H	CMe	N	O
	XLI-300	O	H	H	CMe	N	O
	XLI-301	S	H	H	CMe	N	O
55	XLI-302	NH	H	H	CMe	N	O
	XLI-303	NMe	H	H	CMe	N	O
	XLI-304	NCHO	H	H	CMe	N	O
	XLI-305	NCOMe	H	H	CMe	N	O
60	XLI-306	CH <sub>2</sub>	Me	H	CMe	N	O
	XLI-307	O	Me	H	CMe	N	O
	XLI-308	CHMe	Me	H	CMe	N	O
65							

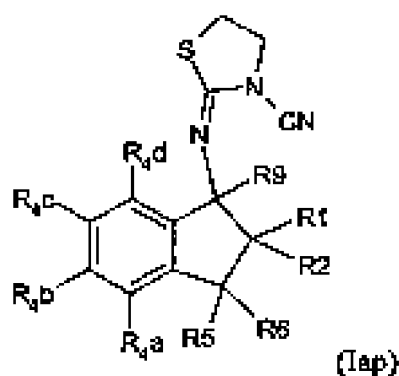
Compuesto N°	Y	R1	R2	Td	Te	Tf
5 XLI-309	CH <sub>2</sub>	H	H	CH	N	S
XLI-310	CHMe	H	H	CH	N	S
XLI-311	CHEt	H	H	CH	N	S
XLI-312	CHF	H	H	CH	N	S
10 XLI-313	C=CH <sub>2</sub>	H	H	CH	N	S
XLI-314	O	H	H	CH	N	S
XLI-315	S	H	H	CH	N	S
XLI-316	NH	H	H	CH	N	S
15 XLI-317	NMe	H	H	CH	N	S
XLI-318	NCHO	H	H	CH	N	S
XLI-319	NCOMe	H	H	CH	N	S
XLI-320	CH <sub>2</sub>	Me	H	CH	N	S
20 XLI-321	O	Me	H	CH	N	S
XLI-322	CHMe	Me	H	CH	N	S
XLI-323	CH <sub>2</sub>	H	H	CMe	N	S
XLI-324	CHMe	H	H	CMe	N	S
25 XLI-325	CHEt	H	H	CMe	N	S
XLI-326	CHF	H	H	CMe	N	S
XLI-327	C=CH <sub>2</sub>	H	H	CMe	N	S
30 XLI-328	O	H	H	CMe	N	S
XLI-329	S	H	H	CMe	N	S
XLI-330	NH	H	H	CMe	N	S
XLI-331	NMe	H	H	CMe	N	S
35 XLI-332	NCHO	H	H	CMe	N	S
XLI-333	NCOMe	H	H	CMe	N	S
XLI-334	CH <sub>2</sub>	Me	H	CMe	N	S
XLI-335	O	Me	H	CMe	N	S
40 XLI-336	CHMe	Me	H	CMe	N	S

45 La tabla XLII estipula 612 compuestos de fórmula Iap

50

55

60

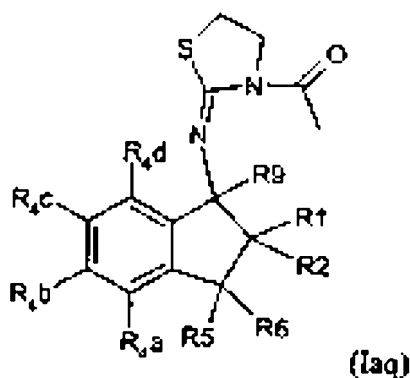


65

donde los valores de R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>4a</sup>, R<sup>4b</sup>, R<sup>4c</sup>, R<sup>4d</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> y R<sup>9</sup> se indican en la tabla 3.

ES 2 353 159 T3

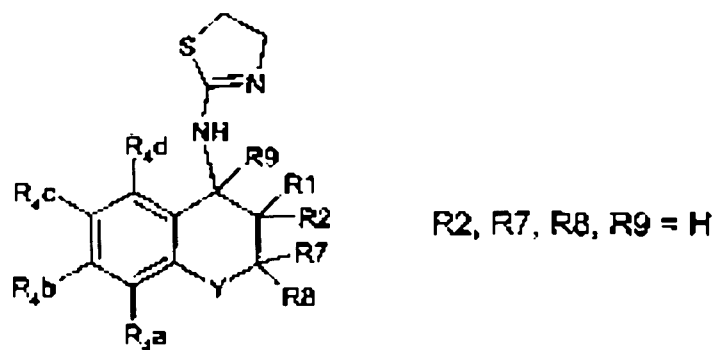
La tabla XLIII estipula 612 compuestos de fórmula Ia<sub>q</sub>



donde los valores de R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>4a</sup>, R<sup>4b</sup>, R<sup>4c</sup>, R<sup>4d</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup> y R<sup>9</sup> se indican en la tabla 3.

25 Las tablas siguientes proporcionan datos de caracterización de los compuestos de las tablas I-XLIII; otros compuestos sólo se describen en estas tablas.

30 Datos de caracterización – TABLA 1



50  
55  
60  
65

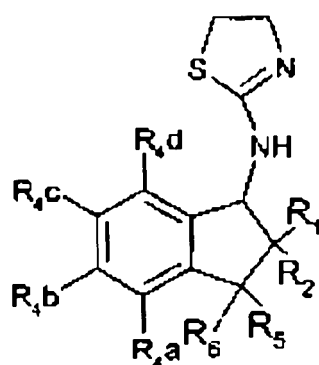
Comp. N°	R <sup>1</sup>	Y	R <sup>4a</sup>	R <sup>4b</sup>	R <sup>4c</sup>	R <sup>4d</sup>	Pt. °C
1.001	H	CH <sub>2</sub>	F	H	H	F	Sólido
1.002	H	CH <sub>2</sub>	H	H	Br	H	167-169
1.003	H	CH <sub>2</sub>	H	H	Cl	H	164-166
1.004	H	CH <sub>2</sub>	H	H	Me	H	158-157
1.005	H	CH <sub>2</sub>	F	H	F	H	175-178
1.006	H	CH <sub>2</sub>	MeO	H	H	MeO	163-165
1.007	H	CH <sub>2</sub>	Me	H	Me	H	153-155
1.008	H	CH <sub>2</sub>	H	H	MeO	H	159-161
1.009	H	CH <sub>2</sub>	H	MeO	H	H	148-150
1.010	H	CH <sub>2</sub>	MeO	H	H	H	178-179
1.011	H	CH <sub>2</sub>	H	Me	MeO	H	141-143
1.012	H	CHMe	H	H	H	H	112-115
1.013	Me	CH <sub>2</sub>	H	H	H	H	166-168
1.014	H	S	H	Me	H	H	234-235

ES 2 353 159 T3

	1.015	H	O	H	Me	H	H	133-134
	1.016	H	CH <sub>2</sub>	OH	H	H	H	Descomp. 100
5	1.017	H	CH <sub>2</sub>	OCH <sub>2</sub> OMe	H	H	H	171
	1.018	H	CH <sub>2</sub>	H	H	H	H	160
	1.019	H	O	Cl	H	H	H	185
	1.020 <sup>a)</sup>	Me	CH <sub>2</sub>	H	H	H	H	resina
10	1.021	H	S	H	H	H	H	resina

a) R2 = Me

Datos de caracterización – TABLA 2



Comp. N°	R1	R2	R5	R6	R4a	R4b	R4c	R4d	Pf. (°C)
2.001 <sup>a)</sup>	H	H	H	H	H	H	H	H	Sólido
2.002	H	H	H	H	H	H	H	H	137
2.003 <sup>b)</sup>	H	H	H	H	H	H	H	H	123
2.004 <sup>c)</sup>	H	H	H	H	H	H	H	H	123
2.005	H	H	H	H	H	F	H	H	136
2.006	H	H	H	H	Me	H	H	H	134
2.007	H	H	H	H	H	H	Me	H	181
2.008	H	H	H	H	Br	H	H	Me	Sólido
2.009	H	H	H	H	Me	H	H	Br	Sólido
2.010	H	H	H	H	H	H	H	OCH <sub>2</sub> OMe	Acete
2.011	H	H	H	H	OCH <sub>2</sub> OMe	H	H	H	Sólido
2.012	H	H	H	H	OH	H	H	H	191
2.013	H	H	H	H	OTf	H	H	H	Resina
2.014	H	H	H	H	Et	H	H	H	Sólido
2.015	H	H	H	H	OH	H	H	H	125 Descomp.
2.016	H	H	H	H	H	H	H	Me	117-120
2.017	H	H	H	H	H	OCH <sub>2</sub> OMe	H	H	150-153
2.018	H	H	H	H	OMe	H	H	H	Sólido
2.019	H	H	H	H	F	H	H	H	149
2.020	H	H	H	H	Cl	H	H	H	124-127
2.021 <sup>c)</sup>	H	H	H	H	Me	H	H	H	119
2.022 <sup>a)</sup>	H	H	H	H	Me	H	H	H	122
2.023	H	H	H	H	F	F	H	H	161
2.024	H	H	H	H	F	H	F	H	145-152
2.025	H	H	H	H	F	H	H	F	182
2.026	H	H	H	H	F	H	Br	H	156
2.027	H	H	Me	Me	H	H	H	H	60-66
2.028	H	H	H	H	F	F	F	H	123

ES 2 353 159 T3

	2.029	H	H	H	H	H	OH	H	H	75 Descomp.
	2.030	H	H	H	H	F	H	F	F	172
5	2.031	H	H	H	H	F	H	Me	H	164
	2.032 <sup>d)</sup>	Me	H	H	H	H	H	H	H	Sólido
	2.033	Me	Me	H	H	H	H	H	H	119
	2.034	Pr	Pr	H	H	H	H	H	H	101-103
10	2.035	H	H	H	H	H	Me	OMe	H	152-153
	2.036	H	H	H	H	F	F	F	F	165
	2.037	H	H	H	H	F	H	Ph	H	Sólido
	2.038	H	H	H	H	F	H	Et	H	148-149
	2.039	H	H	H	H	COOMe	H	H	H	131
15	2.040 <sup>b)</sup>	H	CH <sub>2</sub>	H	H	H	H	H	H	179-175
	2.041	H	H	H	H	PhO	H	H	H	143-146
	2.042	H	H	H	H	NO <sub>2</sub>	H	H	H	144-145
20	2.043	H	H	H	H	(mCF <sub>3</sub> )Ph O	H	H	H	115-116
	2.044	H	H	H	H	CN	H	H	H	Resina
	2.045	H	H	H	H	pClPhO	H	H	H	163-164
	2.046	H	H	H	H	I	H	H	H	170-171
25	2.047	H	H	H	H	Me <sub>3</sub> SiC≡C	H	H	H	Sólido
	2.048	H	H	H	H	HC≡C	H	H	H	Aceite
	2.049	H	H	OB <sub>5</sub>	H	F	H	F	H	Cis Aceite
	2.049	H	H	H	H	H	H	Br	H	Sólido
	2.050	H	H	H	H	H	H	H	Cl	Sólido
30	2.051	H	H	H	H	H	H	H	NHAc	Sólido
	2.052	H	H	H	H	H	H	H	F	171-172
	2.053	H	H	H	H	m-CF <sub>3</sub> - phenyl	H	H	H	103-105
	2.054	H	H	H	H	PhCC-	H	H	H	160-161
35	2.055	H	H	H	H	p-Cl-phenyl	H	H	H	187-188
	2.056	H	H	H	H	vinyl	H	H	H	Sólido
	2.057	H	H	H	H	formyl	H	H	H	142-143
	2.058	H	H	H	H	CHF <sub>2</sub>	H	H	H	116-117
40	2.059	H	H	H	H	MeOCH=N	H	H	H	
	2.060	H	H	N <sub>3</sub>	H	F	H	F	H	Cis resina
	2.061	H	H	SMe	H	F	H	F	H	Cis resina
	2.062	H	H	H	H	CCl <sub>3</sub>	H	H	H	Sólido
45	2.063	H	H	NH <sub>2</sub>	H	F	H	F	H	Trans resina
	2.064	=CH <sub>2</sub>		H	H	H	H	H	H	107-111
	2.065	H	-CH <sub>2</sub> -	H	H	H	H	H	H	Exo 124-129
	2.067	F	H	H	H	F	H	H	H	Trans 142- 144
50	2.068	H	H	SMe	H	SMe	H	F	H	Trans 143- 149
	2.069	F	H	S(O) Me	H	F	H	H	H	Cis sólido
55	2.070	H	H	COO Me	H	H	H	H	H	Cis 105-107

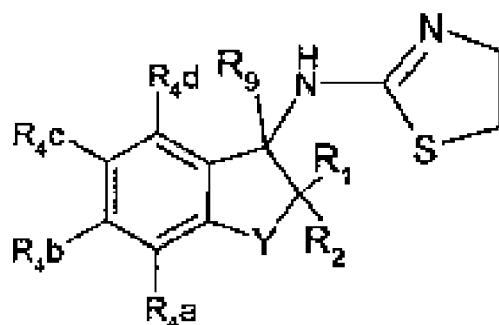
a) Sal de HCL b) S-isómero c) R-isómero D) mezcla de cis y trans e) endo

60

65

# ES 2 353 159 T3

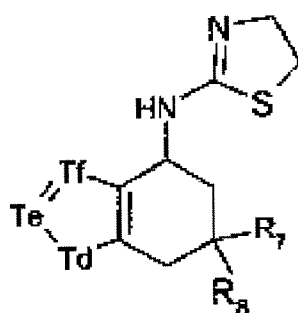
Datos de caracterización – TABLA 3



Comp. N°	Y	CR9-CR1R2	R4a	R4b	R4c	R4d	Pf. (°C)
3.002	O	CH-CF2	Me	H	H	H	162
3.004	CH <sub>2</sub>	CMe-CH2	H	H	H	H	a)

a) <sup>1</sup>H-NMR (300 MHz CDCl<sub>3</sub>) 1.68 (3H, s, Me); 2.18 (1H, m); 2.73 (1H, m); 2.88 (1H, m); 3.03 (1H, m); 3.22 (2H, t); 3.98 (2H, m); 7.27 (4H, m).

Datos de caracterización – TABLA 4



Comp. N°	Td	Te	Tf	R7	R8	Pf.
4.001	S	CH	CH	H	H	147-149
4.002	NMe	CH	H	H	H	154-156
4.003	O	N	CMe	H	H	141-143
4.004	O	CMe	CH	H	H	148-150
4.005	O	CMe	CH	Me	Me	87-89
4.006	O	CH	CH	Me	Me	resina



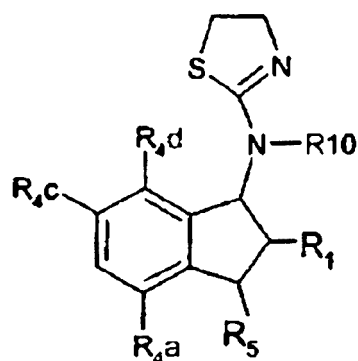
ES 2 353 159 T3

5	6.018	H	H	CHiPr	H	H	H	H	1:1 c.i	aceite
	6.019	H	H	CHMe	H	H	H	H	cis	126
	6.020	H	H	CHMe	H	H	H	H	1:3 c.i	139
	6.021	H	H	C=O	F	H	F	H		144-155
	6.022	F	H	H	F	H	H	H	cis	159
10	6.023	H	H	CHF	F	H	F	H	trans	cnstales marrones
	6.024	H	H	CHF	F	H	F	H	cs	cnstales marrones
	6.025	COO Bu	H	CH <sub>2</sub>	H	H	H	H	trans	99-109
	6.026	COO Me	H	CH <sub>2</sub>	H	H	H	H	trans	aceite amarillo
15	6.027	CH <sub>2</sub> O H	H	CH <sub>2</sub>	H	H	H	H	cis	147-148
	6.028	COO Na	H	CH <sub>2</sub>	H	H	H	H	cis	>200
	6.029	CON HB <sub>n</sub>	H	CH <sub>2</sub>	H	H	H	H	cis	194-198
20	6.030	H	H	CHOMe	F	H	F	H	cis	115-116
	6.031	H	H	O	H	H	H	H		135-158
	6.032	OH	H	CH <sub>3</sub>	H	H	H	H	trans	182-202
	6.033	H	H	CH <sub>2</sub>	H	H	H	OTf		resina marron
25	6.034	H	H	O	CH <sub>3</sub>	H	H	H		137-138
	6.035	H	H	O	H	H	F	H		107-108
	6.036	H	H	O	OMe	H	H	H		144-144
	6.037	H	H	O	Cl	H	H	H		150-151
	6.038	H	H	O	Cl	H	Cl	H		b)
30	6.039	H	H	O	CHF <sub>2</sub>	H	H	H		130-131
	6.040	H	H	O	H	F	H	H		113-114
	6.041	H	H	NC(O)M e	H	H	H	H		160-161

a) <sup>1</sup>H-NMR (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>) 3.39 (2H, t), 3.98 (2H, m); 5.44 (1H, t, J= 8); 5.79 (1H, ddd, J = 49, 8, 6); 7.50 (4H, m).

b) <sup>1</sup>H-NMR (300 MHz CDCl<sub>3</sub>) 3.34 (2H, t); 3.88 (2H, m); 4.38 (NH, b), 4.52 (1H, m); 4.80 (1H, m), 5.40 (1H, m), 7.24 (4H, m).

Datos de caracterización – TABLA 7

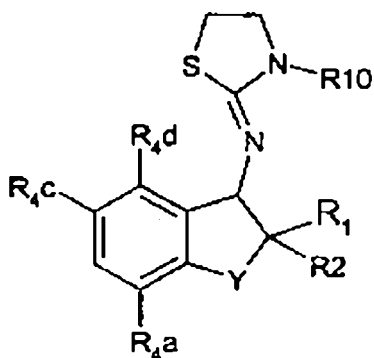


Comp. Nº	R1	R5	R4a	R4c	R4d	R <sup>10</sup>	Pf. (° C)
7.001	H	H	Cl	H	H	OH	115-117

ES 2 353 159 T3

	7.002	H	H	H	H	H	NHBoc		63-64
	7.003	H	H	H	H	H	N=CMe <sub>2</sub>		aceite
	7.004	H	H	H	H	H	N(Ac) <sub>2</sub>		91-92
5	7.005	H	H	H	H	H	NHAc		sólido
	7.006	H	H	F	H	H	OH		142-143
	7.007	H	H	H	H	H	OH		cristales blancos
10	7.008	H	Me	H	H	H	OH	cis	178-179
	7.009	H	Me	H	H	H	OH	trans	cristales blancos
	7.010	H	H	Me	H	H	OH		183
15	7.011	H	H	H	H	H	Me		aceite anaranjado
	7.012	H	H	H	H	H	OMe		aceite anaranjado
	7.013	H	H	H	H	H	NH <sub>2</sub>		103-105

Datos de caracterización – TABLA 8

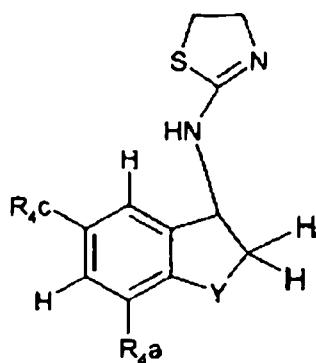


Comp. Nº	R1	R2	Y	R4a	R4c	R4d	R <sup>10</sup>	Isómero	Pf. (°C)
8.001	H	H	CH <sub>2</sub>	Br	H	Me	2-tiazolilo		sólido blanco
8.002	H	H	CH <sub>2</sub>	Me	H	Br	2-tiazolilo		176-181
8.003	H	H	O	H	H	H	2-tiazolilo		cristales beige
8.004	H	H	CHMe	H	H	H	Boc		187-8
8.005	H	H	CHMe	H	H	H	texilMe <sub>2</sub> Si		sólido anaranjado
8.006	H	H	CHMe	H	H	H	iPr <sub>3</sub> Si		sólido
8.007	Me	Me	CH <sub>2</sub>	H	H	H	2-tiazolilo		162-3
8.008	H	H	CH <sub>2</sub>	H	H	Et	2-tiazolilo		111
8.009	H	H	CH <sub>2</sub>	H	H	Me	2-tiazolilo		125
8.010	H	H	C=O	F	F	H	2-tiazolilo		150-162
8.011	H	H	C=O	H	H	H	2-tiazolilo		188
8.012	H	H	CHOH	F	F	H	2-tiazolilo		espuma blanca
8.013	H	H	CH <sub>2</sub>	F	H	H	2-tiazolilo		152-3
8.014	iPr	H	CH <sub>2</sub>	H	H	H	Boc	cis	aceite
8.015	H	H	CH <sub>2</sub>	m(CF <sub>3</sub> )PhO	H	H	CN		resina
8.016	H	H	CH <sub>2</sub>	I	H	H	Boc		aceite
8.017	H	H	CH <sub>2</sub>	H	H	H	CN		90-91
8.018	H	H	CH <sub>2</sub>	F	H	H	CN		99-100
8.019	H	H	CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	H	H	CN		resina
8.020	H	H	CHOBo c	F	F	H	Me	Cis	101-105
8.021	H	H	CHOH	F	F	H	Me	Cis	170-173

