

19

OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA

11 Número de publicación: **2 997 250**

51 Int. Cl.:

C07D 237/16 (2006.01)
A01N 43/58 (2006.01)
C07D 401/10 (2006.01)
C07D 403/10 (2006.01)
C07D 409/10 (2006.01)
C07D 413/10 (2006.01)
C07D 417/10 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

- 86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **17.07.2020** **PCT/EP2020/070242**
87 Fecha y número de publicación internacional: **21.01.2021** **WO21009334**
96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **17.07.2020** **E 20745118 (8)**
97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **11.09.2024** **EP 3999494**

54 Título: **Piridazinonas sustituidas como herbicidas**

30 Prioridad:

18.07.2019 GB 201910290

45 Fecha de publicación y mención en BOPI de la
traducción de la patente:
14.02.2025

73 Titular/es:

SYNGENTA CROP PROTECTION AG (100.00%)
Rosentalstrasse 67
4058 Basel, CH

72 Inventor/es:

LING, KENNETH, BRUCE;
SEDEN, PETER, TIMOTHY;
MATHEWS, CHRISTOPHER, JOHN;
SHANAHAN, STEPHEN, EDWARD;
KITSIOU, CHRISTIANA y
FINNEY, JOHN

74 Agente/Representante:

LEHMANN NOVO, María Isabel

ES 2 997 250 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

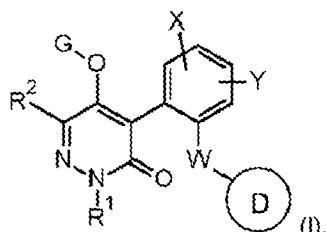
Piridazinonas sustituidas como herbicidas

La presente invención se refiere a fenilpiridazinodionas sustituidas y derivados de fenilpiridazinona sustituidos herbicidas de las fórmulas (I), (Ia), (Ib), así como también a los procesos y productos intermedios usados para la preparación de dichos derivados. La invención se refiere además a composiciones herbicidas que comprenden dichos derivados, así como al uso de dichos compuestos y composiciones en el control del crecimiento de plantas no deseables; en particular el uso en el control de malezas, tales como malezas dicotiledóneas latifolias, en cultivos de plantas útiles.

Las piridazinonas herbicidas se conocen del documento de patente WO 2009/086041. Además, las piridazinonas heterociclil-sustituidas de 5/6 miembros herbicidas se conocen de los documentos de patente WO2016008816 y WO 2011/045271. El documento de patente WO2013/160126 describe derivados de indolil-piridazinona, que muestran actividad herbicida.

La presente invención se basa en el descubrimiento de que las fenilpiridazinodionas sustituidas y los derivados de fenilpiridazinona sustituidos de fórmula (I) presentan una actividad herbicida sorprendentemente buena.

Por lo tanto, en un primer aspecto, se proporciona un compuesto de fórmula (I)



o una sal o N-óxido del mismo, en donde

R¹ se selecciona del grupo que consiste en alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₃-C₆, alcoxi C₁-C₂-alquilo C₁-C₂, alquenilo C₂-C₄, haloalquilo C₁-C₄, ciano-alquilo C₁-C₄, haloalquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄ y haloalquinilo C₂-C₄;

R² se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₃-alquil C₁-C₃-, alcoxi C₁-C₆, alcoxi C₁-C₃-alquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃-alcoxi C₁-C₃-alquil C₁-C₃-, cicloalquilo C₃-C₆, alquenilo C₂-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, hidroxialquil C₁-C₆-, alquil C₁-C₆-carbonilo, -S(O)_m-alquilo C₁-C₆, amino, alquil C₁-C₆-amino, dialquil C₁-C₆-amino, -C(alquil C₁-C₃)=N-O-alquilo C₁-C₃ y haloalquinilo C₂-C₆;

G es hidrógeno o C(O)R³;

R³ se selecciona del grupo que consiste en alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, alquil C₁-C₆-S-, alcoxi C₁-C₆-, -NR⁴R⁵ y fenilo opcionalmente sustituido con uno o más R⁶;

cada R⁴ y R⁵ se selecciona independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆ y cicloalquilo C₃-C₆, o R⁴ y R⁵ juntos pueden formar un anillo de morfolinilo; y

cada R^{4a} y R^{5a} se selecciona independientemente del grupo que consiste en alcoxi C₁-C₆ y cicloalquilo C₃-C₆, o R^{4a} y R^{5a} juntos pueden formar un anillo morfolinilo; y

R⁶ se selecciona del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃ y haloalcoxi C₁-C₃;

X e Y son cada uno independientemente hidrógeno, alquilo C₁-C₃, ciclopropilo, alcoxi C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃ o halógeno;

D es un anillo heteroarilo monocíclico sustituido que contiene 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados independientemente de oxígeno, nitrógeno y azufre, sustituido en al menos un átomo de carbono del anillo con R⁸ y/o en al menos un átomo de nitrógeno del anillo con R⁹;

al menos un R⁸ se selecciona del grupo que consiste en haloalquil C₁-C₆-carbonil-, cicloalquil C₃-C₆-carbonil-, -S(O)_m-haloalquilo C₁-C₆-, -S(O)_m-cicloalquilo C₃-C₆-, -O-S(O)₂-alquilo C₁-C₃-, -alquil C₁-C₃-S(O)_m-alquilo C₁-

C₆-, alquil C₁-C₃-S(O)_m-haloalquilo C₁-C₆-, alquil C₁-C₃-S(O)_m-cicloalquilo C₃-C₆-, cianoalquil C₁-C₆-, -NR^{4a}R^{5a}, -C(S)NR⁴R⁵, -S(O)₂NHC(O)-alquilo C₁-C₃-, -S(O)₂NR⁴R⁵, -C(O)OH, -C(O)O-alquilo C₁-C₆-, -C(O)NHS-(O)₂-alquilo C₁-C₆-, -C(O)NR⁴R⁵, -NR⁴C(O)NR⁴R⁵, alquil C₁-C₆-carbonil(alquil C₁-C₆)amino-, haloalquil C₁-C₆-carbonilamino-, haloalquil C₁-C₆-carbonil(alquil C₁-C₆)amino-, alquil C₁-C₆-sulfonilamino-, alquil C₁-C₆-sulfonil(alquil C₁-C₆)amino-, haloalquil C₁-C₆-sulfonilamino-, haloalquil C₁-C₆-sulfonil(alquil C₁-C₆)amino-, cicloalquil C₃-C₆-sulfonilamino-, cicloalquil C₃-C₆-sulfonil(alquil C₁-C₆)amino-, hidroxiamino-, hidroxi(alquil C₁-C₆)amino, alcoxi C₁-C₆-amino, alcoxi C₁-C₆(alquil C₁-C₆)amino, haloalcoxi C₁-C₆-amino, haloalcoxi C₁-C₆(alquil C₁-C₆)amino; y un sistema de anillos seleccionado del grupo que consiste en un anillo de fenilo, un anillo de heteroarilo de 5-6 miembros y un anillo de heterociclilo de 3-6 miembros, en donde dicho sistema de anillos está sustituido por 0 a 5 R¹⁶;

al menos un R⁹ se selecciona del grupo que consiste en alquilo C₅-C₆-, haloalquilo C₅-C₆-, cicloalquilo C₃-C₆-, alcoxi C₁-C₃-alquil C₃-, alcoxi C₃-alquil C₁-C₂-, haloalcoxi C₁-C₃-alquil C₁-C₃-, alcoxi C₁-C₃-alcoxi C₁-C₃-alquil C₁-C₃-, hidroxialquil C₁-C₆-, -alquil C₁-C₃-S(O)_m-alquilo C₁-C₆-, -alquil C₁-C₃-S(O)_m-haloalquilo C₁-C₆-, -alquil C₁-C₃-S(O)_m-cicloalquilo C₃-C₆-, cianoalquil C₁-C₆-, y un sistema de anillos seleccionado del grupo que consiste en: un anillo de fenilo, un anillo de heteroarilo de 5-6 miembros y un anillo de heterociclilo de 3-6 miembros, en donde dicho sistema de anillos está sustituido por 0 a 5 R¹⁶;

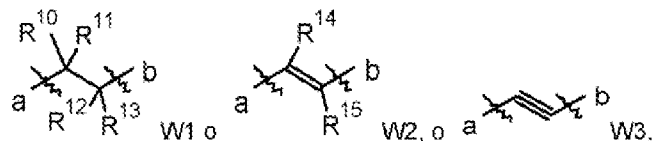
m es un número entero de 0, 1 o 2;

cada R¹⁶ es independientemente halógeno, ciano, alquilo C₁-C₆-, haloalquilo C₁-C₆-, alcoxi C₁-C₆ o haloalcoxi C₁-C₆;

o D es un anillo de fenilo sustituido por al menos un R⁸;

y

W es o



en donde:

"a" indica el punto de unión al resto fenilpiridazinodiona/fenilpiridazinona,

"b" indica el punto de unión al anillo D,

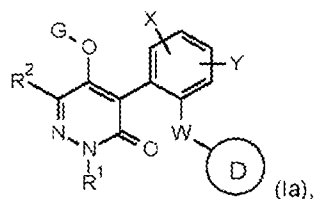
R¹⁰, R¹², R¹⁴ y R¹⁵ son cada uno independientemente hidrógeno, alquilo C₁-C₃ o haloalquilo C₁-C₃;

o R¹⁰ y R¹² junto con los átomos de carbono a los que están unidos forman un anillo carbocíclico C₃-C₆; y

R¹¹ y R¹³ son cada uno independientemente hidrógeno, halógeno, alquilo C₁-C₃ o haloalquilo C₁-C₃;

con la condición de que cuando uno de R¹¹ o R¹³ es halógeno, alquilo C₁-C₃ o haloalquilo C₁-C₃, el otro es hidrógeno.