ES 2 353 159 T3

	8.022	H	H	CHOH	F	F	H	Boc	Cis	119
	8.023	H	H	C=O	F	F	H	Boc		158
	8.024	H	H	CH <sub>2</sub>	OCHF <sub>2</sub>	H	H	CN		sólido
5	8.025	H	H	CH <sub>2</sub>	F	H	H	acetilo		sólido
	8.026	H	H	CH <sub>2</sub>	Me	H	H	CN		resina
	8.027	H	H	CH <sub>2</sub>	NO <sub>2</sub>	H	H	CN		sólido
10	8.028	H	H	CH <sub>2</sub>	3-CF <sub>3</sub> - fenilo	H	H	CN		resina
	8.029	H	H	CH <sub>2</sub>	PhCC	H	H	CN		sólido
	8.030	H	H	CH <sub>2</sub>	I	H	H	CN		sólido
	8.031	H	H	CH <sub>2</sub>	Me	H	H	acetilo		resina
15	8.032	H	H	CH <sub>2</sub>	CHF <sub>2</sub>	H	H	CN		sólido
	8.033	H	H	CH <sub>2</sub>	H	H	H	Me <sub>2</sub> NCO-		resina
	8.034	H	H	CH <sub>2</sub>	F	H	H	Me <sub>2</sub> NCO		resina
20	8.035	H	H	CH <sub>2</sub>	I	H	H	MeOCH <sub>2</sub>		aceite

Datos de caracterización – TABLA 9



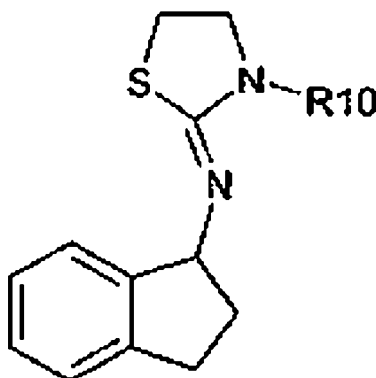
Comp. N°	Y	R4a	R4c	Isómero	Pf. (° C) o tiempo de retención <sup>a</sup>
9.001	CHOC(CF <sub>3</sub> )Ph <sub>2</sub>	F	F	cis	95-103
9.002	C=NOiBu	F	F		0.85
45	9.003	C=NOCH <sub>2</sub> (2,4,5-Cl <sub>3</sub> Ph)	F	F	1.27
	9.004	C=NOBn	F	F	0.95
	9.005	C=NNHC(O)(1-Me-3-CF <sub>3</sub> -pirazol-4-il)	F	F	0.47
50	9.006	C=NNHC(O)NHPh	F	F	0.92
	9.007	C=NO-ailo	F	F	0.43
	9.008	C=NNHC(O)OPh	F	F	0.43
55	9.009	C=NNHSO <sub>2</sub> Ph	F	F	0.79
	9.010	C=NOiBu	F	F	1.00
	9.011	C=NNHC(O)(benzo[1,2,5]tiadiazol-5-il)	F	F	0.31
60	9.012	C=NO-pentafluorofenilo	F	F	1.13
	9.013	C=NNHC(S)NH <i>i</i> Pr	F	F	0.83
	9.014	C=NNHSO <sub>2</sub> Me	F	F	0.17
	9.015	C=NNHC(S)NHMe	F	F	0.18
65	9.016	C=NNHC(O)(2-benciltiofenilo)	F	F	1.01
	9.017	C=NO <i>n</i> Bu	F	F	0.91

ES 2 353 159 T3

9.018	C=NNHTroc	F	F	0.85
9.019	C=NOEt	F	F	0.25
9.020	C=CH <sub>2</sub>	F	F	Sólido
9.021	C=CF <sub>2</sub>	H	H	106-108
9.022	C=NOH	F	F	155
9.023	C=NOMe	F	F	Descomp. 104-114

a) En un sistema HPLC Waters 2795 utilizando una columna Atlantis dC18 3  $\mu$ m, 3 x 20 mm se usaron dos fases móviles. El eluyente A contenía 90% de agua, 10% de MeCN y 0.1% de ácido fórmico. El eluyente B contenía 0.1% de ácido fórmico en MeCN. Durante los primeros 2.5 min se hizo un cambio de gradiente lineal del eluyente de 90% de eluyente A/10% de eluyente B a 100% de eluyente B. Después se usó 100% de eluyente B. La velocidad de flujo fue 1.7 ml/min todo el tiempo. Los compuestos se detectaron por UV usando un arreglo de diodos midiendo longitudes de onda entre 200 nm y 400 nm.

Datos de caracterización – TABLA 10



ES 2 353 159 T3

Comp. N°	R <sup>10</sup>	tiempo de retencion <sup>a</sup>	
5	10.001	C(O)(2,5-dimetil-furan-3-il)	1.02
	10.002	C(O)(1,3-dimetil-pirazol-5-il)	1.05
	10.003	C(O)CH <sub>2</sub> OBn	1.58
	10.004	C(O)OnBu	0.78
10	10.005	C(O)NEt <sub>2</sub>	0.42
	10.006	C(O)iPr	0.70
	10.007	C(O)NPh <sub>2</sub>	1.28
	10.008	C(O)n-heptilo	1.57
15	10.009	C(O)-2 furilo	0.63
	10.010	C(O)CH=CH(p-nitrofenilo)	1.69
	10.011	C(O)Et	0.36
	10.012	C(O)OPh	0.81
20	10.013	C(O)ciclopropilo	0.39
	10.014	C(O)Ph	1.15
	10.015	C(O)OMe	0.18
	10.016	C(O)-1- piperidilo	0.70
25	10.017	C(O)-3,5-dimetil-isoxazol-4-ilo	1.47
	10.018	C(O)isopropenilo	0.27
	10.019	C(O)-O- isopropenilo	0.33
	10.020	C(O)OEt	0.49
30	10.021	C(O)CH <sub>2</sub> C(O)OEt	1.56
	10.022	C(O)CH <sub>2</sub> -2-tienilo	1.33
	10.023	bencilo	aceite
35	10.024	CH <sub>2</sub> OMe	aceite
	10.025	C(O)Me	86-97
	10.026	3-metoxibencilo	Aceite

40 a) En un HPLC Waters 2795 utilizando una columna Atlantis dC18 3  $\mu$ m, 3 x 20 mm se usaron dos fases móviles. El eluyente A contenía 90% de agua, 10% de MeCN y 0.1% de ácido fórmico. El eluyente B contenía 0.1% de ácido fórmico en MeCN. Durante los primeros 2.5 min se hizo un cambio de gradiente lineal del eluyente de 90% de eluyente A/10% de eluyente B a 100% de eluyente B. Después se usó 100% de eluyente B. La velocidad de flujo fue 1.7 ml/min  
 45 todo el tiempo. Los compuestos se detectaron por UV usando un arreglo de diodos midiendo longitudes de onda entre 200 nm y 400 nm.

50

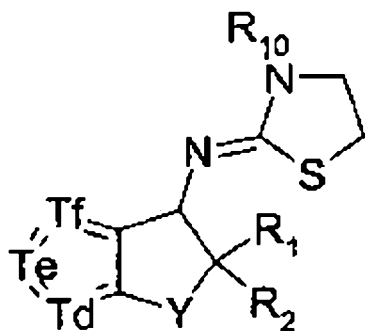
55

60

65

ES 2 353 159 T3

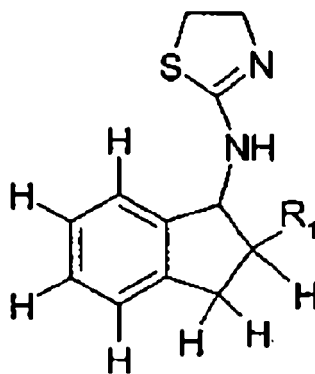
Datos de caracterización – TABLA 11



Comp. N°	Td	Te	Tf	Y	R <sub>1</sub>	R <sub>2</sub>	R <sub>10</sub>	Pf. (° C)
11.001	S	CH	CH	CH <sub>2</sub>	H	H	H	144-145
11.002	S	CH	CH	CH <sub>2</sub>	H	H	CH <sub>2</sub> C≡CH	a)
11.003	CH	CH	S	CH <sub>2</sub>	H	H	H	146-147
11.004	S	CMe	CH	CH <sub>2</sub>	H	H	H	170-172
11.005	S	CH	CH	CH <sub>2</sub>	H	H	C(O)NM <sub>2</sub>	b)

- a. <sup>1</sup>H-NMR (300 MHz CDCl<sub>3</sub>) 2.21 (1H, t), 2.38 (1H, m), 2.83 (2H, m), 3.03 (1H, m), 3.32 (2H, m), 3.56 (2H, m), 4.16 (2H, m); 4.56 (1H, m), 6.83 (1H, d), 7.13 (1H, m)
- b. <sup>1</sup>H-NMR (300 MHz CDCl<sub>3</sub>) 2.38 (1H, m), 2.82 (2H, m), 2.90 (6H, s), 3.02 (1H, m), 3.20 (2H, m); 3.80 (2H, m), 4.16 (2H, m); 4.53 (1H, m), 6.82 (1H, d), 7.13 (1H, m)

Datos de caracterización – TABLA 12



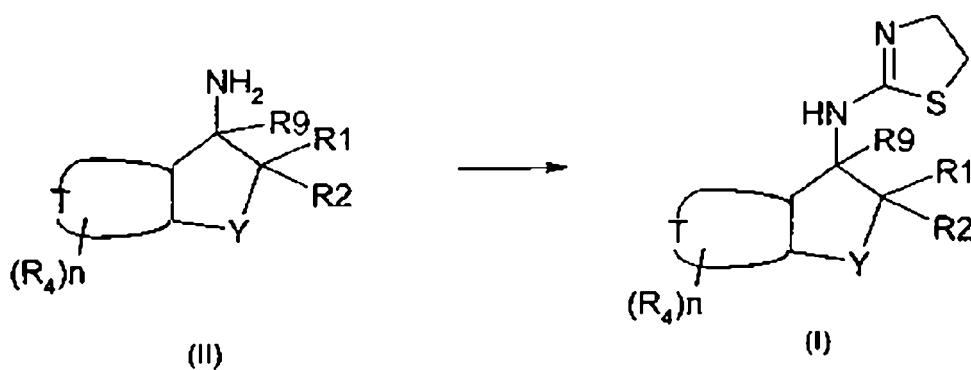
Comp. N°	R1	Pf. (° C)
12.001	nBu	Cis 91-94
12.002	nBu	Trans 80-82
12.003	COnPr	Cis 105-106
12.004	F	Cis Resina

	12.005	C(O)Me	Cis 128-129
5	12.006	C(O)Et	Cis 104-105
	12.007	CH <sub>2</sub> OH	Trans 144-145
	12.008	OAc	Trans Aceite
	12.009	CH <sub>2</sub> OAc	Trans Resina
10	12.010	OMe	Trans 96-98
	12.011	OBz	Trans 117-119
	12.012	CH <sub>2</sub> OMe	Trans Resina
15	12.013	CH <sub>2</sub> OMs	Trans Sólido
	12.014	CH <sub>2</sub> OBn	Trans 140 Descomp.
	12.015	CH <sub>2</sub> SMe	trans resina
20	12.016	CH <sub>2</sub> Ocinamilo	Trans Aceite
	12.017	CH <sub>2</sub> OCH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> tBu	Trans Aceite
	12.018	CH <sub>2</sub> S(O)Me	trans resina
25	12.019	CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> Me	trans resina
	12.020	SePh	Trans Aceite
	12.021 <sup>9)</sup>	CH <sub>2</sub> SH	Trans 141-147
30	12.022	CH <sub>2</sub> SePH	Trans 99-101
	12.023	CH <sub>2</sub> SC(S)NEt <sub>2</sub>	Trans Resina
	12.024	CH <sub>2</sub> CN	Trans 110-113
	12.025	CH <sub>2</sub> SCN	Trans Aceite
35	12.026	CH <sub>2</sub> OpFPh	Trans 127-133
	12.027	CH <sub>2</sub> OPh	Trans 100 Descomp.
	12.028	CH <sub>2</sub> SC(S)OEt	Trans Resina
40	12.029	CO <sub>2</sub> H	trans sólido

g) TFA sal

45 Los compuestos de la invención se pueden preparar mediante una diversidad de métodos, por ejemplo los descritos en Tet. 2006, 62, 513.

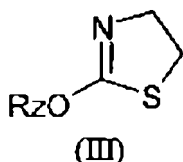
50 Los compuestos de fórmula I se pueden preparar a partir de aminas de fórmula II.



## ES 2 353 159 T3

Los métodos para llevar a cabo esta transformación comprenden A. tratamiento con haloetilisotiocianato según se usa en los ejemplos 3, 8 (paso 6) y 9 (paso 6) utilizando los procedimientos de, por ejemplo, DE 3133918, Indian J. Chem. 1984, 23B, 1243-57 o Heterocycles 1990, 30, 463-9; y B. tratamiento con 2-metiltio-2-tiazolina según se describe en el ejemplo 1 siguiendo los procedimientos de, por ejemplo, J. Am. Chem. Soc. 1958, 80, 3339, J. Org. Chem. 1961, 26, 1666 o J. Med. Chem. 1982, 25, 735-42.

En otro aspecto de la invención se estipula el uso de 2-alcoxi-2-tiazolinas o 2-ariloxi-2-tiazolinas de fórmula (III),



10

15

20

donde  $R_z$  es alquilo o arilo opcionalmente sustituidos como reactivos para la preparación de los compuestos de fórmula I. La transformación utilizando III se describe en los ejemplos 2 y 4. El uso de estos reactivos ofrece ventajas considerables respecto al uso de la 2-metiltio-2-tiazolina correspondiente (consulte el ejemplo 3), ya que la reacción tiene lugar a una temperatura menor (consulte los ejemplos 2 y 4).

25

En la bibliografía se describen otros métodos para convertir aminas en aminotiazolinas y se pueden adaptar para transformar aminas (II) en aminotiazolinas (I). Por lo tanto las aminas se pueden convertir en tioureas y después tratar con 1,2-dibromoetano según se describe en por ejemplo J. Het. Chem. 1986, 23, 1439-42, o también en Ind. J. Chem 1983, 22B, 249-51, o las aminas se pueden tratar a una temperatura mayor con 2-aminotiazolina siguiendo el método de CH 667652.

30

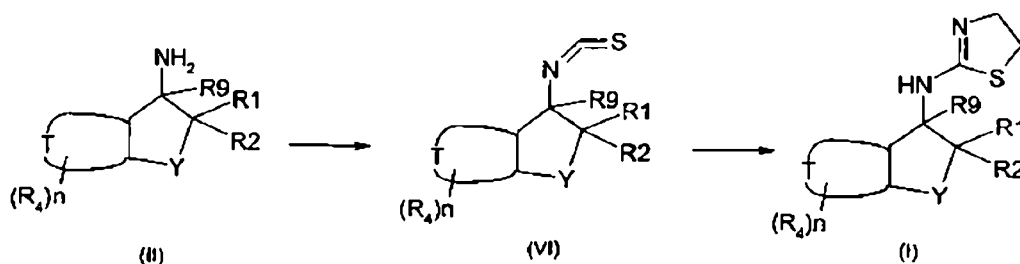
Alternativamente las aminas se pueden convertir en tioureas y después tratar con 2-bromoetilamina según se describe en Bioorg. Med. Chem. 2001, 9, 2025.

35

Como otra alternativa las aminas (II) se pueden convertir en isotiocianatos (VI) y después tratar con 2-haloetilamina según se describe en por ejemplo J. Org. Chem. 1983, 48, 3901-8 o también en J. Med. Chem. 1987, 30, 1955-62.

40

45



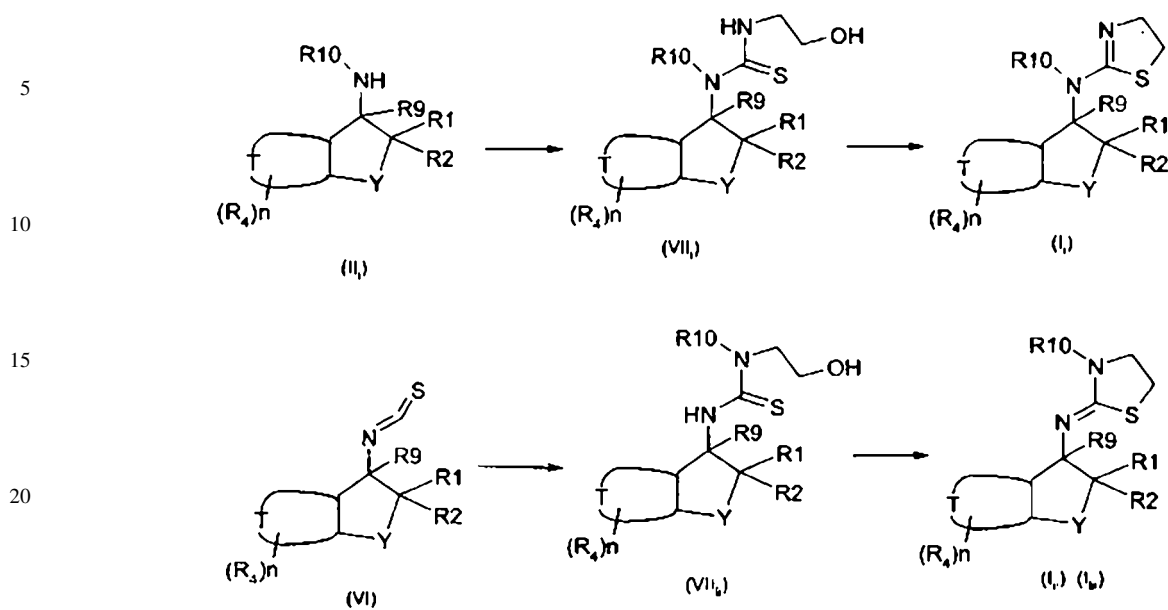
50

55

Las aminas (III) se pueden usar para preparar 2-hidroxi-2-tioureas (VII<sub>i</sub>), según los métodos que se encuentran en Houben-Weyl E4, (1983) 484, por ejemplo usando tiofósgeno en un primer paso, y después en un segundo paso 2-hidroxi-2-tioureas (VII<sub>ii</sub>) se pueden preparar a partir de isotiocianatos (VI) según se describe en el ejemplo 11. Cada una de esas tioureas se puede ciclar en la tiazolina (I) correspondiente, por ejemplo con ácido, según se describe por ejemplo en US 4398028 y en Tet. Lett. 2003, 44, 795-9, o con Ph<sub>3</sub>P y DEAD según se describe en Tet. Lett. 1999, 40, 3125 y también según se describe en el ejemplo 11. Si R<sup>10</sup> es H, entonces (II) y (II<sub>i</sub>) son idénticos, (VII<sub>i</sub>) y (VII<sub>ii</sub>) son idénticos, y (I<sub>i</sub>), (I<sub>ii</sub>) y (I<sub>iii</sub>) son tautómeros del mismo compuesto.

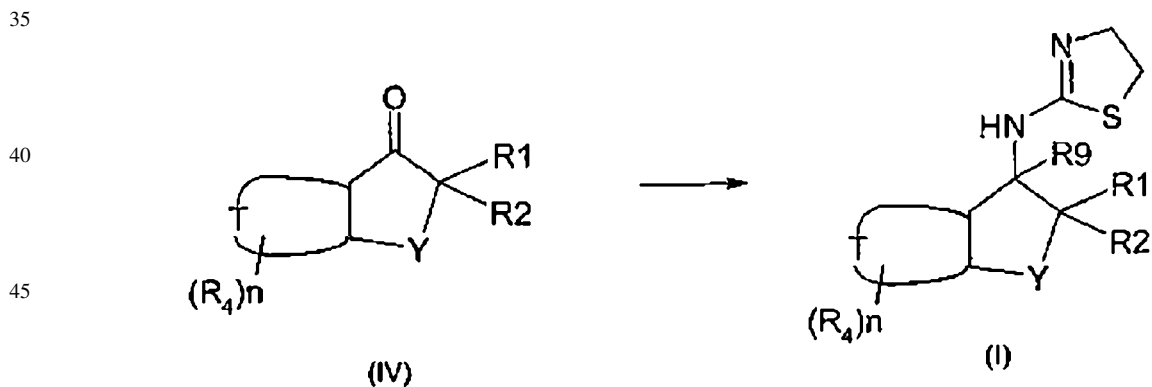
60

65



Las aminas (II) se pueden convertir en isotiocyanatos (VI) y después tratar con aziridina para obtener las tioureas correspondientes que después se pueden reorganizar en aminotiazolinas según se describe por ejemplo en Arch. Pharm. 1958, 291, 457 o también en J. Amer. Chem. Soc. 1961, 83, 2570.