En un segundo aspecto, se proporciona un compuesto de la fórmula (Ia)



o una sal o N-óxido del mismo, en donde

R¹ se selecciona del grupo que consiste en alquilo C₁-C₄-, cicloalquilo C₃-C₆-, alcoxi C₃-C₆-, alcoxi C₁-C₂-alquilo C₁-C₂-, alqueno C₂-C₄-, haloalquilo C₁-C₄-, ciano-alquilo C₁-C₄-, haloalqueno C₂-C₄-, alquino C₂-C₄ y haloalquino C₂-C₄;

R² se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₃-alquil C₁-C₃-, alcoxi C₁-C₆, alcoxi C₁-C₃-alquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃-alcoxi C₁-C₃-alquil C₁-C₃-, cicloalquilo C₃-C₆, alqueno C₂-C₆, haloalqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, hidroalquil C₁-C₆-, alquil C₁-C₆-carbonil-, -S(O)_m-alquilo C₁-C₆-, -NR⁴R⁵-, -C(alquil C₁-C₃)=N-O-alquilo C₁-C₃ y haloalquino C₂-C₆;

G es hidrógeno o C(O)R³;

R³ se selecciona del grupo que consiste en alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, alquil C₁-C₆-S-, alcoxi C₁-C₆-, -NR⁴R⁵ y fenilo opcionalmente sustituido con uno o más R⁶;

cada R⁴ y R⁵ se selecciona independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆ y cicloalquilo C₃-C₆, o R⁴ y R⁵ juntos pueden formar un anillo de morfolino; y

R⁶ se selecciona del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃ y haloalcoxi C₁-C₃;

X es ciclopropilo (preferiblemente X es *orto* con respecto al resto de piridazina/piridazina-diona);

Y es hidrógeno, alquilo C₁-C₃, ciclopropilo, alcoxi C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃ o halógeno (Y está en *orto* (posición 3) con respecto al resto -W-D);

D es un anillo de heteroarilo monocíclico sustituido o sin sustituir que contiene 1, 2, o 3 heteroátomos independientemente seleccionados de oxígeno, nitrógeno y azufre, y en donde cuando D está sustituido, está sustituido en al menos un anillo átomo de carbono con R⁸ y/o en un anillo átomo de nitrógeno con R⁹; cada R⁸ es independientemente oxígeno, hidroxilo, halógeno, ciano, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alcoxi C₁-C₃-alquilo C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃-alquil C₁-C₃-, alcoxi C₁-C₃-alcoxi C₁-C₃-alquil C₁-C₃-, alqueno C₂-C₆, haloalqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, haloalquino C₂-C₆, hidroalquil C₁-C₆-, alquil C₁-C₆-carbonil-, haloalquil C₁-C₆-carbonil-, cicloalquil C₃-C₆-carbonil-, -S(O)_m-haloalquilo C₁-C₆-, -S(O)_m-cicloalquilo C₃-C₆-, -O-S(O)₂-alquilo C₁-C₃-, -alquil C₁-C₃-S(O)_m-alquilo C₁-C₆-, -alquil C₁-C₃-S(O)_m-haloalquilo C₁-C₆-, -alquil C₁-C₃-S(O)_m-cicloalquilo C₃-C₆-, cianoalquil C₁-C₆-, NR⁴R⁵-, -C(S)NR⁴R⁵-, -S(O)₂NHC(O)alquilo C₁-C₃-, -S(O)₂NR⁴R⁵-, -C(O)OH-, -C(O)Oalquilo C₁-C₆-, -C(O)NHS-(O)₂-alquilo C₁-C₆-, -C(O)NR⁴R⁵-, -NR⁴C(O)NR⁴R⁵-, alquil C₁-C₆-carbonil(alquil C₁-C₆)amino-, haloalquil C₁-C₆-carbonil(alquil C₁-C₆)amino-, alquil C₁-C₆-sulfonilamino-, alquil C₁-C₆-sulfonil(alquil C₁-C₆)amino-, haloalquil C₁-C₆-sulfonilamino-, haloalquil C₁-C₆-sulfonil(alquil C₁-C₆)amino-, cicloalquil C₃-C₆-sulfonilamino-, cicloalquil C₃-C₆-sulfonil(alquil C₁-C₆)amino-, hidroxi-amino-, hidroxi(alquil C₁-C₆)amino-, alcoxi C₁-C₆-amino-, alcoxi C₁-C₆(alquil C₁-C₆)amino-, haloalcoxi C₁-C₆-amino-, haloalcoxi C₁-C₆(alquil C₁-C₆)amino; o un sistema de anillos seleccionado del grupo que consiste en un anillo de fenilo, un anillo de heteroarilo de 5-6 miembros y un anillo de heterociclilo de 3-6 miembros, en donde dicho sistema de anillos está sustituido por 0 a 5 R¹⁶;

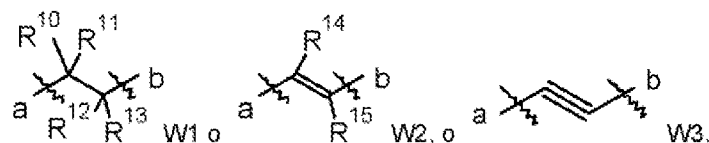
m es un número entero de 0, 1 o 2 (preferiblemente 0 o 2); y

cada R⁹ es independientemente alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₃-alquilo C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃-alquil C₁-C₃-, alcoxi C₁-C₃-alcoxi C₁-C₃-alquil C₁-C₃-, hidroalquil C₁-C₆-, -alquil C₁-C₃-S(O)_m-alquilo C₁-C₆-, -alquil C₁-C₃-S(O)_m-haloalquilo C₁-C₆-, -alquil C₁-C₃-S(O)_m-cicloalquilo C₃-C₆-, cianoalquil C₁-C₆-, o un sistema de anillos seleccionado del grupo que consiste en: un anillo de fenilo, un anillo de heteroarilo de 5-6 miembros y un anillo de heterociclilo de 3-6 miembros, en donde dicho sistema de anillos está sustituido por 0 a 5 R¹⁶;

cada R¹⁶ es independientemente halógeno, ciano, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆ o haloalcoxi C₁-C₆;

o D es un anillo de fenilo sustituido o sin sustituir, y en donde cuando dicho anillo de fenilo está sustituido, está sustituido por 1 a 5 R⁸;

y W es



en donde

"a" indica el punto de unión al resto de fenil-piridazina-diona/fenil-piridazinona, "b" indica el punto de unión al anillo D,

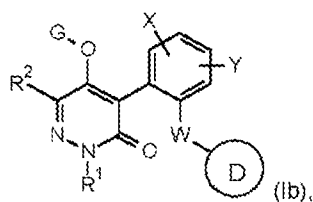
R¹⁰, R¹², R¹⁴ y R¹⁵ son cada uno independientemente hidrógeno, alquilo C₁-C₃ o haloalquilo C₁-C₃;

o R¹⁰ y R¹² junto con los átomos de carbono a los que están unidos forman un anillo carbocíclico C₃-C₆; y

R¹¹ y R¹³ son cada uno independientemente hidrógeno, halógeno, alquilo C₁-C₃ o haloalquilo C₁-C₃;

con la condición de que cuando uno de R¹¹ o R¹³ es halógeno, alquilo C₁-C₃ o haloalquilo C₁-C₃, el otro es hidrógeno.

En un tercer aspecto, se proporciona un compuesto de la fórmula (Ib)



o una sal o N-óxido del mismo, en donde

R¹ se selecciona del grupo que consiste en alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₃-C₆, alcoxi C₁-C₂-alquilo C₁-C₂, alquenilo C₂-C₄, haloalquilo C₁-C₄, ciano-alquilo C₁-C₄, haloalquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄ y haloalquinilo C₂-C₄;

R² se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₃-alquil C₁-C₃-, alcoxi C₁-C₆, alcoxi C₁-C₃-alquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃-alcoxi C₁-C₃-alquil C₁-C₃-, cicloalquilo C₃-C₆, alquenilo C₂-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, hidroxialquil C₁-C₆-, alquil C₁-C₆-carbonil-, -S(O)_m-alquilo C₁-C₆, -NR⁴R⁵, -C(alquil C₁-C₃)=N-O-alquilo C₁-C₃ y haloalquinilo C₂-C₆;

G es hidrógeno o C(O)R³;

R³ se selecciona del grupo que consiste en alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, alquil C₁-C₆-S-, alcoxi C₁-C₆, -NR⁴R⁵ y fenilo opcionalmente sustituido con uno o más R⁶;

cada R⁴ y R⁵ se selecciona independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆ y cicloalquilo C₃-C₆, o R⁴ y R⁵ juntos pueden formar un anillo de morfolino; y

R⁶ se selecciona del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃ y haloalcoxi C₁-C₃.

X es hidrógeno, alquilo C₁-C₃, ciclopropilo, alcoxi C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃ o halógeno (preferiblemente, X está en *orto* con respecto al resto de piridazinona/piridazina-diona);

Y es ciclopropilo (preferiblemente, Y está en *orto* con respecto al resto -W-D);

D es un anillo de heteroarilo monocíclico sustituido o sin sustituir que contiene 1, 2, o 3 heteroátomos independientemente seleccionados de oxígeno, nitrógeno y azufre, y en donde cuando D está sustituido, está sustituido en al menos un anillo átomo de carbono con R⁸ y/o en un anillo átomo de nitrógeno con R⁹; cada R⁸ es independientemente oxígeno, hidroxilo, halógeno, ciano, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alcoxi C₁-C₃-alquilo C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃-alquil C₁-C₃-, alcoxi C₁-C₃-alcoxi C₁-C₃-alquil C₁-C₃-, alquenilo C₂-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, hidroxialquil C₁-C₆-, alquil C₁-C₆-carbonil-, haloalquil C₁-C₆-carbonil-, cicloalquil C₃-C₆-carbonil-, -S(O)_m-haloalquilo C₁-C₆-, -S(O)_m-cicloalquilo C₃-C₆-, -O-S(O)₂-alquilo C₁-C₃-, alquil C₁-C₃-S(O)_m-alquilo C₁-C₆-, alquil C₁-C₃-S(O)_m-haloalquilo C₁-C₆-, alquil C₁-C₃-S(O)_m-cicloalquilo C₃-C₆-, cianoalquil C₁-C₆-, NR⁴R⁵, -C(S)NR⁴R⁵, -S(O)₂NHC(O)alquilo C₁-C₃-, -S(O)₂NR⁴R⁵, -C(O)OH, -C(O)Oalquilo C₁-C₆-, -C(O)NHS-(O)₂-alquilo C₁-C₆-, -C(O)NR⁴R⁵, -NR⁴C(O)NR⁴R⁵, alquil C₁-C₆-carbonil(alquil C₁-C₆)amino-, haloalquil C₁-C₆-carbonilamino-, haloalquil C₁-C₆-carbonil(alquil C₁-C₆)amino-, alquil C₁-C₆-sulfonilamino-, alquil C₁-C₆-sulfonil(alquil C₁-C₆)amino-, haloalquil C₁-C₆-sulfonilamino-, haloalquil C₁-C₆-sulfonil(alquil C₁-C₆)amino-, cicloalquil C₃-C₆-sulfonilamino-, cicloalquil C₃-C₆-sulfonil(alquil C₁-C₆)amino-, hidroxiamino-, hidroxi(alquil C₁-C₆)amino, alcoxi C₁-C₆-amino, alcoxi C₁-C₆(alquil C₁-C₆)amino, haloalcoxi C₁-C₆-amino, haloalcoxi C₁-C₆(alquil C₁-C₆)amino; o un sistema de anillos seleccionado del grupo que consiste: en un anillo de fenilo, un anillo de heteroarilo de