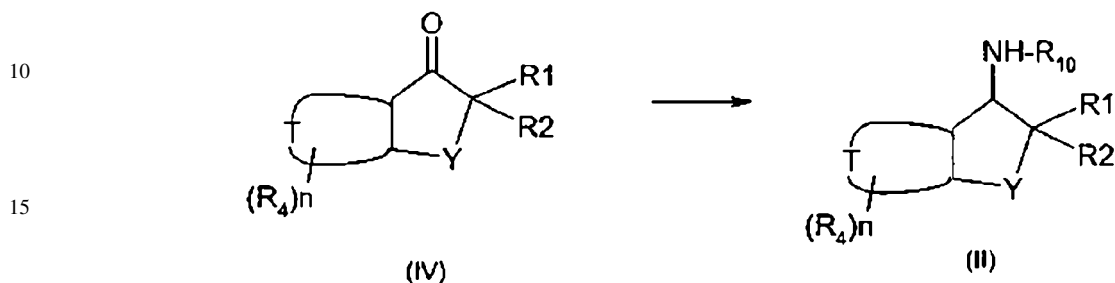
Los compuestos de fórmula I donde R<sup>9</sup> y R<sup>10</sup> son H se pueden preparar a partir de cetonas de fórmula IV.



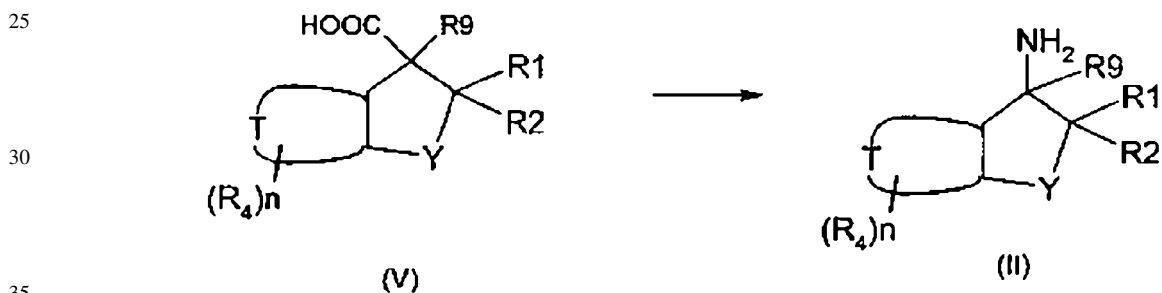
Por lo tanto la cetona y la 2-aminotiazolina se tratan con un agente, que adsorbe, absorbe, o reacciona con agua como tetraalcoxido de titanio para producir un producto intermedio imina o enamina, que luego se trata con un reductor como borohidruro de sodio para producir la aminotiazolina (I). Un ejemplo de este método se describe en el ejemplo 8. La reacción de las cetonas con aminas primarias usando agentes desecantes y reductores para formar aminas secundarias se conoce como aminación reductiva y se describe por ejemplo en Organic Reactions 2002, 59, 1-714.

Los compuestos de fórmula I donde R<sup>10</sup> no es H se pueden preparar a partir de compuestos de fórmula I donde R<sup>10</sup> es hidrógeno, mediante tratamiento con un agente de derivatización adecuado. Cuando R<sup>10</sup> es un grupo acilo, se pueden usar acilantes. Cuando R<sup>10</sup> es un grupo alquilo, se pueden usar agentes alquilantes. Cuando R<sup>10</sup> es un grupo sulfenilo, se pueden usar agentes de sulfenilantes. La derivatización de esta manera es bien conocida. Las descripciones y los métodos para estas transformaciones se pueden encontrar en T. W. Greene y P. G. M. Wuts "Protective Groups in Organic Synthesis" 3ª edición, Wiley, N.Y, 1999. El grupo R<sup>10</sup> también se puede introducir a través de un precursor sintético de los compuestos de fórmula I, por ejemplo a través de una amina de fórmula II, o a través de una hidroxietilamina N-R<sup>10</sup> sustituida.

Las aminas de fórmula (II) se pueden preparar de diversas maneras. Por lo tanto las cetonas (IV) se pueden convertir en aminas de fórmula (II) en las que R<sup>9</sup> es H. Un método para esta transformación implica la aminación reductiva por ejemplo de acuerdo con el ejemplo 7 y Tetrahedron 2004, 60, 1463-71. Esta transformación también se puede llevar a cabo en dos pasos a través de una oxima y la subsiguiente reducción según se ejemplifica en el ejemplo 9 y en el ejemplo 1 de producto intermedio.



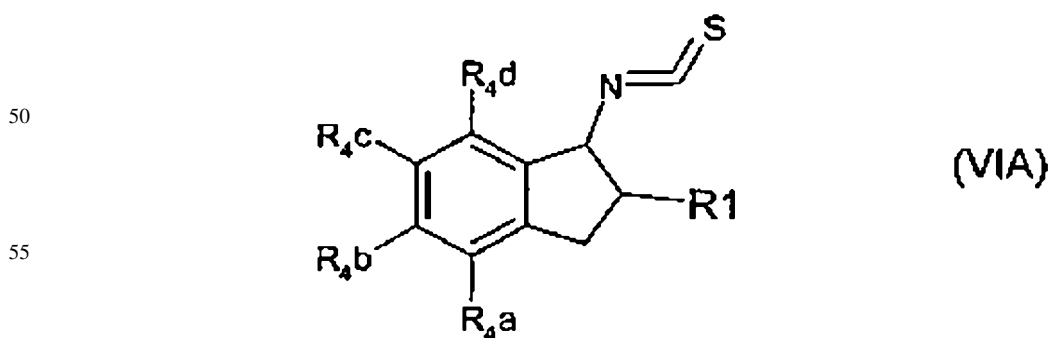
20 Las aminas de fórmula (II) también se pueden preparar a partir de ácidos carboxílicos (V), mediante una degradación de Curtius según se muestra en el ejemplo 5.



40 Las aminas de fórmula (II), en las que Y es oxígeno son parcialmente conocidas o se pueden preparar por métodos conocidos como los descritos en Chimica Acta Turica, 13(3), 403-412 (1985) y Farmaco, Edizione Scientifica, 43(7-8), 643-655 (1988).

Algunos de los isotiocyanatos de fórmula (VI) son nuevos y son parte de esta invención.

Los compuestos nuevos son los de la fórmula VIA



60 donde R<sup>1</sup>, R<sup>4a</sup>, R<sup>4b</sup>, R<sup>4c</sup> y R<sup>4d</sup> son cada uno independientemente H, halógeno, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>alquilo o C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>haloalquilo, y donde al menos uno de estos sustituyentes debe ser diferente de H.

65

ES 2 353 159 T3

Los compuestos preferidos de fórmula (VIA) son aquellos en los que los valores R<sub>1</sub>, R<sub>4a</sub>, R<sub>4b</sub>, R<sub>4c</sub> y R<sub>4d</sub> se indican en la tabla 9.

5

TABLA 9

Compuesto N°	R <sub>1</sub>	R <sub>4a</sub>	R <sub>4b</sub>	R <sub>4c</sub>	R <sub>4d</sub>
VIA-1	H	F	H	H	H
VIA-2	H	CH <sub>3</sub>	H	H	H
VIA-3	H	F	H	F	H
VIA-4	H	F	H	CH <sub>3</sub>	H
VIA-5	H	F	H	H	F
VIA-6	H	CH <sub>3</sub>	H	F	H
VIA-7	F	H	H	H	H
VIA-8	CH <sub>3</sub>	H	H	H	H
VIA-9	F	F	H	H	H
VIA-10	F	CH <sub>3</sub>	H	H	H
VIA-11	F	F	H	F	H
VIA-12	F	F	H	CH <sub>3</sub>	H
VIA-13	F	F	H	H	F
VIA-14	CH <sub>3</sub>	F	H	H	H
VIA-15	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	H	H
VIA-16	CH <sub>3</sub>	F	H	F	H
VIA-17	CH <sub>3</sub>	F	H	CH <sub>3</sub>	H
VIA-18	CH <sub>3</sub>	F	H	H	F

35

Los compuestos de fórmula (I) se pueden usar para combatir y controlar infecciones por plagas de insectos Lepidoptera, Diptera, Hemiptera, Thysanoptera, Orthoptera, Dictyoptera, Coleoptera, Siphonaptera, Hymenoptera e Isoptera y también otras plagas de invertebrados, por ejemplo plagas de ácaros, nematodos y moluscos. Los insectos, ácaros, nematodos y moluscos son denominados colectivamente plagas de aquí en adelante. Las plagas que se pueden combatir y controlar utilizando los compuestos de la invención incluyen las plagas asociadas a la agricultura (donde dicho término incluye el crecimiento de cultivos para alimento y los productos de fibra), horticultura y cría de animales, animales de compañía, forestación y almacenamiento de productos de origen vegetal (como frutas, granos y madera); las plagas asociadas a daño a estructuras fabricadas por el hombre y en la transmisión de enfermedades del hombre y los animales; y también plagas molestas (como las moscas).

Los ejemplos de especies de plagas que pueden ser controladas por los compuestos de fórmula (I) incluyen: *Myzus persicae* (áfido), *Aphis gossypii* (áfido), *Aphis fabae* (áfido), *Lygus* spp. (chinchas), *Dysdercus* spp. (chinchas), *Nilaparvata lugens* (saltahojas), *Nephotettix inciticeps* (chicharrita), *Nezara* spp. (chinchas hediondas), *Euschistus* spp. (chinchas hediondas), *Leptocoris* spp. (chinchas hediondas), *Frankliniella occidentalis* (trip), *Thrips* spp. (trips), *Leptinotarsa decemlineata* (escarabajo de la patata), *Anthonomus grandis* (picudo mexicano del algodón), *Aonidiella* spp. (cochinillas), *Trialeurodes* spp. (moscas blancas), *Bemisia tabaci* (mosca blanca), *Ostrinia nubilalis* (barrenador del maíz europeo), *Spodoptera littoralis* (rosquilla negra), *Heliothis virescens* (gusano cogollero del tabaco), *Helicoverpa armigera* (gusano nativo), *Helicoverpa zea* (gusano elotero), *Sylepta derogata* (cigarrero del algodón), *Pieris brassicae* (mariposa blanca), *Plutella xylostella* (palomilla dorso de diamante), *Agrotis* spp. (gusanos cortadores), *Chilo suppressalis* (barrenador del arroz), *Locusta migratoria* (langosta), *Chortiocetes terminifera* (langosta), *Diabrotica* spp. (gusanos de la raíz), *Panonychus ulmi* (arañuela roja europea), *Panonychus citri* (ácaro rojo de los cítricos), *Tetranychus urticae* (araña de dos puntos), *Tetranychus cinnabarinus* (araña roja), *Phyllocoptruta oleivora* (ácaro del tostado), *Polyphagotarsonemus latus* (araña blanca), *Brevipalpus* spp. (falsa araña roja), *Boophilus microplus* (garrapata del ganado), *Dermacentor variabilis* (garrapata del perro americano), *Ctenocephalides felis* (pulga del gato), *Liriomyza* spp. (minador de hojas), *Musca domestica* (mosca doméstica), *Aedes aegypti* (mosquito), *Anopheles* spp. (mosquitos), *Culex* spp. (mosquitos), *Lucillia* spp. (moscas blow fly), *Blattella germanica* (cucaracha), *Periplaneta americana* (cucaracha), *Blatta orientalis* (cucaracha), termitas de la Mastotermitidae (por ejemplo *Mastotermites* spp.), la Kalotermitidae (por ejemplo *Neotermites* spp.), la Rhinotermitidae (por ejemplo *Coptotermes formosanus*, *Reticulitermes flavipes*, *R. speratu*, *R. virginicus*, *R. hesperus* y *R. santonensis*) y la Termitidae (por ejemplo *Globitermes sulphureus*), *Solenopsis geminata* (hormiga de fuego), *Monomorium pharaonis* (hormiga faraona), *Damalinea* spp. y *Linognathus* spp. (piojos chupadores), y *Deroceras reticulatum* (babosa).

65

## ES 2 353 159 T3

Por lo tanto la invención estipula un método para combatir y controlar insectos, ácaros o moluscos que comprende aplicar una cantidad insecticidamente, acaricidamente, nematocidamente o moluscicidamente eficaz de un compuesto de fórmula (I), o una composición que contiene un compuesto de fórmula (I), a una plaga, al sitio de una plaga, o a una planta susceptible de ser atacada por una plaga. Los compuestos de fórmula (I) se usan preferentemente contra insectos o ácaros.

El término “planta” como se usa aquí incluye plántulas, arbustos y árboles.

Para aplicar un compuesto de fórmula (I) como un insecticida, acaricida, nematocida o moluscicida a una plaga, al sitio de una plaga, o a una planta susceptible de ser atacada por una plaga, un compuesto de fórmula (I) se formula generalmente como una composición que incluye, además del compuesto de fórmula (I), un diluyente o excipiente inerte adecuado y, opcionalmente, un tensioactivo (SFA). Los tensioactivos son productos químicos capaces de modificar las propiedades de una interfase (por ejemplo, interfases líquido/sólido, líquido/aire o líquido/líquido) reduciendo la tensión interfasal y por consiguiente produciendo cambios en otras propiedades (por ejemplo, dispersión, emulsión y humectación). Se prefiere que todas las composiciones (tanto las formulaciones sólidas como las líquidas) comprendan, en peso, 0.0001 a 95%, más preferentemente 1 a 85%, por ejemplo 5 a 60%, de un compuesto de fórmula (I). La composición se usa generalmente para el control de plagas de modo de aplicar un compuesto de fórmula (I) a una dosis de 0.1 g a 10 kg por hectárea, preferentemente de 1 g a 6 kg por hectárea, más preferentemente de 1 g a 1 kg por hectárea.

Cuando se usa un compuesto de fórmula (I) en desinfección de semillas, se usa a una dosis de 0.0001 g a 10 g (por ejemplo 0.001 g o 0.05 g), preferentemente de 0.005 g a 10 g, más preferentemente de 0.005 g a 4 g, por kilogramo de semilla.

En otro aspecto la presente invención estipula una composición insecticida, acaricida, nematocida o moluscicida que comprende una cantidad insecticidamente, acaricidamente, nematocidamente o moluscicidamente eficaz de un compuesto de fórmula (I) y un excipiente o diluyente adecuado para ese fin. La composición es preferentemente una composición insecticida, acaricida, nematocida o moluscicida.

Incluso en otro aspecto la invención estipula un método para combatir y controlar plagas en un sitio que comprende tratar las plagas o el sitio de las plagas con una cantidad insecticidamente, acaricidamente, nematocidamente o moluscicidamente eficaz de una composición que contiene un compuesto de fórmula (I). Los compuestos de fórmula (I) se usan preferentemente contra insectos, ácaros o nematodos.

Las composiciones se pueden elegir entre una serie de tipos de formulación, que incluyen polvos espolvoreables (DP), polvos solubles (SP), gránulos solubles en agua (SG), gránulos dispersables en agua (WG), polvos humectables (WP), gránulos (GR) (de liberación lenta o rápida), concentrados solubles (SL), líquidos miscibles con aceite (OL), líquidos de ultra bajo volumen (UL), concentrados emulsionables (EC), concentrados dispersables (DC), emulsiones (tanto de aceite en agua (EW) como de agua en aceite (EO)), microemulsiones (ME), suspensiones concentradas (SC), aerosoles, formulaciones para nebulización/humo, suspensiones de cápsulas (CS) y formulaciones para tratamiento de semillas. El tipo de formulación elegido en cualquier caso dependerá del propósito particular al que está destinada y de las propiedades físicas, químicas y biológicas del compuesto de fórmula (I).

Los polvos espolvoreables (DP) se pueden preparar mezclando un compuesto de fórmula (I) con uno o más diluyentes sólidos (por ejemplo arcillas naturales, caolín, pirofilita, bentonita, alúmina, montmorillonita, diatomita, tiza, tierras diatómeas, fosfatos de calcio, carbonatos de calcio y magnesio, azufre, cal, harinas, talco y otros excipientes sólidos orgánicos e inorgánicos) y moliendo mecánicamente la mezcla hasta un polvo fino.

Los polvos solubles (SP) se pueden preparar mezclando un compuesto de fórmula (I) con una o más sales inorgánicas solubles en agua (como bicarbonato de sodio, carbonato de sodio o sulfato de magnesio) o uno o más sólidos orgánicos solubles en agua (como un polisacárido) y, opcionalmente, uno o más humectantes, uno o más dispersantes o una mezcla de dichos agentes para mejorar la dispersabilidad/solubilidad en agua. Después la mezcla se muele hasta un polvo fino. Composiciones similares también se pueden granular para formar gránulos solubles en agua (SG).

Los polvos humectables (WP) se pueden preparar mezclando un compuesto de fórmula (I) con uno o más diluyentes o excipientes sólidos, uno o más humectantes y, preferentemente, uno o más dispersantes y, opcionalmente, uno o más agentes de suspensión para facilitar la dispersión en líquidos. Después la mezcla se muele hasta un polvo fino. Composiciones similares también se pueden granular para formar gránulos dispersables en agua (WG).

Los gránulos (GR) también se pueden formar o bien granulando una mezcla de un compuesto de fórmula (I) y uno o más diluyentes o excipientes sólidos en polvo, o a partir de gránulos inertes preformados, mediante absorción de un compuesto de fórmula (I) (o una solución de éste, en un agente adecuado) en un material granular poroso (como piedra pómez, arcillas de atapulgita, tierra de batán, diatomita, tierras diatómeas o mazorcas de maíz molidas) o adsorbiendo un compuesto de fórmula (I) (o una solución de éste en un agente adecuado) en un material de núcleo duro (como arenas, silicatos, carbonatos, sulfatos o fosfatos minerales) y secando si fuera necesario. Los agentes que se usan comúnmente para ayudar en la absorción o adsorción incluyen solventes (como solventes de petróleo alifáticos y aromáticos, alcoholes, éteres, cetonas y ésteres) y adhesivos (como acetatos de polivinilo, alcoholes polivinílicos, dextrinas, azúcares y aceites vegetales). También se pueden incluir en los gránulos uno o más aditivos (por ejemplo un emulsionante, un humectante o un dispersante).

## ES 2 353 159 T3

Los concentrados dispersables (DC) se pueden preparar disolviendo un compuesto de fórmula (I) en agua o un solvente orgánico, como una cetona, un alcohol o un éter glicólico. Estas soluciones pueden contener un tensioactivo (por ejemplo para mejorar la dilución en agua o para evitar la cristalización en un tanque de aspersión).

5 Los concentrados emulsionables (EC) o las emulsiones de aceite en agua (EW) se pueden preparar disolviendo un compuesto de fórmula (I) en un solvente orgánico (que contenga opcionalmente uno o más humectantes, uno o más emulsionantes o una mezcla de dichos agentes). Los solventes orgánicos adecuados para usar en los EC incluyen hidrocarburos aromáticos (como alquilbencenos o alquilnaftalenos, ejemplificados por SOLVESSO 100, SOLVESSO 150 y SOLVESSO 200; (SOLVESSO es una marca registrada), cetonas (como ciclohexanona o metilciclohexanona) y alcoholes (como alcohol bencílico, alcohol furfúrico o alcohol butílico), N-alquilpirrolidonas (como N-metilpirrolidona o N-octilpirrolidona), dimetilamidas de ácidos grasos (como dimetilamida de un ácido graso C<sub>8</sub>-C<sub>10</sub>) e hidrocarburos clorados. Un producto EC se puede emulsionar espontáneamente al agregarlo a agua, para producir una emulsión con estabilidad suficiente para permitir la aplicación por aspersión a través de un equipo adecuado. La preparación de una EW implica obtener un compuesto de fórmula (I) ya sea líquido (si no es líquido a temperatura ambiente, se debe fundir a una temperatura razonable, generalmente por debajo de 70°C) o en solución (disolviéndolo en un solvente adecuado) y después emulsionando el líquido resultante o la solución en agua que contenga uno o más tensioactivos, en alto cizallamiento, para producir una emulsión. Los solventes adecuados para usar en las EW incluyen aceites vegetales, hidrocarburos clorados (como clorobencenos), solventes aromáticos (como alquilbencenos o alquilnaftalenos) y otros solventes orgánicos adecuados que tengan baja solubilidad en agua.

20 Las microemulsiones (ME) se pueden preparar mezclando agua con una mezcla de uno o más solventes con uno o más tensioactivos, para producir espontáneamente una formulación líquida isotrópica termodinámicamente estable. Un compuesto de fórmula (I) está presente inicialmente en el agua o en la mezcla de solvente/tensioactivo. Los solventes adecuados para usar en las ME incluyen los descritos precedentemente para usar en los EC (concentrados emulsionables) o en las EW (emulsiones de aceite en agua). Una ME puede ser un sistema de aceite en agua o de agua en aceite (cuál sistema está presente se puede determinar por mediciones de conductividad) y puede ser adecuada para mezclar plaguicidas solubles en agua y solubles en aceite en la misma formulación. Una ME es adecuada para la dilución en agua, quedando como una microemulsión o formando una emulsión de aceite en agua convencional.