5-6 miembros y un anillo de heterociclilo de 3-6 miembros, en donde dicho sistema de anillos está sustituido por 0 a 5 R^{16} ;

m es un número entero de 0, 1 o 2; y

cada R^9 es independientemente alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_3 -alquilo C_1-C_3 , haloalcoxi C_1-C_3 -alquilo C_1-C_3 -, alcoxi C_1-C_3 -alcoxi C_1-C_3 -alquilo C_1-C_3 -, hidroxialquilo C_1-C_6 -, -alquilo C_1-C_3 -S(O)_m-alquilo C_1-C_6 -, -alquilo C_1-C_3 -S(O)_m-haloalquilo C_1-C_6 -, -alquilo C_1-C_3 -S(O)_m-cicloalquilo C_3-C_6 , cianoalquilo C_1-C_6 -, o un sistema de anillos seleccionado del grupo que consiste en: un anillo de fenilo, un anillo de heteroarilo de 5-6 miembros y un anillo de heterociclilo de 3-6 miembros, en donde dicho sistema de anillos está sustituido por 0 a 5 R^{16} ;

cada R^{16} es independientemente halógeno, ciano, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 o haloalcoxi C_1-C_6 ;

o D es un anillo de fenilo sustituido o sin sustituir, y en donde cuando dicho anillo de fenilo está sustituido, está sustituido por 1 a 5 R^8 ; y

W es o



en donde

"a" indica el punto de unión al resto fenilpiridazinodiona/fenilpiridazinona,

"b" indica el punto de unión al anillo D,

R^{10} , R^{12} , R^{14} y R^{15} son cada uno independientemente hidrógeno, alquilo C_1-C_3 o haloalquilo C_1-C_3 ;

o R^{10} y R^{12} junto con los átomos de carbono a los que están unidos forman un anillo carbocíclico C_3-C_6 ;

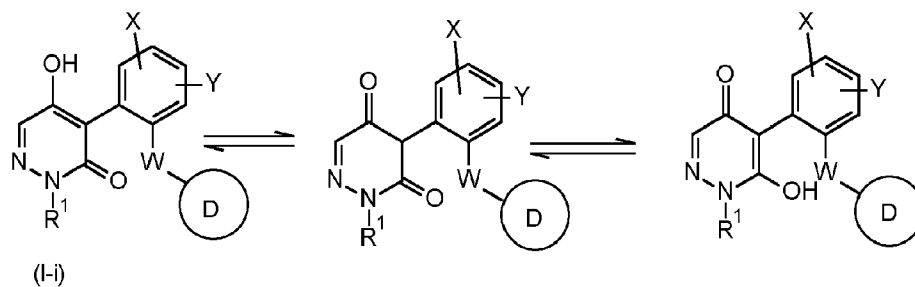
R^{11} y R^{13} son cada uno independientemente hidrógeno, halógeno, alquilo C_1-C_3 o haloalquilo C_1-C_3 ;

con la condición de que cuando uno de R^{11} o R^{13} es halógeno, alquilo C_1-C_3 o haloalquilo C_1-C_3 , el otro es hidrógeno. Referencias a la fórmula (I) en los siguientes párrafos engloban las fórmulas (I), (Ia), (Ib).

Los compuestos de fórmula (I) pueden contener centros asimétricos y pueden estar presentes como un único enantiómero, pares de enantiómeros en cualquier proporción o, cuando haya más de un centro asimétrico presente, pueden contener diastereoisómeros en todas las proporciones posibles. Habitualmente, uno de los enantiómeros tiene una actividad biológica potenciada en comparación con las otras posibilidades.

Asimismo, cuando hay alquenos disustituídos, estos pueden estar presentes en forma *E* o *Z* o como mezclas de ambas en cualquier proporción.

Además, los compuestos de fórmula (I) pueden estar en equilibrio con formas tautoméricas alternativas. Por ejemplo, un compuesto de fórmula (I-i), es decir, un compuesto de fórmula (I) en la que R^2 es hidrógeno y G es hidrógeno, puede dibujarse en al menos tres formas tautoméricas:



(I-i)

Se apreciará que todas las formas tautoméricas (tautómeros individuales o mezclas de estos), mezclas racémicas e isómeros individuales están incluidos dentro del alcance de la presente invención.

Cada resto alquilo ya sea solo o como parte de un grupo más grande (tal como alcoxi, alquiltio, alcoxicarbonilo, alquilcarbonilo, alquilaminocarbonilo o dialquilaminocarbonilo, y otros) puede ser de cadena lineal o ramificada. Típicamente, el alquilo es, por ejemplo, metilo, etilo, *n*-propilo, isopropilo, *n*-butilo, *sec*-butilo, isobutilo, *terc*-butilo, *n*-pentilo, neopentilo o *n*-hexilo. Los grupos alquilo generalmente son grupos alquilo C₁-C₆ (excepto cuando ya se definieron más estrechamente), pero son preferiblemente grupos alquilo C₁-C₄ o grupos alquilo C₁-C₃, y, más preferiblemente, son grupos alquilo C₁-C₂ (tal como metilo).