30 Las suspensiones concentradas (SC) pueden comprender suspensiones acuosas o no acuosas de partículas sólidas insolubles finamente divididas de un compuesto de fórmula (I). Las SC se pueden preparar moliendo con perlas o bolas el compuesto sólido de fórmula (I) en un medio adecuado, opcionalmente con uno o más dispersantes, para producir una suspensión de partículas finas del compuesto. Se pueden incluir uno o más humectantes en la composición y se puede incluir un agente de suspensión para reducir la velocidad a la cual sedimentan las partículas. Alternativamente, un compuesto de fórmula (I) se puede moler en seco y luego agregar a agua que contenga los agentes descritos precedentemente para producir el producto final deseado.

40 Las formulaciones en aerosol comprenden un compuesto de fórmula (I) y un propelente adecuado (por ejemplo *n*-butano). Un compuesto de fórmula (I) también se puede disolver o dispersar en un medio adecuado (por ejemplo agua o un líquido miscible con agua, como *n*-propanol) para proveer composiciones para usar en bombas de aspersión, no presurizadas, accionadas a mano.

45 Un compuesto de fórmula (I) se puede mezclar en estado seco con una mezcla pirotécnica para formar una composición adecuada para generar, en un espacio cerrado, un humo que contenga el compuesto.

50 Las suspensiones de cápsulas (CS) se pueden preparar de manera similar a la preparación de las formulaciones tipo EW pero con una etapa de polimerización adicional de modo de obtener una dispersión acuosa de gotas de aceite, en la cual cada gota de aceite es encapsulada por una cubierta polimérica y contiene un compuesto de fórmula (I) y, opcionalmente, un excipiente o diluyente para ese fin. La cubierta polimérica se puede producir mediante una reacción de policondensación entre las fases o mediante un procedimiento de coacervación. Las composiciones pueden proporcionar la liberación controlada del compuesto de fórmula (I) y se pueden usar para el tratamiento de semillas. Un compuesto de fórmula (I) también se puede formular en una matriz polimérica biodegradable para proporcionar una liberación controlada, lenta, del compuesto.

55 Una composición puede incluir uno o más aditivos para mejorar las características biológicas de la composición (por ejemplo mejorar la humectación, la retención o la distribución sobre superficies; la resistencia a la lluvia en superficies tratadas; o la absorción o movilidad de un compuesto de fórmula (I)). Dichos aditivos incluyen tensioactivos, aditivos para aspersión a base de aceites, por ejemplo ciertos aceites minerales o aceites vegetales naturales (como aceite de soja y de colza), y mezclas de éstos con otros coadyuvantes biomejoradores (ingredientes que pueden ayudar o modificar la acción de un compuesto de fórmula (I)).

65 Un compuesto de fórmula (I) también se puede formular para usar en tratamiento de semillas, por ejemplo como una composición en polvo, que incluye un polvo para tratamiento de semillas en seco (DS), un polvo soluble en agua (SS) o un polvo dispersable en agua para tratamiento con una suspensión (WS), o como una composición líquida, que incluye un concentrado que fluye (FS), una solución (LS) o una suspensión de cápsulas (CS). La preparación de composiciones DS, SS, WS, FS y LS es muy similar, respectivamente, a la de las composiciones DP, SP, WP, SC y DC descritas antes. Las composiciones para tratar semillas pueden incluir un agente que favorezca la adhesión de la composición a la semilla (por ejemplo un aceite mineral o una barrera formadora de película).

## ES 2 353 159 T3

Los humectantes, dispersantes y emulsionantes pueden ser tensioactivos de tipo catiónico, aniónico, anfótero o no iónico.

5 Los tensioactivos adecuados de tipo catiónico incluyen compuestos de amonio cuaternario (por ejemplo bromuro de cetiltrimetilamonio), imidazolinas y sales de aminas.

10 Los tensioactivos aniónicos adecuados incluyen sales de metales alcalinos de ácidos grasos, sales de monoésteres alifáticos de ácido sulfúrico (por ejemplo laurilsulfato de sodio), sales de compuestos aromáticos sulfonados (por ejemplo dodecibencenosulfonato de sodio, dodecibencenosulfonato de calcio, sulfonato de butilnaftaleno y mezclas de di-*isopropil*- y tri-*isopropil*-naftalenosulfonatos de sodio), éter sulfatos, alcohol éter sulfatos (por ejemplo laureth-3-sulfato de sodio), éter carboxilatos (por ejemplo laureth-3-carboxilato de sodio), ésteres fosfato (productos de la reacción entre uno o más alcoholes grasos y ácido fosfórico (predominantemente monoésteres) o pentóxido de fósforo (predominantemente diésteres), por ejemplo la reacción entre lauril alcohol y ácido tetrafosfórico; además estos productos pueden estar etoxilados), sulfosuccinamatos, sulfonatos de parafina u olefina, tauratos y lignosulfonatos.

15 Los tensioactivos adecuados de tipo anfótero incluyen betaínas, propionatos y glicinatos.

20 Los tensioactivos adecuados de tipo no iónico incluyen productos de condensación de óxidos de alquileo, como óxido de etileno, óxido de propileno, óxido de butileno o sus mezclas, con alcoholes grasos (como oleil alcohol o cetil alcohol) o con alquifénoles (como octilfenol, nonilfenol u octilcresol); ésteres parciales derivados de ácidos grasos de cadena larga o anhídridos de hexitol; productos de condensación de dichos ésteres parciales con óxido de etileno; polímeros de bloque (que comprenden óxido de etileno y óxido de propileno); alcanolamidas; ésteres simples (por ejemplo ésteres de polietilenglicol de ácidos grasos); óxidos de aminas (por ejemplo óxido de lauril dimetil amina); y lecitinas.

25 Los agentes de suspensión adecuados incluyen coloides hidrófilos (como polisacáridos, polivinilpirrolidona o carboximetilcelulosa sódica) y arcillas expansibles (como bentonita o atapulgita).

30 Un compuesto de fórmula (I) se puede aplicar mediante cualquiera de los medios conocidos de aplicación de compuestos plaguicidas. Por ejemplo, se puede aplicar, formulado o sin formular, a las plagas o al sitio de las plagas (como el habitat de las plagas, o a una planta en crecimiento propensa a la infección por plagas) o a cualquier parte de la planta, incluidos el follaje, los tallos, las ramas o raíces, a la semilla antes de ser plantada o a cualquier otro medio en el cual las plantas estén creciendo o se vayan a plantar (como el suelo que rodea las raíces, o el suelo en general; el agua del arrozal o de sistemas de cultivo hidropónico), directamente o puede ser asperjado sobre, espolvoreado sobre, 35 aplicado por inmersión, aplicado como una formulación en crema o pasta, aplicado como un vapor o aplicado a través de la distribución o incorporación de una composición (como una composición granular o una composición envasada en una bolsa soluble en agua) en el suelo o en un ambiente acuoso.

40 Un compuesto de fórmula (I) también se puede inyectar en las plantas o asperjar sobre la vegetación usando técnicas de asperjado electrodinámico u otros métodos de bajo volumen, o aplicar mediante sistemas de irrigación terrestres o aéreos.

45 Las composiciones para usar como preparaciones acuosas (soluciones o dispersiones acuosas) se suministran generalmente en forma de un concentrado que contiene una gran proporción del principio activo y el concentrado se agrega al agua antes de usar. Estos concentrados, que pueden incluir DC, SC, EC, EW, ME, SG, SP, WP, WG y CS, a menudo es necesario que resistan el almacenamiento durante períodos prolongados y, luego de dicho almacenamiento, que sean capaces de ser agregados al agua para formar preparaciones acuosas que permanezcan homogéneas durante un tiempo suficiente para permitir que sean aplicados mediante equipos de aspersión convencionales. Dichas preparaciones acuosas pueden contener cantidades variables de un compuesto de fórmula (I) (por ejemplo 0.0001 a 10%, en peso) dependiendo del propósito para el cual van a ser utilizadas.

50 Un compuesto de fórmula (I) se puede usar en mezclas con fertilizantes (por ejemplo fertilizantes que contengan nitrógeno, potasio o fósforo). Los tipos de formulación adecuados incluyen los gránulos de fertilizante. Las mezclas adecuadas contienen hasta 25% en peso del compuesto de fórmula (I).

55 Por consiguiente, la invención también estipula una composición fertilizante que contiene un fertilizante y un compuesto de fórmula (I).

60 Las composiciones de esta invención pueden contener otros compuestos que tengan actividad biológica, por ejemplo micronutrientes o compuestos que tengan actividad fungicida o que posean actividad reguladora del crecimiento de la planta, herbicida, insecticida, nematocida o acaricida.

65 El compuesto de fórmula (I) puede ser el único principio activo de la composición o puede estar mezclado con uno o más principios activos adicionales como un plaguicida, un fungicida, un producto sinérgico, un herbicida o un regulador del crecimiento de la planta, cuando sea adecuado. Un principio activo adicional puede: proporcionar una composición que tenga un espectro de actividad más amplio o una mayor persistencia en el sitio; potenciar la actividad o complementar la actividad (por ejemplo aumentando la velocidad del efecto o superando la repelencia) del compuesto de fórmula (I); o ayudar a superar o evitar el desarrollo de resistencia a los componentes individuales. El

## ES 2 353 159 T3

principio activo adicional particular dependerá de la utilidad a la cual está destinada la composición. Los ejemplos de plaguicidas adecuados incluyen los siguientes:

- a) Piretroides, como permetrina, cipermetrina, fenvalerato, esfenvalerato, deltametrina, cihalotrina (en particular lambda-cihalotrina), bifentrina, fenpropatrina, ciflutrina, teflutrina, piretroides inocuos para los peces (por ejemplo etofenprox), piretrina natural, tetrametrina, s-bioaletrina, fenflutrina, praletrina o carboxilato de 5-bencil-3-furilmetil-(E)-(1R,3S)-2,2-dimetil-3-(2-oxotiolan-3-ilidenometil)ciclopropano;
- b) Organofosfatos, como, profenofos, sulprofos, acefato, metil paration, azinfos-metilo, demeton-s-metilo, heptenofos, tiometon, fenamifos, monocrotofos, profenofos, tiazofos, metamidofos, dimetoato, fosfamidon, malation, clorpirifos, fosalon, terbufos, fensulfotión, fonofos, forato, foxim, pirimifos-metilo, pirimifos-etilo, fenitrotion, fostiazato o diazinon;
- c) Carbamatos (inclusive arilcarbamatos), como pirimicarb, triazamato, cloetocarb, carbofuran, furatiocarb, etiofencarb, aldicarb, tiofurox, carbosulfan, bendiocarb, fenobucarb, propoxur, metomil u oxamil;
- d) Benzoilureas, como diflubenzuron, triflumuron, hexaflumuron, flufenoxuron o clorfluazuron;
- e) Compuestos orgánicos de estaño, como cihexatina, óxido de fenbutatina o azociclotina;
- f) Pirazoles, como tebufenpirad y fenpiroximato;
- g) Macrólidos, como ivermectinas o milbemicinas, por ejemplo abamectina, benzoato de emamectina, ivermectina, milbemicina, espinosad o azadiractina;
- h) Hormonas o feromonas;
- i) Compuestos organoclorados como endosulfan, hexacloruro de benceno, DDT, clordano o dieldrin;
- j) Amidinas, como clordimeform o amitraz;
- k) Fumigantes, como cloropicrina, dicloropropano, bromuro de metilo o metam;
- l) Compuestos cloronicotinílicos como imidacloprid, tiacloprid, acetamiprid, nitenpiram o tiametoxam;
- m) Diacilhidrazinas, como tebufenozido, cromafenozido o metoxifenozido;
- n) Éteres difenilo, como diofenolan o piriproxifeno;
- o) Indoxacarb;
- p) Clorfenapir; o
- q) Pimetrozina.

Además de las principales clases químicas de plaguicidas indicadas antes, se pueden emplear en la composición otros plaguicidas que tengan blancos particulares, si es adecuado, para la utilidad a la cual está destinada la composición. Por ejemplo, se pueden emplear insecticidas selectivos para cultivos particulares, por ejemplo insecticidas específicos para taladro (como cartap) o insecticidas específicos para salta hojas (como buprofezina) para usar en arroz. Alternativamente se pueden incluir en las composiciones insecticidas o acaricidas específicos para especies/estadios particulares de insectos (por ejemplo acaricidas ovo-larvicidas, como clofentezina, flubenzimina, hexitiazox o tetradifon; acaricidas motilicidas, como dicofol o propargita; acaricidas, como bromopropilato o clorobencilato; o reguladores del crecimiento, como hidrametilnon, ciromazina, metopreno, clorfluazuron o diflubenzuron).

Los ejemplos de compuestos fungicidas que se pueden incluir en la composición de la invención son (E)-N-metil-2-[2-(2,5-dimetilfenoximetil)fenil]-2-metoxi-iminoacetamida (SSF-129), 4-bromo-2-ciano-N,N-dimetil-6-trifluorometilbencimidazol-1-sulfonamida,  $\alpha$ [N-(3-cloro-2,6-xilil)-2-metoxiacetamido]- $\gamma$ -butirolactona, 4-cloro-2-ciano-N,N-dimetil-5-p-tolilimidazol-1-sulfonamida (IKF-916, ciamidazosulfamid), 3-5-dicloro-N-(3-cloro-1-etil-1-metil-2-oxopropil)-4-metilbenzamida (RH-7281, zoxamida), N-alil-4,5-dimetil-2-trimetilsililtiofeno-3-carboxamida (MON65500), N-(1-ciano-1,2-dimetilpropil)-2-(2,4-diclorofenoxi)propionamida (AC382042), N-(2-metoxi-5-piridil)-ciclopropano carboxamida, acibenzolar (CGA245704), alanicarb, aldimorf, anilazina, azaconazol, azoxistrobina, benalaxil, benomil, biloxazol, bitertanol, blastocidina S, bromuconazol, bupirimato, captafol, captan, carbendazim, clorhidrato de carbendazim, carboxina, carpropamid, carvona, CGA41396, CGA41397, quinometionato, clorotalonil, clorozolinato, clozilacon, compuestos que contienen cobre como oxicluro de cobre, oxiquinolato de cobre, sulfato de cobre, talato de cobre y mezcla de Bordeaux, cimoxanil, ciproconazol, ciprodinil, debacarb, di-2-piridil disulfuro 1,1'-dióxido, diclofluanid, diclomezina, dicloran, dietofencarb, difenoconazol, difenzoquat, diflometorim,

tiofosfato de *0,0-di-iso*-propil-S-bencilo, dimefluzol, dimetconazol; dimetomorf, dimetirimol, diniconazol, dinocap, ditianon, cloruro de dodecil dimetilamonio, dodemorf, dodina, doguadina, edifenfos, epoxiconazol, etirimol, (*Z*)-*N*-bencil-*N*[metil(metil-tioetilidenaminooxicarbonil)amino]tio)- $\beta$ -alaninato de etilo, etridiazol, famoxadona, fenamidona (RPA407213), fenarimol, fenbuconazol, fenfuram, fenhexamida (KBR2738), fenciclonil, fenpropidina, fenpropimorf, acetato de fentina, hidróxido de fentina, ferbam, ferimzona, fluazinam, fludioxonil, flumetover, fluoroimida, fluquinconazol, flusilazol, flutolanil, flutriafol, folpet, fuberidazol, furalaxil, furametpir, guazatina, hexaconazol, hidroxiiisoxazol, himexazol, imazalil, imibenconazol, iminocadina, triacetato de iminocadina, ipconazol, iprobenfos, iprodiona, iprovalicarb (SZX0722), isopropanil butil carbamato, isoprotiolano, kasugamicina, kresoxim-metil, LY186054, LY211795, LY248908, mancozeb, maneb, mfenoxam, mepanipirim, mepronil, metalaxil, metconazol, metiram, metiram-cinc, metominostrobin, miclobutanil, neosozin, dimetilditiocarbamato de níquel, nitrotal-*isopropilo*, nuarimol, ofurace, compuestos organo mercurio, oxadixil, oxasulfuron, ácido oxolínico, oxpoconazol, oxicarboxin, pefurazoato, penconazol, pencicuron, óxido de fenazina, fosetil-Al, ácidos de fósforo, ftalida, picoxistrobina (ZA1963), polioxina D, poliram, probenazol, procloraz, procimidona, propamocarb, propiconazol, propineb, ácido propiónico, pirazofos, pirifenox, pirimetanil, piroquilon, piroxifur, pirrolnitrina, compuestos de amonio cuaternario, quinometionato, quinoxifeno, quintozeno, sipconazol (F-155), pentaclorofenato de sodio, espiroxamina, estreptomocina, azufre, tebuconazol, tecloftalam, tecnazeno; tetraconazol, tiabendazol, tifulzamida, 2-(tiocianometiltio)benzotiazol, tiofanato-metilo, tiram, timbenconazol, tolclfos-metilo, tolilfluand, triadimefon, triadimenol, triazbutil, triazóxido, triciclazol, tridemorf, trifloxistrobina (CGA279202), triforina, triflumizol, triticonazol, validamicina A, vapam, vinclozolina, zineb y ziram.

Los compuestos de fórmula (I) se pueden mezclar con el suelo, la turba u otro medio de arraigamiento para la protección de las plantas contra enfermedades fúngicas transmitidas por la semilla, transmitidas por el suelo o foliares.

Los ejemplos de productos sinérgicos adecuados para usar en las composiciones incluyen butóxido de piperonilo, sesamex, safroxan y dodecilimidazol.

Los herbicidas y reguladores del crecimiento de las plantas adecuados para inclusión en las composiciones dependerán del blanco al que están destinados y del efecto requerido.

Un ejemplo de un herbicida selectivo para el arroz que se puede incluir es propanilo. Un ejemplo de un regulador del crecimiento de las plantas para usar en el algodón es PIX<sup>TM</sup>.

Algunas mezclas pueden comprender principios activos que tengan propiedades físicas, químicas o biológicas significativamente diferentes de modo que no se presten fácilmente para el mismo tipo de formulación convencional. En esas circunstancias se pueden preparar otros tipos de formulaciones. Por ejemplo, cuando un principio activo es un sólido insoluble en agua y el otro un líquido insoluble en agua, sería posible de todos modos dispersar cada principio activo en la misma fase acuosa continua mediante la dispersión del principio activo sólido como una suspensión (usando una preparación análoga a la de una SC) pero dispersando el principio activo líquido como una emulsión (usando una preparación análoga a la de una EW). La composición resultante es una formulación en suspoemulsión (SE).

La invención se ilustra mediante los ejemplos siguientes:

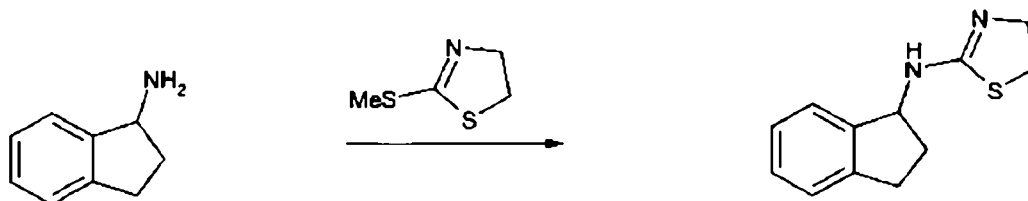
Se obtuvieron los datos de espectros de masas para compuestos seleccionados de los ejemplos siguientes usando LCMS: LC5: 254 nm -gradiente 10% de A a 100% de B A = H<sub>2</sub>O + 0.01% de HCOOH B = CH<sub>3</sub>CN/CH<sub>3</sub>OH + 0.01% de HCOOH electronebulización positiva 150-1000 m/z.

#### Ejemplo 1

Este ejemplo ilustra la preparación del compuesto N° 2.002

50

55



60

65

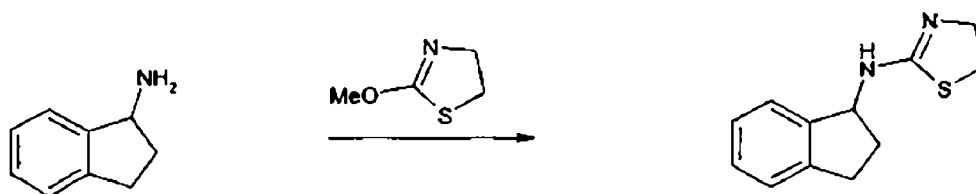
Una solución de 1-aminoindano (0.5 ml, 3.87 mmol), 2-metiltio-2-tiazolina (0.421 ml, 3.87 mmol) y ácido metanosulfónico (0.251 ml, 3.87 mmol) en butanol (5 ml) se calentó a reflujo a una temperatura de baño de 125°C durante 16 horas. El solvente se evaporó, y el producto crudo se separó entre HCl (2 M) y éter dietílico. La fase orgánica se hizo básica con NaOH (32%) y el producto se extrajo en diclorometano, se secó (MgSO<sub>4</sub>) y se evaporó para producir 912 mg de producto como cristales de color beige pf. 137°C.

## Ejemplo 2

Este ejemplo ilustra la preparación del compuesto N° 2.002

5

10



15

Una solución de 1-aminoindano (0.2 ml, 1.55 mmol), 2-metoxi-2-tiazolina (182 mg, 1.55 mmol) y ácido metanosulfónico (0.050 ml, 0.77 mmol) en butanol (1 ml) se dejó a temperatura ambiente durante 15 días. La mezcla se separó agitando entre NaOH (1 M) y diclorometano y la fase orgánica se secó ( $\text{MgSO}_4$ ) y se evaporó para dar 286 mg de producto como cristales de color beige pf.  $137^\circ\text{C}$ .

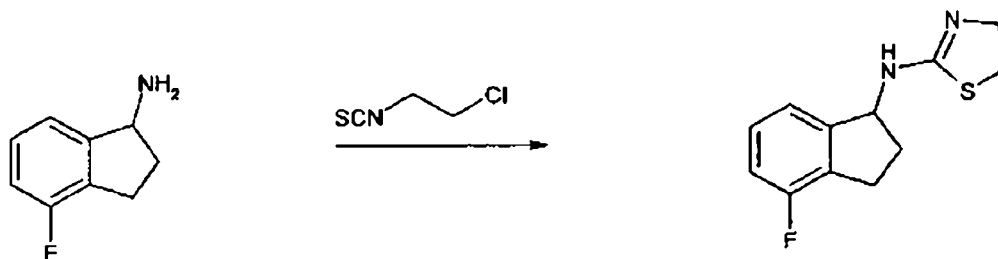
20

## Ejemplo 3

Este ejemplo ilustra la preparación del compuesto N° 2.019

25

30



35

40

Una solución de 4-fluoro-1-indanamina (300 mg, 1.98 mmol) en THF (2.5 ml) se agitó a  $0^\circ\text{C}$ . Se le agregó una solución de isotiocianato de cloroetilo (0.200 ml, 2.08 mmol) en THF (0.5 ml) y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante toda la noche. Se decantó el sobrenadante y los cristales remanentes se lavaron dos veces con éter, se disolvieron en agua, se basificaron con NaOH (32%) y el producto se extrajo en diclorometano, se secó ( $\text{MgSO}_4$ ) y se evaporó para dejar un sólido de color amarillo oscuro, que se lavó dos veces con éter para producir el producto como un polvo blanco fino. pf.  $149^\circ\text{C}$ .

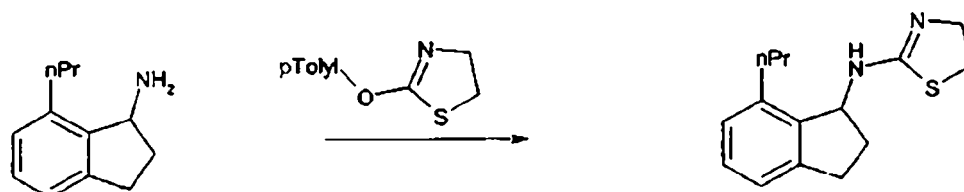
45

## Ejemplo 4

Este ejemplo ilustra la preparación del compuesto N° 6.011

50

55



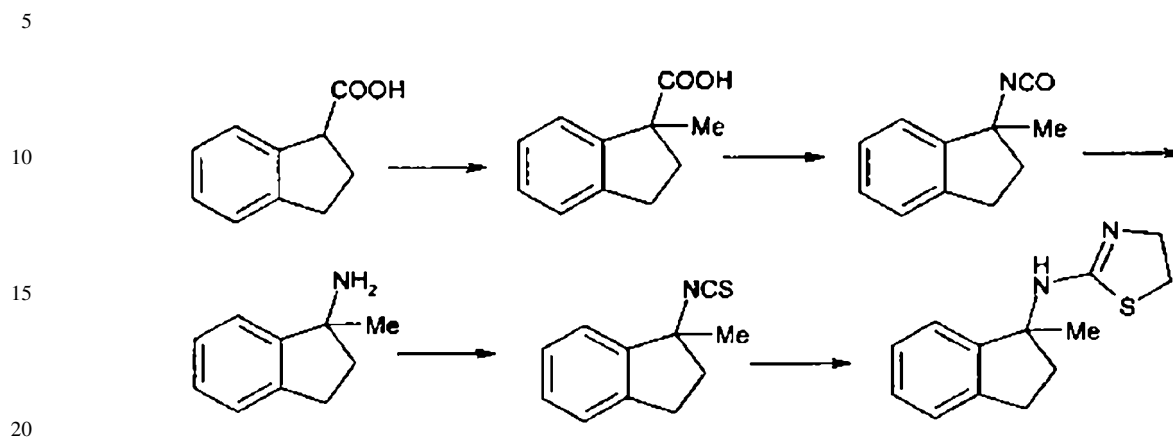
60

Una solución de 7-propil-1-indanamina (184 mg, 1.05 mmol), 2-(p-toliloxi)-2-tiazolina (0.174 ml, 203 mg, 1.05 mmol) y ácido metanosulfónico (0.034 ml, 50 mg, 0.527 mmol) en nBuOH (1 ml) se calentó a  $110^\circ\text{C}$  durante 2 horas. Se evaporó el solvente y la mezcla se agitó con tBuOMe, NaOH (2M) y NaCl(sat.). El producto se tomó en HCl (2 M), y después de la basificación con NaOH (32%) nuevamente en tBuOMe, que se lavó con NaCl (sat.), se secó ( $\text{MgSO}_4$ ), y se evaporó para producir 272 mg como un jarabe, que cristalizó en reposo, pf.  $72-75^\circ\text{C}$ .

65

## Ejemplo 5

Este ejemplo ilustra la preparación del compuesto N° 3.004



## Paso 1

25 Una solución de ácido indano-1-carboxílico (4.1 g, 25.3 mmol) en THF (30 ml) se agregó en porciones a una solución de diisopropilamida de litio en THF (2 M, 27.8 ml, 55.6 mmol) con agitación a  $-20^{\circ}\text{C}$ . La solución se agitó después a  $35^{\circ}\text{C}$  durante 1 hora, luego se enfrió nuevamente hasta  $-20^{\circ}\text{C}$  y se le agregó una solución de yoduro de metilo (2.05 ml, 32.89 mmol) en THF (10 ml). La solución de color amarillo pálido se calentó a  $35^{\circ}\text{C}$  durante 4 horas antes de extraer entre HCl (2 M) y EtOAc para obtener el producto crudo (4.5 g) como un aceite marrón. Esta mezcla se sometió a cromatografía en un equipo de HPLC con EtOAc/hexano para producir ácido 1-metil-1-indanocarboxílico (1 g) y recuperar el material de partida (700 mg).

## Paso 2

35 Una solución de ácido 1-metil-1-indanocarboxílico (864 mg, 4.9 mmol), difenilfosforil azida (1.3 ml, 6.02 mmol) y trietilamina (0.95 ml, 6.87 mmol) en tBuOH (10 ml) se agitó con 5 g de un tamiz molecular de 4A a  $95^{\circ}\text{C}$  durante 5 horas, mientras se desprendía gas. La mezcla se enfrió, se diluyó con EtOAc, se filtró y se evaporó el solvente. El producto crudo se volvió a disolver en EtOAc, se lavó con agua, se secó con  $\text{MgSO}_4$ , y se evaporó para dar el isocianato como un aceite marrón (700 mg).

## Paso 3

45 El isocianato del paso 2 (300 mg, 1.73 mmol) se disolvió en THF (3 ml) y se agitó con NaOH (2 M, 2.4 ml) durante 4 horas, después se separó agitando entre HCl (2 M) y AcOEt. La fase acuosa se hizo básica con NaOH (conc.) y el producto se extrajo en EtOAc, se secó y se evaporó para dar la amina (52 mg, 20%) como un aceite.

## Paso 4

50 Una solución de la amina del paso 3 (110 mg, 0.748 mmol) en diclorometano se agregó lentamente a una solución en agitación de tiofósgeno (0.063 ml, 0.823 mmol) en diclorometano (1 ml) y 103 mg de carbonato de potasio en agua (1 ml) a  $0^{\circ}\text{C}$ . Después de 15 min se le agregó una solución fría de KOH (1.496 mmol) en agua (1 ml) y la mezcla se separó agitando entre diclorometano y agua. La fase orgánica se secó y se evaporó para dar el isotiocianato (90 mg) como un aceite inestable.

## Paso 5

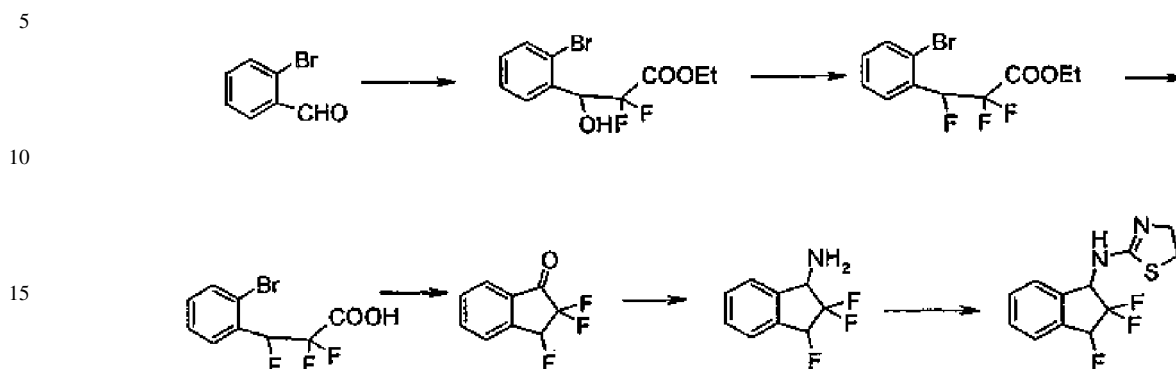
55 Se agregó NaOH (2 M, 0.237 ml) a una solución de bromhidrato de 2-bromoetilamina (97 mg, 0.476 mmol) en agua (0.1 ml) y se agitó con éter (0.5 ml) a  $0^{\circ}\text{C}$ . Se le agregó lentamente una solución de isotiocianato del paso 4 (90 mg, 0.476 mmol) en éter (1 ml) y la mezcla se agitó a  $0^{\circ}\text{C}$  durante 30 minutos. La mezcla se separó agitando entre éter y agua, y la fase etérea se extrajo con HCl (2 M). La fase acuosa se hizo básica con NaOH (2 M) y el producto se extrajo en EtOAc, que se secó y se evaporó para dar 11 mg (10%) del producto.  $^1\text{H-NMR}$  (300 MHz  $\text{CDCl}_3$ ) 1.68 (3H, s); 2.18 (1H, m); 2.73 (1H, m); 2.88 (1H, m); 3.03 (1H, m); 3.22 (2H, t); 3.98 (2H, m); 7.27 (4H, m).

65

## ES 2 353 159 T3

### Ejemplo 6

Este ejemplo ilustra la preparación del compuesto N° 6.002



#### Paso 1

Se lavó polvo de cinc (6 g) con HCl (20% ac. 10 ml), después agua, acetona y éter, luego se agregó a una solución de 2-bromobenzaldehído (7.03 ml, 60.8 mmol) en THF (60 ml). Se le agregó en porciones bromodifluoroacetato de etilo (9.5 ml, 73 mmol) en THF (30 ml). Una vez que terminó la reacción exotérmica la mezcla se agitó durante 3 horas, después se separó agitando entre EtOAc, NH<sub>4</sub>Cl (sat.) y NaCl (sat.). La fase orgánica se secó y se evaporó para dar el producto (12 g) como un aceite amarillo.

#### Paso 2

Una solución del producto del paso 1 (12 g, 38.8 mmol) en diclorometano (30 ml) se agregó lentamente a una solución de DAST en diclorometano (50 ml) a -70°C. Después de 30 minutos a esta temperatura se permitió que alcanzara la temperatura ambiente y se agitó durante 2 horas, después se enfrió y se vertió en NaHCO<sub>3</sub> (1 M) frío. El producto se extrajo en diclorometano, se secó y el solvente se evaporó para producir el producto (10 g) como un aceite marrón.

#### Paso 3

Una solución del producto del paso 2 (10 g, 32 mmol) en EtOH (200 ml) y NaOH (32%, 100 ml) se agitó a 90°C durante 5 horas, después se enfrió y se separó agitando entre éter y agua. La fase acuosa se acidificó con HCl (conc.) y el producto se extrajo en éter, se secó y se evaporó para producir el ácido (3.2 g) como un aceite marrón.

#### Paso 4

Una solución de BuLi en hexano (1.6 M, 1.47 ml, 2.36 mmol) se agregó lentamente a una solución del producto del paso 3 (304 mg, 1.07 mmol) a -10°C. Después de 10 minutos a esta temperatura se permitió que alcanzara la temperatura ambiente, se vertió en HCl (ac. 2 M) y se extrajo en éter. La fase etérea se secó y se evaporó para producir 212 mg del producto crudo, que se sometió a cromatografía en gel de sílice con EtOAc al 50%/hexano para dar la 2,2,3-trifluoro-indanona (45 mg).

#### Paso 5

Una solución de 2,2,3-trifluoro-indanona (282 mg, 1.5 mmol), isopropóxido de titanio (0.886 ml, 2.99 mmol) y amoniaco (2 M en EtOH, 2.5 ml) en EtOH se agitó durante 5 horas. La mezcla se enfrió hasta 0°C y se le agregó NaBH<sub>4</sub> (85 mg, 2.25 mmol). Después de agitar durante 2 horas la mezcla se dejó a temperatura ambiente durante toda la noche, después se vertió en NH<sub>4</sub>OH (25%, 10 ml) y se extrajo con EtOAc. La fase orgánica se lavó con agua, se secó y se evaporó para dar el producto crudo (205 mg) como un aceite marrón. Éste se agitó entre éter y HCl (ac. 2 M), se basificó con NaOH (2 M) y se extrajo en éter. La evaporación produjo 1-amino-2,2,3-trifluoro-indano (90 mg) como un aceite.

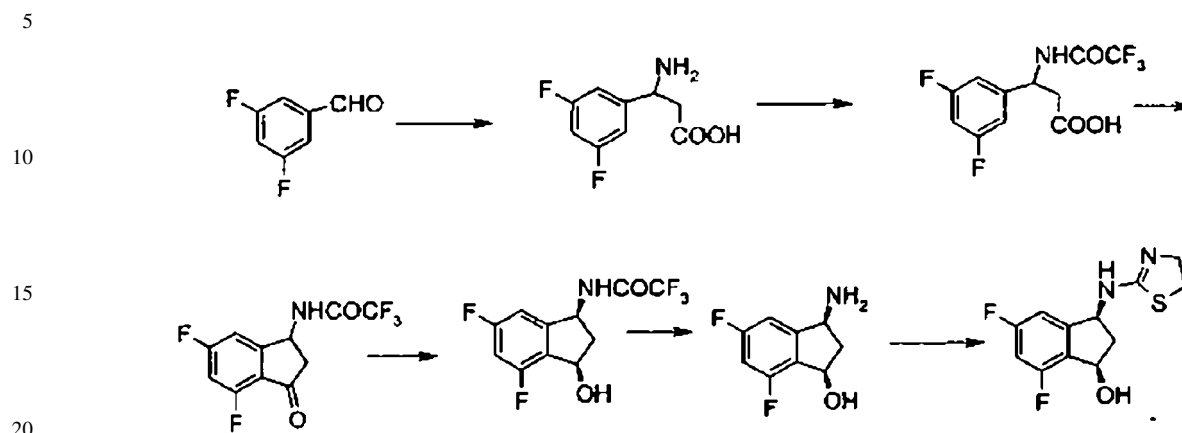
#### Paso 6

Se agregó cloroetilisotiocianato (0.045 ml, 0.470 mmol) a una solución de 1-amino-2,2,3-trifluoroindano (80 mg, 0.427 mmol) en THF (0.5 ml). El precipitado blanco se separó por filtración para dar 40 mg del producto como una sal de HCl. Ésta se agitó entre NaOH (ac.) y diclorometano, la fase orgánica se secó y se evaporó para producir 31 mg del producto. <sup>1</sup>HNMR (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>) 3.39 (2H, t); 3.98 (2H, m); 5.44 (1H, t, J = 8); 5.79 (1H, ddd, J = 49, 8, 6); 7.50 (4H, m).

## ES 2 353 159 T3

### Ejemplo 7

Este ejemplo ilustra la preparación del compuesto N° 6.002



#### Paso 1

25 Una suspensión de acetato de amonio (27.12 g, 351.8 mmol), ácido malónico (18.31 g, 175.92 mmol) y 3,5-difluoro-benzaldehído (25 g, 175.92 mmol) en etanol (53 ml) se calentó durante toda la noche a reflujo, se enfrió hasta temperatura ambiente, el producto se separó por filtración, se lavó con etanol y éter, y se secó al vacío para dar 21.07 g del producto como un polvo blanco.

#### Paso 2

30 Se agregó TFAA (15 ml) a una solución del producto del paso 1 (5 g, 24.85 mmol) en TFA (15 ml). Después de 45 minutos la mezcla se vertió en 350 ml de agua fría y el producto se separó por filtración. Se lavó con agua y se secó durante toda la noche al aire para dar 6.06 g del trifluoroacetato como cristales blancos.

#### Paso 3

35 Se agregó ácido sulfúrico (0.036 ml, 0.67 mmol) a una solución del producto del paso 2 (2.0 g, 6.78 mmol) en TFA (10 ml) y TFAA (10 ml), y la mezcla se calentó durante 4 horas a reflujo. El solvente se evaporó y el producto crudo se agitó en hielo/agua (50 ml). El producto se separó por filtración, se lavó con agua y se secó al vacío para dar la indanona (1.48 g) como cristales de color beige.

#### Paso 4

45 Se agregó borohidruro de sodio (712 mg, 18.8 mmol) en porciones a una suspensión del producto del paso 3 (5 g, 17.9 mmol) en MeOH (50 ml) a 0°C. Después de 2 horas a 0°C se agregaron ácido acético (0.5 ml) y agua (2 ml) y se evaporó el solvente. El producto crudo se tomó en diclorometano, se lavó con HCl (1 M) y NaHCO<sub>3</sub> (sat.), se secó y se evaporó para dar el producto (4.87 g) como una mezcla de isómeros cis y trans. Esta mezcla se agitó con un poco de éter y el isómero cis puro se separó por filtración, se lavó con éter y se secó para dar 2.48 g. La cromatografía del licor madre en sílice con 5% MeOH/diclorometano produjo el isómero trans puro (537 mg) como cristales blancos.

#### Paso 5

55 Una solución del isómero cis del paso 4 (600 mg, 2.13 mmol) y carbonato de potasio (1.47 g, 10.6 mmol) en metanol (20 ml) y agua (4.5 ml) se calentó a reflujo durante 2 horas, se enfrió y el solvente se evaporó. El producto crudo se separó agitando entre NaOH (2 M) y diclorometano. La fase orgánica se secó y se evaporó para dar 160 mg del producto como cristales marrones.

#### Paso 6

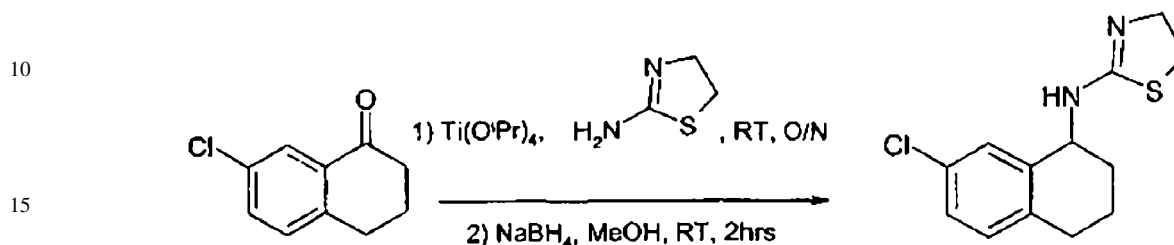
60 Se agregó cloroetilisotiocianato (0.073 ml, 0.754 mmol) a una solución del producto del paso 5 (133 mg, 0.718 mmol) en THF (3 ml) y la solución se dejó en reposo durante toda la noche. La mezcla se agitó entre HCl (1 M) y éter, la fase acuosa se basificó con NaOH (32%) y el producto se extrajo en diclorometano, que luego se secó y se evaporó. El producto crudo se lavó con éter (1 x 2 ml, y 2 x 0.5 ml) para dar el producto (105 mg) como cristales de color beige pf. 167°C.