Los restos alquenilo y alquinilo pueden estar en forma de cadenas lineales o ramificadas, y los restos alquenilo, cuando sea apropiado, pueden tener la configuración (*E*) o (*Z*). Los restos alquenilo o alquinilo son típicamente alquenilo C₂-C₄ o alquinilo C₂-C₄, más específicamente vinilo, alilo, etinilo, propargilo o prop-1-ino. Los restos alquenilo y alquinilo pueden contener uno o más enlaces dobles y/o triples en cualquier combinación; pero preferiblemente contienen solo un doble enlace (para alquenilo) o solo un triple enlace (para alquinilo).

Preferiblemente, el término cicloalquilo se refiere a ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo o ciclohexilo.

En el contexto de la presente memoria descriptiva, el término "arilo" preferiblemente significa fenilo. El término "heteroarilo", como se usa en el presente documento, significa un sistema de anillo aromático que contiene al menos un heteroátomo en el anillo y consiste en un anillo individual. Preferiblemente, los anillos individuales contendrán 1, 2 o 3 heteroátomos en el anillo, seleccionados independientemente de nitrógeno, oxígeno y azufre. Típicamente, "heteroarilo" es furilo, tienilo, pirrolilo, pirazolilo, imidazolilo, 1,2,3-triazolilo, 1,2,4-triazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, 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, pirimidinilo, piridazinilo, pirazinilo, 1,2,3-triazinilo, 1,2,4-triazinilo o 1,3,5-triazinilo.

Los grupos heterociclilo y anillos heterocíclicos (en solitario o como parte de un grupo más grande, tal como heterociclilalquil-) son sistemas de anillo que contienen al menos un heteroátomo y pueden estar en forma mono- o bicíclica. Preferiblemente, los grupos heterociclilo contendrán hasta dos heteroátomos que se elegirán de nitrógeno, oxígeno y azufre. Los ejemplos de grupos heterocíclicos incluyen oxetanilo, tietanilo, azetidino y 7-oxa-biciclo[2.2.1]hept-2-ilo. Los grupos heterociclilo que contienen un solo átomo de oxígeno como heteroátomo son los más preferidos. Los grupos heterociclilo son preferentemente anillos monocíclicos de 3 a 8 miembros, más preferentemente de 3 a 6 miembros, y pueden estar completa o parcialmente saturados.

Halógeno (o halo) abarca flúor, cloro, bromo o yodo. Lo mismo se aplica correspondientemente a halógeno en el contexto de otras definiciones, tales como haloalquilo o haloftenilo.

Grupos haloalquilo que tienen una longitud de cadena de 1 a 6 átomos de carbono son, por ejemplo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, clorometilo, diclorometilo, triclorometilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 2-fluoroetilo, 2-cloroetilo, pentafluoroetilo, 1,1-difluoro-2,2,2-tricloroetilo, 2,2,3,3-tetrafluoroetilo y 2,2,2-tricloroetilo, heptafluoro-*n*-propilo y perfluoro-*n*-hexilo.

Grupos alcoxi tienen preferiblemente una longitud de cadena de 1 a 6 átomos de carbono. Alcoxi es, por ejemplo, metoxi, etoxi, propoxi, isopropoxi, *n*-butoxi, isobutoxi, *sec*-butoxi o *terc*-butoxi o un isómero pentiloxi o hexiloxi, preferiblemente metoxi y etoxi. También debe apreciarse que pueden estar presentes dos sustituyentes alcoxi en el mismo átomo de carbono.

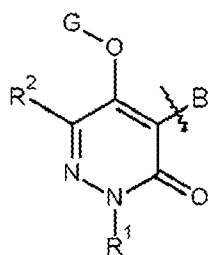
Haloalcoxi es, por ejemplo, a fluorometoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, 2,2,2-trifluoroetoxi, 1,1,2,2-tetrafluoroetoxi, 2-fluoroetoxi, 2-cloroetoxi, 2,2-difluoroetoxi o 2,2,2-tricloroetoxi, preferiblemente difluorometoxi, 2-cloroetoxi o trifluorometoxi.

Alquil C₁-C₆-S- (alquiltio) es, por ejemplo, metiltio, etiltio, propiltio, isopropiltio, *n*-butiltio, isobutiltio, *sec*-butiltio o *terc*-butiltio, preferiblemente metiltio o etiltio.

Alquil C₁-C₆-S(O)- (alquilsulfinilo) es, por ejemplo, metilsulfinilo, etilsulfinilo, propilsulfinilo, isopropilsulfinilo, *n*-butilsulfinilo, isobutilsulfinilo, *sec*-butilsulfinilo o *terc*-butilsulfinilo, preferiblemente metilsulfinilo o etilsulfinilo.

Alquil C₁-C₆-S(O)₂- (alquilsulfonilo) es, por ejemplo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, propilsulfonilo, isopropilsulfonilo, *n*-butilsulfonilo, isobutilsulfonilo, *sec*-butilsulfonilo o *terc*-butilsulfonilo, preferiblemente metilsulfonilo o etilsulfonilo.