65

## Ejemplo 8

Este ejemplo ilustra la preparación del compuesto N° 1.003

5 (7-Cloro-1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-il)-(4,5-dihidrotiazol-2-il)-amina



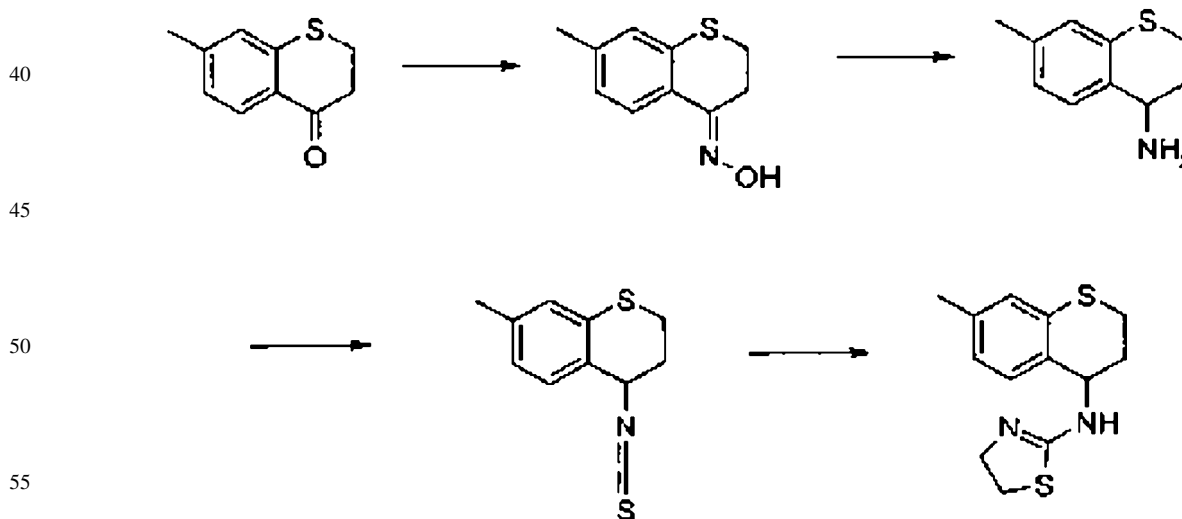
20 Se agregó isopropóxido de titanio (710 mg, 0.74 ml, 2.5 mmol) a una mezcla de 7-cloro-1-tetralona (360 mg, 2 mmol) y 2-aminotiazolina (224 mg, 2.2 mmol). La mezcla de reacción se agitó durante 16 horas a temperatura ambiente y después se diluyó con metanol seco (5 ml). Se agregó un exceso de borohidruro de sodio con cuidado, en porciones, en el transcurso 45 minutos. La mezcla de reacción se agitó durante otras 2 horas, después se agregó a una solución acuosa saturada de sal de Rochelle y se extrajo con diclorometano (2 x 25 ml). Las fases orgánicas se combinaron, se lavaron secuencialmente con agua y solución saturada de cloruro de sodio y después se filtraron a través de una almohadilla de sulfato de magnesio. El filtrado se concentró a presión reducida para dar el producto

25 crudo como una goma de color amarillo pálido. El producto crudo se purificó por cromatografía en columna de sílice, eluyendo con acetato de etilo para dar el compuesto del título como un sólido blanco, pf. 164-166°C.

30 Datos num.: (CDCl<sub>3</sub>): 7.39 (1H, s, CH), 7.13 (1H, dd, CH), 7.01 (1H, s, CH), 4.90 (1H, m, CH), 4.06 (2H, m), 3.37 (2H, m), 2.72 (2H, m), 2.08 (1H, m), 1.85 (3H, m).

## Ejemplo 9

35 Este ejemplo ilustra la preparación del compuesto N° 1.014



## Paso 1

60 Se agregó clorhidrato de hidroxilamina en una porción (590 mg, 8.4 mmol) a una solución en agitación de cetona (1 g, 5.6 mmol) en metanol (15 ml) y la solución amarilla resultante se agitó a temperatura ambiente durante 16 horas. Después la reacción se concentró y se trituró con éter y hexano para dar un sólido de color beige. Este sólido se recogió y se secó por filtración y los análisis de NMR y MS confirmaron que se trataba de la oxima deseada (0.802 g, 4.15 mmol, 74%).

65

## ES 2 353 159 T3

### Paso 2

Se lavó níquel Raney (500 mg) y se agregó a una solución de oxima (532 mg, 2.8 mmol) en amoníaco metanólico (7 M, 10 ml). Esta suspensión se sometió luego a una presión de 3.85 bar de hidrógeno a temperatura ambiente durante 2.5 horas. Después la reacción se filtró a través de hyflo y se concentró al vacío para dar un sólido de color verde claro. Se encontró por NMR que este sólido era el producto deseado (310 mg, 1.6 mmol, 57%) que se usó crudo en el paso siguiente.

### Paso 3

Se agregó 1,1'-tiocarbonildiimidazol (144 mg, 0.81 mmol) a una solución de amina (145 mmol, 0.81 mmol, ligera presencia de níquel) en DMF y se agitó a temperatura ambiente durante 16 horas. Después se agregaron acetato de etilo y agua, y la fase orgánica se lavó con agua y solución saturada de cloruro de sodio, se secó ( $MgSO_4$ ) y se concentró al vacío. El aceite crudo anaranjado se analizó por NMR, MS e IR, y se encontró que se trataba del isotiocianato deseado que se usó inmediatamente en el paso siguiente.

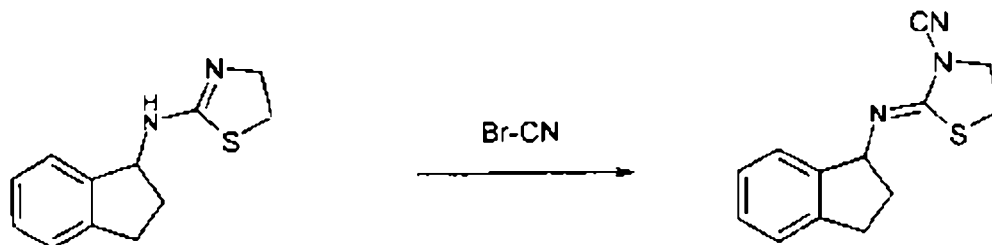
### Paso 4

Se agregó trietilamina (0.15 ml, 1.1 mmol) a una suspensión de clorhidrato de 2-clorometilamina (130 mg, 1.1 mmol) en DCM y la solución se agitó durante 30 min.

Después se agregó isotiocianato (1.1 mmol) en DCM. Se realizó una GCMS una hora más tarde que mostró la presencia del producto deseado y SM. La reacción se agitó durante toda la noche. La GCMS mostró que la reacción se había completado y el solvente se eliminó al vacío para dar un sólido crudo anaranjado. Éste se recrystalizó de etanol para dar el producto como un sólido blanco (tanda 1, 31 mg, 0.117 mmol, 14%) y una segunda tanda como un sólido de color beige (21 mg, 0.08 mmol, 10%). El rendimiento general para los 2 pasos fue de 24%. pf. 234-235°C.

### Ejemplo 10

Este ejemplo ilustra la preparación del compuesto N° 8.017



Una suspensión de 0.70 g (3.2 mmol) (4,5-dihidrotiazol-2-il)-indan-1-il-amina, 0.52 g (4.8 mmol) bromuro de cianógeno y 1.56 g (4.8 mmol) de  $CsCO_3$  en 10 ml de acetonitrilo se agitó a 20°C durante 16 horas. La suspensión se filtró y el solvente se evaporó. El producto crudo se purificó mediante cromatografía por desorción súbita utilizando EtOAc/n-hexano (1:5) como eluyente para producir 0.50 g de 2-(indan-1-ilimino)-tiazolidina-3-carbonitrilo (cristales blancos, pf. 90-91°C).  $^1H$ NMR (400 MHz,  $CDCl_3$ ): 2.0-2.15 (1H, m); 2.40-2.50 (1H, m); 2.85-2.95 (1H, m); 3.0-3.10 (1H, m); 3.35-3.45 (2H, m), 3.90-4.0 (2H, m), 4.65 (1H, t), 7.10-7.30 (4H, m).

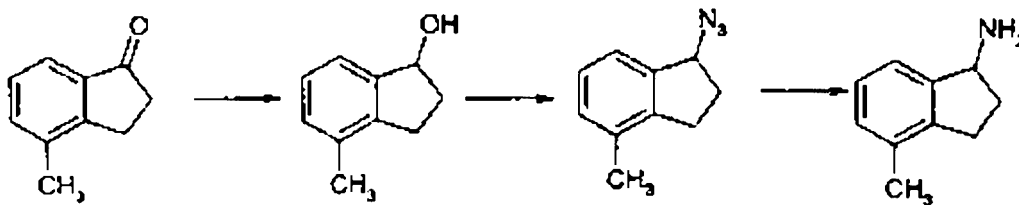
## ES 2 353 159 T3

### Ejemplo 11

Este ejemplo ilustra la preparación del compuesto N° 2.006

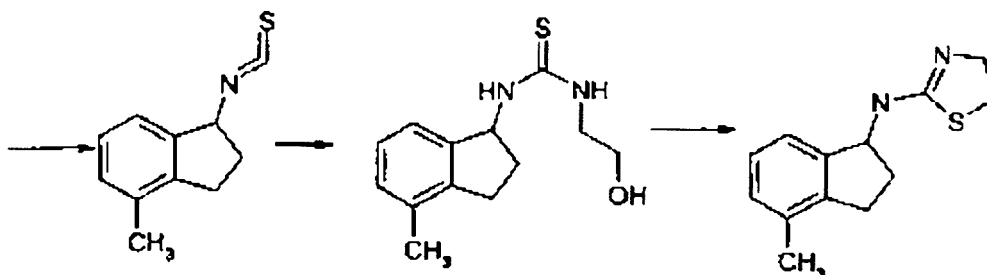
5

10



15

20



25

#### Paso 1

30

Se disolvieron 15.0 g (102.6 mmol) de 4-metil-indan-1-ona en 125 ml de MeOH. La solución se enfrió hasta 0-5°C y se agregaron 4.3 g (112.9 mmol) de NaBH<sub>4</sub> en porciones mientras se mantenía la temperatura entre 0-8°C. Después de la adición de NaBH<sub>4</sub> se retiró el baño frío y la mezcla de reacción se agitó hasta que la TLC indicó que la reacción se había completado. La mezcla de reacción se vertió en agua y se extrajo tres veces con ETOAc. Las capas orgánicas recogidas se lavaron con agua y solución saturada de cloruro de sodio, se secaron en MgSO<sub>4</sub> y se filtraron. Después de la evaporación del EtOAc se aisló 4-metil-indan-1-ol en una cantidad de 98%. El material crudo se pudo usar directamente sin purificación adicional.

35

40

<sup>1</sup>H-NMR (ppm, CDCl<sub>3</sub>): 1,95-2,03 (m, 1H); 2,30 (s, 3H); 2,45-2,55 (m, 1H); 2,70-2,80 (m, 1H); 2,95-3,05 (m, 1H); 5,25-5,30 (dd, 1H); 7,12 (d, 1H); 7,18 (t, 1H); 7,28 (d, 1H).

#### Paso 2

45

Se disolvieron 4.34 g (29.28 mmol) de 4-metil-indan-1-ol y 7.8 ml (35.14 mmol) de difenilfosforil azida en THF seco a temperatura ambiente en atmósfera de argón. A esta mezcla se le agregaron lentamente 5.0 ml (35.14 mmol) de 1,8-diazabicyclo[5.4.0]undec-7-eno. La reacción se agitó durante 6 h a temperatura ambiente (controlando por TLC). La mezcla de reacción se vertió en agua y se extrajo tres veces con tolueno. Las capas orgánicas se combinaron, se secaron en MgSO<sub>4</sub> y se concentraron al vacío. La purificación usando cromatografía con gel de sílice (hexano/EtOAc 9:1) produjo 1-azido-4-metil-indano puro como un líquido color anaranjado claro.

50

<sup>1</sup>H-NMR (ppm, CDCl<sub>3</sub>): 2.05-2.15 (m, 1H); 2.25 (s, 3H); 2.35-2.45 (m, 1H); 2.72-3.02 (m, 1H); 4.82-4.88 (dd, 1H); 7.10 (d, 1H); 7.15 (t, 1H); 7.22 (d, 1H).

#### Paso 3

55

Se trató 1.0 g (5.8 mmol) de 1-azido-4-metil-indano con 4.54 g (17.3 mmol) de trifenilfosfina en 26 ml de THF y 1.4 ml de H<sub>2</sub>O a temperatura ambiente durante toda la noche. Se logró que la reacción se completara calentando la mezcla durante otras 2.5 horas. La mezcla de reacción se enfrió hasta temperatura ambiente y se diluyó con agua. El pH se ajustó a 2 agregando HCl acuoso frío (ca 0°C) (1 M). Después de la extracción con EtOAc la capa acuosa se separó, se basificó con NaOH (2 M) y se extrajo en EtOAc. Después la capa orgánica se secó (MgSO<sub>4</sub>) y se concentró al vacío para dar 4-metil-indan-1-il-amina como un líquido amarillo claro.

60

<sup>1</sup>H-NMR (ppm, CDCl<sub>3</sub>): 1.55 (br s, 1H); 1.60-1.70 (m, 1H); 2.25 (s, 3H); 2.45-2.52 (m, 1H); 2.62-2.72 (m, 1H); 2.85-2.94 (m, 1H); 4.33 (t, 1H); 6.98-7.05 (m, 1H); 7,10-7,15 (m, 2H).

65

## ES 2 353 159 T3

### Paso 4

Una mezcla de 0.36 ml (4.32 mmol) de tiofósgeno en 4 ml de diclorometano se enfrió hasta 0°C después de lo cual se le agregó una solución fría (0°C) de 0.5 g (3.60 mmol) de K<sub>2</sub>CO<sub>3</sub> en 4 ml de agua. La mezcla se agitó durante 10 min y después se agregó gota a gota 0.53 g (3.60 mmol) de indan-1-ilamina con agitación vigorosa a 0°C. Después de otros 10 min se agregó en una porción una solución fría de 0.40 g (7.20 mmol) de KOH en 4 ml de agua con enfriamiento. La capa orgánica y tres extractos (Et<sub>2</sub>O) se combinaron, se secaron en MgSO<sub>4</sub>, se filtraron y se concentraron para dar 1-isotiocianato-4-metil-indano como un líquido marrón anaranjado. El producto se usó directamente sin purificación adicional.

<sup>1</sup>HNMR (ppm, CDCl<sub>3</sub>): 2.18-2.28 (m, 1H); 2.28 (s, 3H); 2.50-2.60 (m, 1H); 2.75-2.85 (m, 1H); 2.95-3.05 (m, 1H); 5.19 (t, 1H), 7.11 (d, 1H); 7.18 (t, 1H); 7.25 (d, 1H).

### Paso 5

Se disolvieron 680 mg (3.59 mmol) de 1-isotiocianato-4-metil-indano en 13 ml de THF a temperatura ambiente en atmósfera de argón. Después se le agregó lentamente 0.21 ml (3.59 mmol) de 2-amino-etanol. La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante toda la noche. Una vez completada la reacción controlada por TLC el solvente se eliminó a presión reducida para dar el producto crudo. La purificación subsiguiente mediante cromatografía en columna en gel de sílice (CH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub>/MeOH 15:1) y la agitación en Et<sub>2</sub>O produjo el compuesto del título 1-(2-hidroxi-etil)-3-(4-metil-indan-1-il)-tiourea como un polvo blanco (Pf. 90-93°C).

<sup>1</sup>HNMR (ppm, CDCl<sub>3</sub>): 1.85-1.95 (m, 1H); 2.25 (s, 3H); 2.55 (br s, 1H); 2.60-2.70 (m, 1H); 2.71-2.81 (m, 1H); 2.86-2.99 (m, 1H); 3.62 (br s, 2H); 3.78 (t, 2H); 5.67 (br s, 1H); 6.47 (br, s, 1H), 6.11 (br s, 1H); 7.07 (d, 1H); 7.12 (t, 1H); 7.18 (d, 1H).

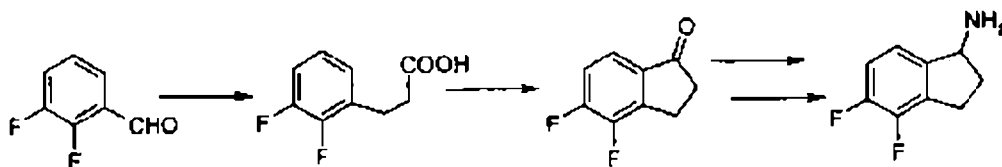
### Paso 6

Se disolvieron 500 mg (2.0 mmol) de 1-(2-hidroxi-etil)-3-(4-metil-indan-1-il)-tiourea y 786 mg (3.0 mmol) de trifenilfosfina (TPP) en 25 ml de tetrahidrofurano seco (THF) a temperatura ambiente en atmósfera de argón. Después de 15 minutos agitando a 20°C se agregó gota a gota una solución de 606 mg (3.0 mmol) de azodicarboxilato de diisopropilo (DIAD) en 10 ml de THF mientras se mantenía la temperatura por debajo de 20°C. La reacción se concretó después de 3 horas indicado por TLC. Después la mezcla de reacción se concentró al vacío y se agregaron HCl 1 M y acetato de etilo. La capa acuosa se separó y se extrajo tres veces con acetato de etilo. El pH de la capa acuosa se ajustó a ca 8-9 agregando NaOH sólido. El producto crudo se extrajo en CH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub> y se lavó bien con agua y solución saturada de cloruro sodio. Después de secar en MgSO<sub>4</sub> y evaporar se obtuvieron 428 mg de (4,5-dihidro-tiazol-2-il)-(4-metil-indan-1-il)-amina como un polvo blanco (Pf. 135-135°C).

<sup>1</sup>HNMR (CDCl<sub>3</sub>, ppm): 1.80-1.90 (m, 1H), 2.19 (s, 3H), 2.51-2.61 (m, 1H), 2.61-2.72 (m, 1H), 2.80-2.90 (m, 1H), 3.30 (t, 2H), 3.92-4.05 (m, 2H), 5.18 (t, 1H), 6.99 (d, 1H), 7.08 (t, 1H), 7.15 (d, 1H).

### Ejemplo 1 de producto intermedio

Este ejemplo ilustra la preparación de 4,5-difluoro-1-indanamina



### Paso 1 (según G Toth *et al.* Synth. Comm. 1995, 25(19), 3067-74)

Se agregó gota a gota trietilamina (30 ml) con agitación a ácido fórmico (19 ml) a 0°C. A esta solución se le agregaron 2,3-difluorobenzaldehído (25 g, 176 mmol) y ácido de Meldrum (25.4 g, 176 mmol) y la mezcla se calentó a 100°C durante 2 horas, tiempo durante el cual se desprendió gas y se recogieron 5 ml de destilado. La mezcla se calentó durante otras 2 horas, después se trató con hielo/agua (140 ml), y HCl (ac. conc.) hasta pH 1-2. La mezcla se dejó a 5°C durante toda la noche, y el producto se separó por filtración, se lavó con agua, se secó primero al aire y después al vacío para dar 29.11 g de cristales blancos del ácido (2,3-difluoro)-3-propiónico.

## ES 2 353 159 T3

### Paso 2

Se agregó cloruro de tionilo (6.43 ml, 88.64 mmol) a una suspensión de ácido (2,3-difluoro)-3-propiónico (15 g, 80.58 mmol) en DMF (0.17 ml) y hexano (60 ml) con agitación. Después de agitar durante una hora a temperatura ambiente la solución marrón se calentó a 50°C durante 2 horas, después se evaporó solvente dejando el ácido clorhídrico como un aceite marrón. Éste se disolvió en diclorometano (60 ml), se le agregó AlCl<sub>3</sub> en tres porciones con agitación, y la mezcla marrón oscura/negra se agitó durante toda la noche a temperatura ambiente. La mezcla se vertió en hielo/agua, se acidificó con HCl (conc. 15 ml) y el producto se extrajo en diclorometano, que se lavó con HCl (2 M) y NaOH (2 M), se secó (MgSO<sub>4</sub>), y se evaporó para dar 7.21 g de 4,5-difluoro-1-indanona como un sólido marrón (pf. 28-32°C).

### Paso 3

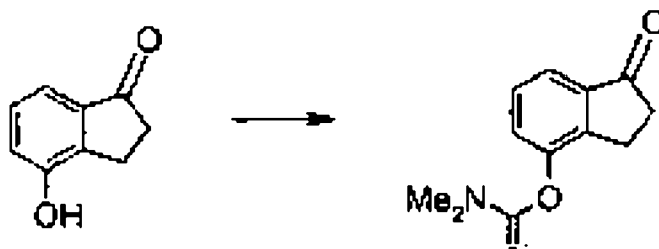
Se disolvieron 4,5-difluoro-1-indanona (5.0 g, 35.68 mmol) y clorhidrato de hidroxilamina (3.72 g, 53.52 mmol) en piridina (16 ml) y la solución marrón oscura se dejó a temperatura ambiente durante toda la noche, después se vertió en 40 ml de hielo/agua. El producto se separó por filtración, se lavó con agua y se secó primero al aire y después al vacío para dar 6.21 g de la oxima como un polvo de color beige claro.

### Paso 4

Se agregó borohidruro de sodio (4.34 g, 114.6 mmol) a una solución de TiCl<sub>4</sub> (6.3 ml, 57.3 mmol) en DME (120 ml) a 0°C con agitación. Se desprendió gas, la temperatura se elevó hasta 20°C y la solución se tornó de color azul claro. Después de enfriar hasta 0°C se le vertió una suspensión de la oxima del paso 3 (5.0 g, 27.3 mmol) en DME (20 ml). La temperatura se elevó hasta 20°C y la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante toda la noche. La suspensión azul oscura se agregó en porciones a una mezcla de tartrato de potasio (200 mmol), agua (100 ml) y NaOH (32%, 50 ml), que se agitó a 0°C. Este enfriamiento fue exotérmico. Después de agitar durante 2 horas la mezcla opalescente se extrajo con éter dietílico. El producto se extrajo después en HCl (1 M), se lavó con éter y después de basificar con NaOH (32%), se extrajo en diclorometano, que se secó y se evaporó para dar 1.5 g de 4,5-difluoro-1-aminoindano como un aceite de color marrón claro. <sup>1</sup>H-NMR (300 MHz, CDCl<sub>3</sub>) 1.57 (3H, s, NH<sub>2</sub>); 1.78 (1H, m); 2.57 (1H, m); 2.81 (1H, m); 3.09 (1H, m); 4.37 (1H, t) 7.00 (2H, m).

### Ejemplo 2 de producto intermedio

Este ejemplo ilustra la preparación de éster O-(1-oxo-indan-4-ílico) del ácido dimetil-tiocarbámico



Se agregaron en porciones 13,3 g (87 mmol) de 4-hidroxi-indan-1-ona a una suspensión de 2,3 g (91.3 mmol) de NaH en 200 ml de DMF seca y se agitó a 20°C. Una vez que cesó el desprendimiento de hidrógeno se agregó lentamente una solución de 11.8 g (95.6 mmol) de cloruro de *N,N'*-dimiltiocarbamoilo en 50 ml de DMF seca. La mezcla resultante se agitó durante toda la noche a 20°C. Una vez que se completó la reacción indicado por TLC la mezcla de reacción se vertió en agua helada y se extrajo varias veces con EtOAc. El extracto orgánico se lavó bien con K<sub>2</sub>CO<sub>3</sub> ac. al 10%, se secó en MgSO<sub>4</sub> y se evaporó hasta sequedad al vacío. El producto crudo se purificó mediante cromatografía por desorción súbita (hexano/EtOAc 3:1) para dar 13.3 g (65%) de éster O-(1-oxo-indan-4-ílico) del ácido dimetil-tiocarbámico como un compuesto sólido de color amarillo claro. <sup>1</sup>H-NMR (ppm, CDCl<sub>3</sub>): 2.65-2.7 (m, 2H), 3.05-3.1 (m, 2H), 3.4 (s, 3H), 3.5 (s, 3H), 7.25 (d, 1H), 7.4 (t, 1H), 7.7 (d, 1H).

## ES 2 353 159 T3

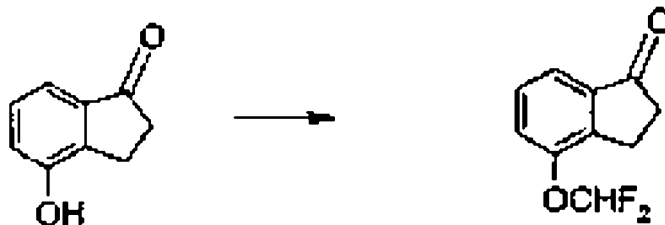
### Ejemplo 3 de producto intermedio

Este ejemplo ilustra la preparación del compuesto 4-difluorometoxi-indan-1-ona

5

10

15



20

Se agregaron 10.0 g (76.5 mmol) de 4-hidroxi-indan-1-ona a una suspensión de 28.0 g (202 mmol) de  $K_2CO_3$  en 100 ml de DMF seca y se agitaron durante toda la noche a  $20^\circ C$ . La suspensión se calentó hasta  $85^\circ C$  y se trató con 17.0 g (202 mmol) de  $CHCl_2F$  gaseoso durante 45 minutos mientras se mantenía la temperatura a  $85^\circ C$ . La suspensión oscura resultante se enfrió hasta temperatura ambiente y se vertió en 1500 ml de agua. La mezcla se extrajo con EtOAc. Una vez separada la capa orgánica se lavó con agua y solución saturada de cloruro de sodio, se secó en  $MgSO_4$  y se evaporó hasta sequedad.

25

El producto crudo se purificó mediante cromatografía por desorción súbita (hexano/EtOAc 9:1) para dar 7.0 g (52%) de 4-difluoro-metoxi-indan-1-ona con un pf.  $61-67^\circ C$ .

$^1H$ -NMR (ppm,  $CDCl_3$ ): 2.70-2.75 (m, 2H), 3.15-3.2 (m, 2H), 6.65 (t, ancho, 1H) 7.35-7.45 (m, 2H), 7.65 (d, 1H).

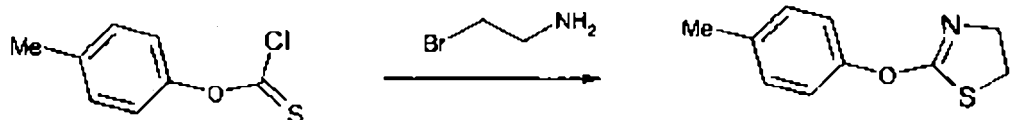
30

### Ejemplo 4 de producto intermedio

Este ejemplo ilustra la preparación de 2-p-toliloxi-tiazolina

35

40



45

(según Iwakura *et al.* J. Org. Chem. 1967, 32, 2362) Se agregó bromhidrato de 2-aminoetilbromuro (6.57 g, 32.1 mmol) a una solución de para toli-clorotioformiato (5 ml, 6.05 g, 32.1 mmol) en tBuOMe (50 ml) con agitación a  $0^\circ C$ . Se agregó lentamente NaOH (2 M, 35 ml) causando una reacción exotérmica a  $29^\circ C$ . Después de agitar a  $0^\circ C$  durante casi 30 minutos, se agregó NaOH (8 M, ca 30 ml) para hacer la mezcla básica. El producto se extrajo en tBuOMe, se lavó con  $NaHCO_3$  (1 M) y NaCl (sat.), se secó ( $MgSO_4$ ) y se evaporó para dar 5.125 g (83%) del producto como un aceite incoloro.  $^1H$ -NMR (300 MHz,  $CDCl_3$ ): 2.32 (3H, s, Me); 3.51 (2H, t, J = 8); 4.06 (2H, t, J = 8); 7.09 (2H, d, J = 8); 7.18 (2H, d, J = 8).

50

### Ejemplo 12

55

Este ejemplo ilustra las propiedades plaguicidas/insecticidas de los compuestos de fórmula (I). Se realizaron pruebas contra las plagas de la manera siguiente:

*Heliothis virescens* (gusano cogollero):

60

Se colocaron huevos (de 0-24 h de vida) en una placa de microtitulación de 24 pocillos con dieta artificial y se trataron con soluciones de prueba a una dosis de aplicación de 200 ppm mediante pipeta. Después de un período de incubación de 4 días, a las muestras se les controló la mortalidad de los huevos, la mortalidad de las larvas y la regulación del crecimiento. Los compuestos siguientes dieron al menos un 80% de control de *Heliothis virescens*: 2.025, 2.024, 2.022, 2.001, 2.020, 2.031, 2.003, 2.019, 2.026, 7.010, 2.030, 2.032, 1.007, 2.028, 2.040, 2.048, 2.049, 2.052, 2.058, 2.067, 6.022, 6.023, 6.026, 6.027, 6.032, 6.035, 6.038, 8.017, 8.018, 8.025, 8.031, 8.033, 8.034, 9.018, 9.019, 9.020, 10.001, 10.009, 10.011, 10.013, 10.015, 10.017, 10.020, 10.025, 12.008, 11.012, 12.017.

65

## ES 2 353 159 T3

### *Myzus persicae* (pulgón verde del melocotonero):

5 Se colocaron discos de hojas de girasol sobre agar en una placa de microtitulación de 24 pocillos y se asperjaron con soluciones de prueba a una dosis de aplicación de 200/50/12.5 ppm. Una vez secos, los discos de hojas se infectaron con una población de áfidos de diversas edades. Después de un período de incubación de 6 DDT (días después del tratamiento), se controló la mortalidad en las muestras.

10 Los compuestos siguientes dieron al menos un 80% de control de *Myzus persicae*: 2.025, 2.024, 2.022, 2.001, 7.006, 2.020, 2.031, 6.019, 4.001, 2.002, 2.003, 2.006, 2.019, 2.016, 7.007, 2.026, 7.008, 2.014, 7.010, 2.030, 1.012, 2.014, 2.031, 2.032, 2.052, 2.058, 2.066, 6.020, 6.022, 6.032, 6.042, 8.017, 8.018, 8.030, 8.031, 8.032, 8.036, 9.001, 9.020, 10.002, 10.012, 10.013, 10.014, 10.015, 10.019, 10.020, 10.021, 10.022, 10.025, 12.008, 12.010, 12.011.

### *Myzus persicae* (pulgón verde del melocotonero):

15 Se colocaron raíces de plántulas de guisante, infectadas con una población de áfidos de diversas edades, directamente en las soluciones de prueba de 24 ppm. Seis días después de la introducción, se controló la mortalidad en las muestras.

20 Los compuestos siguientes dieron al menos un 80% de control de *Myzus persicae*: 2.025, 2.024, 2.022, 2.001, 2.031, 4.001, 2.003, 2.006, 2.019, 2.030, 2.058, 2.066, 2.067, 7.006, 8.025, 10.002, 10.006, 10.009, 10.011, 10.015.

### *Tetranychus urticae* (arañita de 2 puntos):

25 Se colocaron discos de hojas de frijol sobre agar en una placa de microtitulación de 24 pocillos y se asperjaron con soluciones de prueba a una dosis de aplicación de 200/50/12.5 ppm. Una vez secos, los discos de hojas se infectaron con una población de ácaros de diversas edades. Ocho días más tarde, a los discos se les controló la mortalidad de huevos, la mortalidad de larvas y la mortalidad de adultos.

30 Los compuestos siguientes dieron al menos un 80% de control de *Tetranychus urticae*: 2.024, 2.022, 7.006, 2.020, 2.006, 2.019, 7.010, 2.030, 2.058, 2.066, 2.067, 6.022, 6.032, 7.006, 8.018, 8.025, 8.026, 8.027, 8.031, 8.032.

35

40

45

50

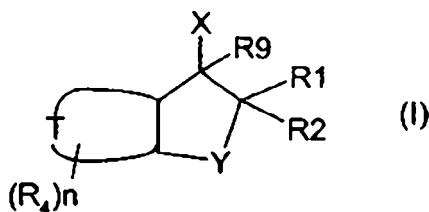
55

60

65

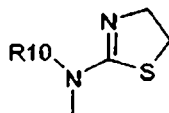
REIVINDICACIONES

1. Un método para combatir y controlar insectos, ácaros o moluscos, que comprende aplicar a una plaga, al sitio de una plaga, o a una planta susceptible de ser atacada por una plaga una cantidad insecticidamente, acaricidamente, nematocidamente, o moluscicidamente eficaz de un compuesto de fórmula (I):

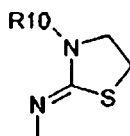


donde

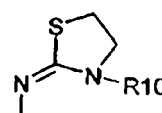
X es (i), (ii) o (iii)



(i)



(ii)

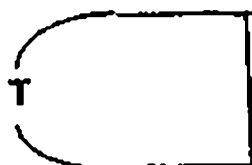


(iii)

Y es O, S(O)<sub>m</sub>, NR<sup>3</sup>, CR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>, CR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>-CR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>, O-CR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>, S(O)<sub>m</sub>-CR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>, NR<sup>3</sup>-CR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>, CR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>-O, CR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>-S(O)<sub>m</sub>, CR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>-NR<sup>3</sup>, SO<sub>2</sub>-NR<sup>3</sup>, NR<sup>3</sup>-SO<sub>2</sub>, NR<sup>3</sup>-O o O-NR<sup>3</sup>;

m es 0, 1 o 2;

el anillo (T)



(T)

es un anillo aromático o heteroaromático de 5 o 6 miembros;

R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup> y R<sup>8</sup> son cada uno independientemente H, OH, halógeno, nitro, ciano, rodano, carboxi, formilo, formiloxi, G-, G-O-, G-S-, G-A-, R<sup>21</sup>R<sup>22</sup>N-, R<sup>21</sup>R<sup>22</sup>N-A-, G-O-A-, G-S-A-, G-A-O-, G-A-S-, G-A-NR<sup>23</sup>-, R<sup>21</sup>R<sup>22</sup>N-A-O-, R<sup>21</sup>R<sup>22</sup>N-A-S-, R<sup>21</sup>R<sup>22</sup>N-A-NR<sup>23</sup>-, G-O-A-O-, G-O-A-S-, G-O-A-NR<sup>23</sup>-, G-S-A-O, G-S-A-NR<sup>23</sup>- o R<sup>20</sup>S(O)(=NR<sup>17</sup>)-; o dos de los grupos R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup> y R<sup>8</sup> unidos al mismo átomo de carbono son =O, =S, =NR<sup>11</sup> o =CR<sup>12</sup>-R<sup>13</sup>, o los grupos R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup>, R<sup>5</sup> y R<sup>6</sup> o R<sup>7</sup> y R<sup>8</sup> junto con el átomo de carbono al cual están unidos forman un anillo de tres a seis miembros, que contiene al menos 2 átomos de carbono y opcionalmente uno o dos átomos de azufre y/o uno o dos átomos de oxígeno no adyacentes o un grupo NR<sup>14</sup>, donde el anillo está opcionalmente sustituido con C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>alquilo; o dos de los grupos R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup> y R<sup>8</sup> unidos a átomos diferentes junto con los átomos a los cuales están unidos forman un anillo de tres a siete miembros, que contiene opcionalmente uno o dos átomos de azufre y/o uno o dos átomos de oxígeno no adyacentes o un grupo NR<sup>14</sup>, donde el anillo está opcionalmente sustituido con C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>alquilo o dos de los grupos R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup> y R<sup>8</sup> unidos a átomos adyacentes se combinan para formar un enlace;

R<sup>10</sup> es H, OH, ciano, formilo, tri(C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>alquil)sililo, G-, G-O-, G-S-, G-S-S-, G-A-, R<sup>24</sup>R<sup>25</sup>N-, R<sup>24</sup>R<sup>25</sup>N-S, R<sup>24</sup>R<sup>25</sup>N-A-, R<sup>18</sup>N=C(R<sup>19</sup>)-, G-A-NR<sup>69</sup>-, R<sup>70</sup>R<sup>71</sup>C=N-, G-O-A- o G-S-A-,

R<sup>11</sup> es H, OH, nitro, ciano, formilo, formiloxi, G-, G-O-, G-A-, R<sup>36</sup>R<sup>37</sup>N-, G-C(O)-O-, G-C(O)-NR<sup>26</sup>-, R<sup>36</sup>R<sup>37</sup>N-C(O)O-, G-OC(O)O-, G-OC(O)-NR<sup>26</sup>-;

## ES 2 353 159 T3

$R^{12}$  y  $R^{13}$  son cada uno independientemente H, halógeno, nitro, ciano, formilo, formiloxi, G-, G-O-, G-S-, G-A-,  $R^{40}R^{41}N$ -,  $R^{40}R^{41}N$ -A-, G-O-A-, G-A-O-,  $R^{40}R^{41}N$ -A-O-,  $R^{40}R^{41}N$ -A-S-, G-O-A-O-, G-O-A-S-, G-O-A-NR<sup>30</sup>-, o  $R^{12}$  y  $R^{13}$  junto con el átomo de carbono al cual están unidos forman un anillo carbocíclico de 3 a 6 miembros;

5  $R^3$ ,  $R^{14}$ ,  $R^{15}$  y  $R^{16}$  son cada uno independientemente H, OH, ciano, formilo, G-, G-O-, G-S-, G-A-,  $R^{27}R^{28}N$ -,  $R^{27}R^{28}N$ -A-, G-O-A-, G-S-A-, G-A-NR<sup>29</sup>-,  $R^{27}R^{28}N$ -A-NR<sup>29</sup>-, G-O-A-NR<sup>29</sup>- o G-S-A-NR<sup>29</sup>-;

10 cada  $R^4$  es independientemente OH, halógeno, nitro, ciano, azido, rodano, isotiocianato, carboxi, formilo, formiloxi, G-, G-O-, G-S-, G-A-,  $R^{31}R^{32}N$ -,  $R^{31}R^{32}N$ -A-, G-O-A-, G-S-A-, G-A-O-, G-A-S-, G-A-NR<sup>33</sup>-,  $R^{31}R^{32}N$ -A-O-,  $R^{31}R^{32}N$ -A-S-,  $R^{31}R^{32}N$ -A-NR<sup>33</sup>-, G-O-A-O-, G-O-A-S-, G-O-A-NR<sup>33</sup>-, G-S-A-O, G-S-A-NR<sup>33</sup>-,  $R^{20}S(O)(=NR^{17})$ -,  $R^{18}N=C(R^{19})$ -,  $R^{44}R^{45}P(O)$ -, o  $R^{44}R^{45}P(S)$ -, o 2 grupos  $R^4$  adyacentes junto con los átomos de carbono a los cuales están unidos forman un carbociclo o heterociclo de 4, 5, 6 o 7 miembros que puede estar opcionalmente sustituido con halógeno, o un grupo  $R^4$  junto con un grupo  $R^3$ ,  $R^5$  o  $R^9$  y los átomos a los cuales están unidos forman un anillo de 5-7 miembros que contiene opcionalmente un grupo NR<sup>15</sup> o un átomo de S u O, donde el anillo está opcionalmente  
15 sustituido con C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>alquilo;

n es 0, 1, 2, 3 o 4;

20  $R^9$  es H, formilo, G, G-A-,  $R^{34}R^{35}N$ -A-, G-O-A- o G-S-A-, o  $R^9$  junto con un grupo  $R^1$ ,  $R^5$  o  $R^7$  y los átomos a los cuales están unidos pueden formar un anillo de tres a siete miembros, que puede contener opcionalmente uno o dos átomos de azufre y/o uno o dos átomos de oxígeno no adyacentes o un grupo NR<sup>16</sup>;

$R^{17}$  es H, G-, G-C(O)- o G-OC(O)-;

25  $R^{18}$  es H, OH, ciano, nitro, G-, G-O- o  $R^{38}R^{39}N$ -;

$R^{19}$  es H, ciano, G-, G-O-, G-S o  $R^{42}R^{43}N$ -;

30  $R^{20}$  es C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>alquilo, fenilo opcionalmente sustituido o bencilo opcionalmente sustituido;

35 cada uno de los grupos  $R^{21}$  a  $R^{43}$  inclusive, son independientemente H o G-, o dos grupos  $R^{21}$ ,  $R^{22}$ ,  $R^{27}$ ,  $R^{28}$ ,  $R^{31}$ ,  $R^{32}$ ,  $R^{34}$ ,  $R^{35}$ ,  $R^{36}$ ,  $R^{37}$ ,  $R^{38}$ ,  $R^{39}$ ,  $R^{42}$ ,  $R^{43}$ , junto con el átomo de N al cual están unidos, forman un grupo  $N=CR^aR^b$  (donde  $R^a$  y  $R^b$  son H, o C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>alquilo) o dos grupos  $R^{21}$ ,  $R^{22}$ ,  $R^{24}$ ,  $R^{25}$ ,  $R^{27}$ ,  $R^{28}$ ,  $R^{31}$ ,  $R^{32}$ ,  $R^{34}$ ,  $R^{35}$ ,  $R^{36}$ ,  $R^{37}$ ,  $R^{38}$ ,  $R^{39}$ ,  $R^{42}$ ,  $R^{43}$ , junto con el átomo de N al cual están unidos, forman un anillo heterocíclico de cinco, seis o siete miembros que puede contener uno o dos heteroátomos más, seleccionados entre O, N o S y que puede estar opcionalmente sustituido con uno a cuatro grupos C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>alquilo;

$R^{44}$  y  $R^{45}$  son independientemente C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>alquilo, C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>alcoxi, fenilo o fenoxi;

40 G es C<sub>1-12</sub>alquilo opcionalmente sustituido, C<sub>2-12</sub>alqueno opcionalmente sustituido, C<sub>2-12</sub>alquino opcionalmente sustituido, C<sub>3-8</sub>cicloalquilo opcionalmente sustituido, C<sub>3-8</sub>cicloalqueno opcionalmente sustituido, arilo opcionalmente sustituido, heteroarilo opcionalmente sustituido o heterociclilo opcionalmente sustituido;

45  $R^{69}$  es H, G-, G-C(O)- o G-OC(O)-;

50  $R^{70}$  y  $R^{71}$  son independientemente H, ciano, nitro, G-, G-O-, G-S-, o  $R^{70}$  y  $R^{71}$  junto con el átomo de carbono al cual están unidos forman un anillo heterocíclico de cinco, seis o siete miembros que puede contener uno o dos heteroátomos más, seleccionados entre O, N o S y que puede estar opcionalmente sustituido con uno a cuatro grupos C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>alquilo;

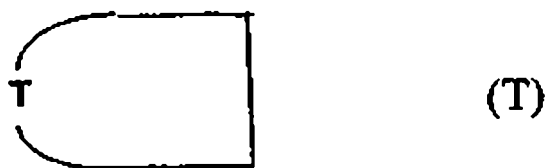
A es S(O), SO<sub>2</sub>, C(O) o C(S);

o sus sales o N-óxidos.