El grupo Q



(Q) en el presente documento como el resto de piridazinodiona/piridazinona, en donde B indica el punto de unión al resto de la molécula (es decir, al resto fenil-W-D sustituido opcionalmente).

La presente invención también incluye sales agronómicamente aceptables que los compuestos de fórmula (I) puedan formar con aminas (por ejemplo, amoníaco, dimetilamina y trietilamina), bases de metales alcalinos y metales alcalinotérreos o bases de amonio cuaternario. Entre los hidróxidos, óxidos, alcóxidos e hidrógeno-carbonatos y carbonatos de metales alcalinos y alcalinotérreos utilizados como formadores de sales, se pone énfasis en los hidróxidos, alcóxidos, óxidos y carbonatos de litio, sodio, potasio, magnesio y calcio, pero especialmente los de sodio, magnesio y calcio. También se puede utilizar la sal de trimetilsulfonio correspondiente. Los compuestos de fórmula (I) de acuerdo con la invención también incluyen hidratos que pueden formarse durante la formación de sal.

Los valores preferidos de R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁴ᵃ, R⁵ᵃ, R⁶, R⁸, R⁹, R¹⁰, R¹¹, R¹², R¹³, R¹⁴, R¹⁵, R¹⁶, W, D, Dp, G, X, Y y m son como se exponen a continuación, y un compuesto de la fórmula (I) según la invención puede comprender cualquier combinación de dichos valores. Los expertos en la materia apreciarán que los valores para cualquier conjunto especificado de realizaciones pueden combinarse con valores para cualquier otro conjunto de realizaciones donde dichas combinaciones no son mutuamente excluyentes.

Preferiblemente R¹ se selecciona a partir del grupo constituido por metilo, etilo, propilo (en particular n- o c-propilo), propargilo o haloalquilo C₁. Más preferiblemente, R¹ es metilo, etilo, ciclopropilo, propargilo o fluoroalquilo C₁. Más preferiblemente aún, R¹ es metilo, etilo, ciclopropilo o propargilo. Más preferiblemente, R¹ es metilo.

Preferiblemente R² se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, alcoxi C₁-C₃-alquil C₁-C₃-, cicloalquilo C₃-C₆, alquenilo C₂-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆ y haloalquinilo C₂-C₆. Más preferiblemente R² se selecciona del grupo que consiste en cloro, flúor, metilo, etilo, ciclopropilo, trifluorometilo y metoximetilo, más preferiblemente aún cloro, ciclopropilo, trifluorometilo o metilo, lo más preferiblemente cloro o metilo. En un conjunto de realizaciones de la presente invención, R² es hidrógeno. En un conjunto adicional de realizaciones, R² es ciclopropilo, en un tercer conjunto de realizaciones, R² es metilo, en un cuarto conjunto de realizaciones, R² es trifluorometilo, y en un quinto conjunto de realizaciones R² es cloro.

Como se describe en el presente documento, G puede ser hidrógeno o -C(O)-R³, y R³ se selecciona del grupo que consiste en alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, alquil C₁-C₆-S-, alcoxi C₁-C₆, -NR⁴R⁵ y fenilo opcionalmente sustituido con uno o más R⁶.

Como se define en este documento, R⁴ y R⁵ se seleccionan independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆ y cicloalquilo C₃-C₆, o pueden formar juntos un anillo de morfolinilo. En el contexto del sustituyente G (y así también R³) R⁴ y R⁵ se seleccionan preferentemente cada uno independientemente del grupo que consiste en metilo, etilo, propilo, metoxi, etoxi y propoxi, y se pueden denominar R³⁴ y R³⁵, respectivamente. En el contexto de otros sustituyentes (por ejemplo R², R⁸), R⁴ y R⁵ son preferentemente cada uno independientemente hidrógeno, alquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃ o cicloalquilo C₃-C₆, y se pueden denominar R⁸⁴ y R⁸⁵ respectivamente. Donde más de un R⁴ está comprendido en un resto más grande, por ejemplo en el grupo -NR⁴C(O)NR⁴R⁵, el experto apreciará que cada R⁴ es independiente, y así en dicho resto los dos grupos R⁴ pueden ser iguales o pueden ser diferentes entre sí.

R⁶ se selecciona del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃ y haloalcoxi C₁-C₃. Preferiblemente, R⁶ se selecciona del grupo que consiste en halógeno, alquilo C₁-C₃ y haloalquilo C₁-C₃.

Preferiblemente R³ es alquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₃, alquinilo C₂-C₃, alcoxi C₁-C₄, -NR⁴R⁵ en donde R⁴ y R⁵ forman juntos un anillo de morfolinilo, o fenilo. Más preferiblemente R³ es isopropilo, t-butilo, metilo, etilo, propargilo, metoxi, etoxi o *terc*-butoxi. Más preferiblemente R³ es isopropilo, t-butilo, metilo, etilo, propargilo o metoxi.

En un conjunto de realizaciones, G es hidrógeno o -C(O)-R³, en donde R³ es alquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₃, alquinilo C₂-C₃ o alcoxi C₁-C₄. En un conjunto adicional de realizaciones G es hidrógeno o -C(O)-R³, en donde R³ es isopropilo, t-butilo, metilo, etilo, propargilo o metoxi. Sin embargo, es particularmente preferible que G sea hidrógeno, o -C(O)-R³ en donde R³ es isopropilo.