55 2. Un método de acuerdo con la reivindicación 1 donde  $R^{10}$  es H, OH, ciano, formilo, G-, G-O-, G-S-, G-S-S-, G-A-,  $R^{24}R^{25}N$ -,  $R^{24}R^{25}N$ -S-,  $R^{24}R^{25}N$ -A-,  $R^{18}N=C(R^{19})$ -, G-O-A- o G-S-A y  $R^{24}$  y  $R^{25}$  son H o G o, junto con el átomo de N al cual están unidos, forman un grupo  $N=CR^aR^b$  (donde  $R^a$  y  $R^b$  son H, o C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>alquilo) o junto con el átomo de N al cual están unidos, forman un anillo heterocíclico de cinco, seis o siete miembros que puede contener uno o dos heteroátomos más, seleccionados entre O, N o S y que puede estar opcionalmente sustituido con uno a cuatro grupos C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>alquilo; y  $R^{18}$  y  $R^{19}$ , G y A son los definidos en la reivindicación 1.  
60

65

3. Un método de acuerdo con la reivindicación 1 donde el anillo



15 es un anillo aromático de 6 miembros o un anillo heteroaromático de 5 ó 6 miembros donde los miembros del anillo son cada uno independientemente CH, S, N, NR<sup>4</sup>, O o CR<sup>4</sup> siempre que no haya más de un átomo de O o S presentes en el anillo.

20 4. Un método de acuerdo con la reivindicación 1 donde Y es O, S, S(O), SO<sub>2</sub>, NR<sup>3</sup> o CR<sup>5</sup>R<sup>6</sup> donde R<sup>3</sup>, R<sup>5</sup> y R<sup>6</sup> son los definidos en la reivindicación 1.

5 5. Un método de acuerdo con la reivindicación 1, donde cada grupo R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> es independientemente hidrógeno, hidroxilo, halógeno, ciano, C<sub>1-6</sub>alquilo, C<sub>1-6</sub>haloalquilo, C<sub>1-6</sub>alcoxi(C<sub>1-6</sub>)alquilo, fenil(C<sub>1-3</sub>)alquilo (donde el grupo fenilo puede estar opcionalmente sustituido con halógeno, C<sub>1-4</sub>alquilo, C<sub>1-4</sub>alcoxi, C<sub>1-4</sub>haloalquilo, C<sub>1-4</sub>haloalcoxi, CN, NO<sub>2</sub>, arilo, heteroarilo, amino, dialquilamino, C<sub>1-6</sub>alquilsulfonilo, C<sub>1-6</sub>alcoxycarbonilo), C<sub>3-5</sub>cicloalquilo, 1,3-dioxolan-2-ilo, fenilo (que puede estar opcionalmente sustituido con halógeno, C<sub>1-4</sub>alquilo, C<sub>1-4</sub>alcoxi, C<sub>1-4</sub>haloalquilo, C<sub>1-4</sub>haloalcoxi, CN, NO<sub>2</sub>, arilo, heteroarilo, amino, dialquilamino, C<sub>1-6</sub>alquilsulfonilo, C<sub>1-6</sub>alcoxycarbonilo), C<sub>1-6</sub>alcoxi, C<sub>1-6</sub>haloalcoxi, C<sub>2-6</sub>alquenciloxi, C<sub>2-6</sub>alquenciloxi, C<sub>1-3</sub>alcoxi(C<sub>1-3</sub>)alcoxi, benciloxi (donde el grupo fenilo está opcionalmente sustituido con halógeno, C<sub>1-4</sub>alquilo, C<sub>1-4</sub>alcoxi, C<sub>1-4</sub>haloalquilo, C<sub>1-4</sub>haloalcoxi, CN, NO<sub>2</sub>), C<sub>1-6</sub>alquiltio, C<sub>1-6</sub>haloalquiltio, formilo, C<sub>2-6</sub>alquilcarbonilo, fenilcarbonilo (donde el fenilo está opcionalmente sustituido con halógeno, C<sub>1-4</sub>alquilo, C<sub>1-4</sub>alcoxi, C<sub>1-4</sub>haloalquilo, C<sub>1-4</sub>haloalcoxi, CN, NO<sub>2</sub>), o R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> juntos son =O, =S, =NR<sup>50</sup> o =CR<sup>51</sup>R<sup>52</sup>, donde R<sup>50</sup> es OH, C<sub>1-6</sub>alcoxi o C<sub>1-6</sub>alquilcarbonilamino, y R<sup>51</sup> y R<sup>52</sup> son independientemente H, C<sub>1-6</sub>alquilo, o C<sub>1-6</sub>haloalquilo; o R<sup>1</sup> y R<sup>9</sup> junto con el átomo de carbono al cual están unidos forman un anillo de tres a seis miembros, que puede contener opcionalmente uno o dos átomos de oxígeno no adyacentes; o R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> forman juntos un anillo de tres a seis miembros, que puede contener opcionalmente uno o dos átomos de oxígeno no adyacentes.

30

35

6. Un método de acuerdo con la reivindicación 1, donde cada R<sup>4</sup> es independientemente halógeno, ciano, C<sub>1-8</sub>alquilo, C<sub>1-8</sub>haloalquilo, ciano(C<sub>1-6</sub>)alquilo, C<sub>1-3</sub>alcoxi(C<sub>1-3</sub>)alquilo, C<sub>2-6</sub>alquínilo, C<sub>3-6</sub>cicloalquilo, C<sub>1-3</sub>alquil(C<sub>3-6</sub>)cicloalquilo, fenilo (opcionalmente sustituido con halógeno, C<sub>1-4</sub>alquilo, C<sub>1-4</sub>alcoxi, C<sub>1-4</sub>haloalquilo, C<sub>1-4</sub>haloalcoxi, CN, NO<sub>2</sub>, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino), heterocíclico (opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, C<sub>1-6</sub>alquilo, C<sub>1-6</sub>haloalquilo, C<sub>1-6</sub>alcoxi o C<sub>1-6</sub>haloalcoxi), formilo, C<sub>1-6</sub>alquilcarbonilo, C<sub>1-6</sub>alcoxycarbonilo, C<sub>1-6</sub>alquiltiocarbonilo, C<sub>1-6</sub>alcoxitiocarbonilo, carbamoilo, C<sub>1-6</sub>alquilaminocarbonilo, di-C<sub>1-6</sub>alquilaminocarbonilo, tiocarbamoilo, C<sub>1-6</sub>alquilaminotiocarbonilo, di-C<sub>1-6</sub>alquilaminotiocarbonilo, C<sub>1-8</sub>alcoxi, C<sub>1-6</sub>haloalcoxi, fenoxi (opcionalmente sustituido con halógeno, C<sub>1-4</sub>alquilo, C<sub>1-4</sub>alcoxi, C<sub>1-4</sub>haloalquilo, C<sub>1-4</sub>haloalcoxi, CN, NO<sub>2</sub> o fenilo), heteroariloxi, (opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, C<sub>1-3</sub>alquilo, C<sub>1-3</sub>haloalquilo, C<sub>1-3</sub>alcoxi o C<sub>1-3</sub>haloalcoxi), C<sub>1-6</sub>alquilcarboniloxi, C<sub>1-6</sub>alcoxycarboniloxi, C<sub>1-6</sub>alquilaminocarboniloxi, di-C<sub>1-6</sub>alquilaminocarboniloxi, C<sub>1-6</sub>alquilaminotiocarboniloxi, di-C<sub>1-6</sub>alquilaminotiocarboniloxi, C<sub>1-8</sub>alquiltio, C<sub>1-6</sub>haloalquiltio, ariltio o heteroariltio (donde el arilo está opcionalmente sustituido con halógeno, C<sub>1-4</sub>alquilo, C<sub>1-4</sub>alcoxi, C<sub>1-4</sub>haloalquilo, C<sub>1-4</sub>haloalcoxi, CN, NO<sub>2</sub> o fenilo), C<sub>1-6</sub>alquilcarboniltio, C<sub>1-6</sub>alquilaminocarboniltio, di-C<sub>1-6</sub>alquilaminocarboniltio, di(C<sub>1-8</sub>)alquilamino, C<sub>1-6</sub>alquilcarbonilamino, C<sub>1-6</sub>alcoxycarbonilamino, C<sub>1-6</sub>alquilaminocarbonilamino, di-C<sub>1-6</sub>alquilaminocarbonilamino, aminotiocarbonilamino, C<sub>1-6</sub>alquilaminotiocarbonilamino, di-C<sub>1-6</sub>alquilaminotiocarbonilamino, o 2 grupos R<sup>4</sup> adyacentes junto con los átomos de carbono a los cuales están unidos forman un anillo carbocíclico o heterocíclico de 4, 5, 6 o 7 miembros que puede estar opcionalmente sustituido con halógeno; n es 0, 1, 2 o 3.

40

45

50

55

7. Un método de acuerdo con la reivindicación 1, donde R<sup>9</sup> es hidrógeno, C<sub>1-6</sub>alquilo, C<sub>1-6</sub>cianoalquilo, C<sub>1-6</sub>haloalquilo, C<sub>3-7</sub>cicloalquil(C<sub>1-4</sub>)alquilo, C<sub>1-6</sub>alcoxi(C<sub>1-6</sub>)alquilo, aril(C<sub>1-6</sub>)alquilo (donde el grupo arilo puede estar opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, C<sub>1-6</sub>alquilo, C<sub>1-6</sub>haloalquilo, C<sub>1-6</sub>alcoxi, C<sub>1-6</sub>haloalcoxi, C<sub>1-6</sub>alquilsulfonilo, C<sub>1-6</sub>alquilsulfonilo, C<sub>1-6</sub>alquilsulfonilo, C<sub>1-6</sub>alcoxycarbonilo, C<sub>1-6</sub>alquilcarbonilamino, arilcarbonilamino), C<sub>2-6</sub>alquilcarbonilo, fenilcarbonilo (donde el grupo fenilo está opcionalmente sustituido con halógeno, C<sub>1-4</sub>alquilo, C<sub>1-4</sub>alcoxi, C<sub>1-4</sub>haloalquilo, C<sub>1-4</sub>haloalcoxi, CN, NO<sub>2</sub>, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino), C<sub>1-6</sub>alcoxycarbonilo, C(O)NR<sup>63</sup>R<sup>64</sup> (donde R<sup>63</sup> y R<sup>64</sup> son independientemente hidrógeno, C<sub>1-6</sub>alquilo o C<sub>1-6</sub>haloalquilo o C<sub>1-6</sub>alcoxi(C<sub>1-6</sub>)alquilo o R<sup>63</sup> y R<sup>64</sup> junto con el átomo de N al cual están unidos forman un anillo de cinco, seis o siete miembros que contiene un átomo de O o S), o R<sup>9</sup> y R<sup>1</sup> junto con los átomos de carbono a los cuales están unidos forman un anillo de tres a seis miembros.

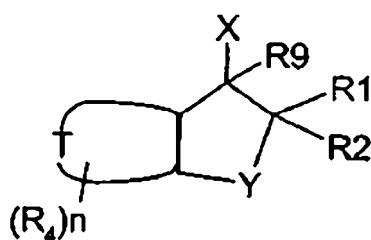
60

65

ES 2 353 159 T3

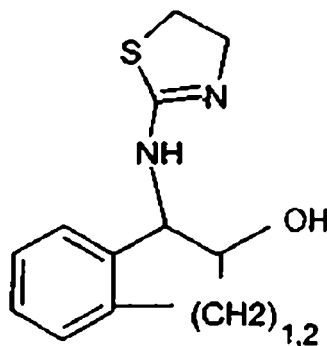
8. Un método de acuerdo con la reivindicación 1, donde R<sup>10</sup> es hidrógeno, hidroxilo, ciano, 1,3-tiazolilo, tri (C<sub>1-6</sub>alquil)sililo, C<sub>1-6</sub>alquilo, C<sub>1-6</sub>haloalquilo, C<sub>1-6</sub>alcoxi(C<sub>1-6</sub>)alquilo, fenil(C<sub>1-3</sub>)alquilo (donde el grupo fenilo puede estar opcionalmente sustituido con halógeno, C<sub>1-4</sub>alquilo, C<sub>1-4</sub>alcoxi, C<sub>1-4</sub>haloalquilo, C<sub>1-4</sub>haloalcoxi, CN, NO<sub>2</sub>, arilo, heteroarilo, amino, dialquilamino, C<sub>1-6</sub>alquilsulfonilo, C<sub>1-6</sub>alcoxycarbonilo), C<sub>1-6</sub>alcoxi, C<sub>1-6</sub>haloalcoxi, C<sub>2-6</sub>alqueniloxi, C<sub>2-6</sub>alquiniloxi, C<sub>1-3</sub>alcoxi(C<sub>1-3</sub>)alcoxi, benciloxi (donde el grupo fenilo está opcionalmente sustituido con halógeno, C<sub>1-4</sub>alquilo, C<sub>1-4</sub>alcoxi, C<sub>1-4</sub>haloalquilo, C<sub>1-4</sub>haloalcoxi, CN, NO<sub>2</sub>), C<sub>1-6</sub>alquiltio, C<sub>1-6</sub>haloalquiltio, feniltio (donde el grupo fenilo está opcionalmente sustituido con halógeno, C<sub>1-4</sub>alquilo, C<sub>1-4</sub>alcoxi, C<sub>1-4</sub>haloalquilo, C<sub>1-4</sub>haloalcoxi, CN, NO<sub>2</sub>), C<sub>1-6</sub>alquilditio, C<sub>1-6</sub>haloalquilditio, formilo, C<sub>2-6</sub>alquilcarbonilo, C<sub>2-6</sub>haloalquilcarbonilo, C<sub>1-6</sub>alcoxycarbonilo, arilcarbonilo (donde el grupo arilo está opcionalmente sustituido con halógeno, C<sub>1-4</sub>alquilo, C<sub>1-4</sub>alcoxi, C<sub>1-4</sub>haloalquilo, C<sub>1-4</sub>haloalcoxi, CN, NO<sub>2</sub>), NR<sup>55</sup>R<sup>56</sup> (donde R<sup>55</sup> y R<sup>56</sup> son independientemente hidrógeno, C<sub>1-6</sub>alquilo o C<sub>1-6</sub>haloalquilo, C<sub>1-6</sub>alcoxi(C<sub>1-6</sub>)alquilo, C<sub>1-6</sub>alquilcarbonilo o R<sup>55</sup> y R<sup>56</sup> junto con el átomo de N al cual están unidos forman un anillo de cinco, seis o siete miembros que contiene un átomo de O o S).

9. Un compuesto de fórmula (IC)

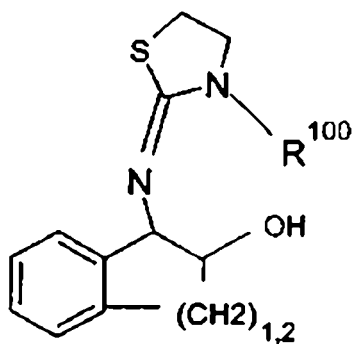


(IC),

donde R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>9</sup>, T, X, Y y n son los definidos en relación con la fórmula I o sus sales o N-óxidos, con la condición de que los compuestos siguientes de las fórmulas (IC1) a (IC3) estén excluidos:

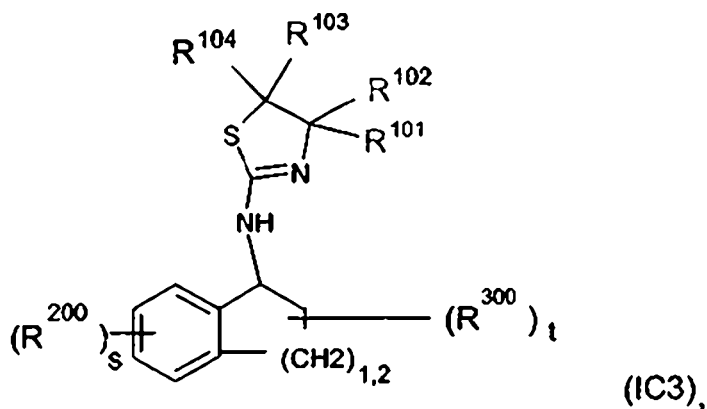


(IC1),



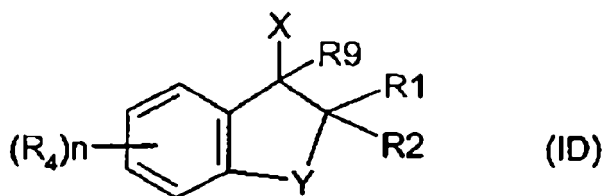
(IC2),

donde R<sup>100</sup> es hidrógeno o acetilo, y



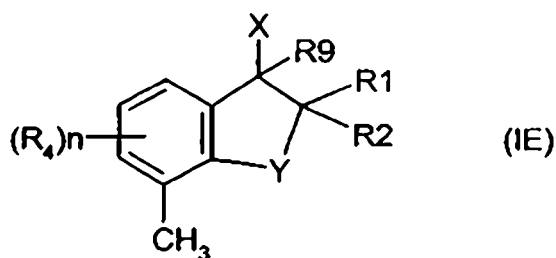
25 donde R<sup>101</sup>, R<sup>102</sup>, R<sup>103</sup> y R<sup>104</sup> son hidrógeno, R<sup>200</sup> y R<sup>300</sup> son independientemente uno de otro halógeno, C<sub>1-4</sub>alquilo, C<sub>1-4</sub>alcoxi, C<sub>1-4</sub>alquiltio, trifluorometilo o trifluorometoxi, donde s y t son independientemente uno de otro 0, 1, 2 o 3, y el total de s + t no es mayor de 3.

10. Los compuestos de acuerdo con la reivindicación 9 de fórmula ID



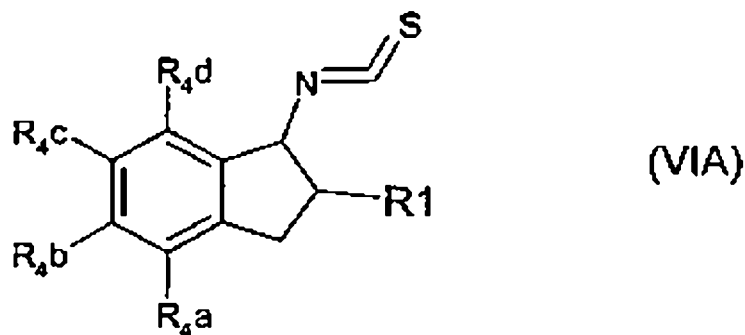
45 o sus sales o N-óxidos, donde Y es CR<sup>5</sup>R<sup>6</sup> o CR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>CR<sup>7</sup>R<sup>8</sup>, y R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>9</sup>, X y n son los definidos en la reivindicación 9, donde al menos uno de R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>7</sup>, R<sup>8</sup> o R<sup>9</sup> es flúor.

11. Los compuestos de acuerdo con la reivindicación 9 de fórmula IE



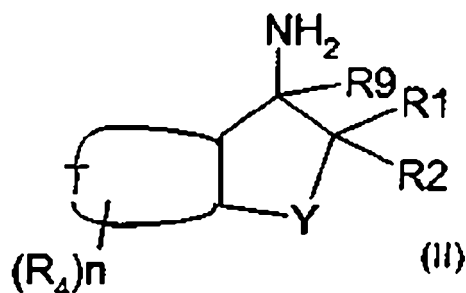
65 o sus sales o N-óxidos, donde Y es CR<sup>5</sup>R<sup>6</sup>, y R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>9</sup> y X son los definidos en la reivindicación 9, y n es 0, 1, 2 o 3.

12. Los compuestos de fórmula VIA

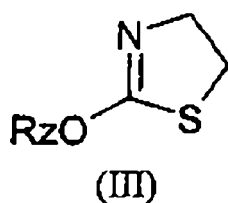


20 donde  $R^1$ ,  $R^{4a}$ ,  $R^{4b}$ ,  $R^{4c}$  y  $R^{4d}$  son cada uno independientemente H, halógeno,  $C_1$ - $C_6$ alquilo o  $C_1$ - $C_6$ haloalquilo, y donde al menos uno de esos sustituyentes debe ser diferente de H.

25 13. Un proceso para preparar un compuesto de fórmula I según se define en la reivindicación 1 y  $R^{10}$  es H donde dicho proceso comprende hacer reaccionar un compuesto de fórmula (II).



40 donde  $R^1$ ,  $R^2$ ,  $R^4$ ,  $R^9$ , T, Y y n son los definidos en relación con la fórmula (I) con un compuesto de fórmula (III).



55 donde  $R_z$  es alquilo o arilo opcionalmente sustituido.

60 14. Una composición insecticida y acaricida que comprende una cantidad insecticidamente o acaricidamente eficaz de un compuesto de fórmula I según se definió en la reivindicación 1.

65