Si Y es ciclopropilo, X es preferiblemente hidrógeno, ciclopropilo, halógeno o haloalquilo C₁, más preferiblemente hidrógeno, flúor, cloro, bromo o fluoroalquilo C₁ y más preferiblemente aún, hidrógeno, flúor, cloro o trifluorometilo. Más preferiblemente, cuando Y es ciclopropilo, X es flúor. En un conjunto de realizaciones es preferible que X está en *orto* (posición 6) con respecto al resto de piridazina/piridazina-diona (grupo Q). Es particularmente preferible que X sea flúor, cloro o haloalquilo C₁ (en particular fluoroalquilo C₁) y esté en *orto* (posición 6) con respecto al resto de piridazina/piridazina-diona (grupo Q). Más preferiblemente, X es flúor y está en *orto* (posición 6) con respecto al resto de piridazina/piridazina-diona (grupo Q).

Si X es ciclopropilo, Y es preferiblemente hidrógeno, alquilo C₁-C₃, ciclopropilo, haloalquilo C₁-C₃ o halógeno, y más preferiblemente Y es hidrógeno, cloro, flúor o bromo en dichas realizaciones. Más preferiblemente, cuando X es ciclopropilo, Y es cloro.

En un conjunto de realizaciones es preferible que Y esté en *orto* (posición 3) con respecto al resto -W-D. En un conjunto adicional de realizaciones, Y está *para* con respecto al resto de piridazina/piridazina-diona (grupo Q).

Es particularmente preferible que Y esté en *orto* (posición 3) con respecto al resto -W-D y sea halógeno, en particular cloro o flúor; más preferiblemente cloro.

Como se describe en el presente documento, D es un anillo de fenilo sustituido o no sustituido (Dp), o es un anillo de heteroarilo monocíclico de 5 o 6 miembros sustituido o no sustituido que contiene 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados independientemente de oxígeno, nitrógeno y azufre, y en donde cuando D es un anillo de heteroarilo sustituido o un anillo de fenilo sustituido, está sustituido en al menos un átomo de carbono del anillo con R⁸ y/o, en caso de un anillo de heteroarilo, en un átomo de nitrógeno del anillo con R⁹. Donde D es un anillo de heteroarilo monocíclico de 5 o 6 miembros sustituido o no sustituido, es preferiblemente un anillo de furilo, tienilo, pirrolilo, pirazolilo, imidazolilo, 1,2,3-triazolilo, 1,2,4-triazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, 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, piridonilo, pirimidinilo, piridazinilo, pirazinilo, 1,2,3-triazinilo, 1,2,4-triazinilo, o 1,3,5-triazinilo sustituido (como se describe en el presente documento) o no sustituido.

En dichas realizaciones, D es preferentemente un anillo de piridilo, pirazolilo, tiazolilo, pirimidinilo, tienilo, triazolilo u oxadiazolilo, y más preferentemente un piridilo, sustituido (como se describe en el presente documento) o no sustituido.

En un conjunto de realizaciones, D es un anillo de pirazolilo, imidazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, piridilo, piridonilo, pirimidinilo, piridazinilo o pirazinilo sustituido (como se describe en el presente documento) o no sustituido.

En un conjunto adicional de dichas realizaciones, D es un anillo de oxazolilo, tiazolilo o piridilo sustituido (como se describe en el presente documento) o no sustituido. En ciertas realizaciones, D es un anillo de piridilo sustituido o no sustituido, o de tiazolilo sustituido o no sustituido.

La sustitución de D por R⁸ dependerá de la presencia o ausencia de ciclopropilo en la posición X y/o Y. Sin embargo, en general, donde D es un anillo de heteroarilo sustituido de 5 o 6 miembros, está sustituido preferentemente por 1 o 2 R⁸ y/o 1 R⁹, más preferentemente por 1 o 2 R⁸. Donde D es un anillo de heteroarilo sustituido de 5 miembros, está lo más preferentemente sustituido con 1 R⁸. Donde D es un anillo de fenilo sustituido, está sustituido preferentemente por 1 o 2 R⁸, más preferentemente por 1 R⁸.

Donde al menos uno de X y Y es ciclopropilo, y D está sustituido, cada R⁸ se puede seleccionar independientemente de hidrógeno, oxígeno, hidroxilo, halógeno, ciano, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alcoxi C₁-C₃-alquilo C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃-alquil C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃-alcoxi C₁-C₃-alquil C₁-C₃, alquenilo C₂-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, hidroxialquil C₁-C₆, alquil C₁-C₆-carbonil-, haloalquil C₁-C₆-carbonil-, cicloalquil C₃-C₆-carbonil-, -S(O)_m-haloalquilo C₁-C₆, -S(O)_m-cicloalquilo C₃-C₆, -O-S(O)₂-alquilo C₁-C₃, -alquil C₁-C₃-S(O)_m-alquilo C₁-C₆, -alquil C₁-C₃-S(O)_m-haloalquilo C₁-C₆, -alquil C₁-C₃-S(O)_m-cicloalquilo C₃-C₆, cianoalquil C₁-C₆, NR⁴R⁵, -C(S)NR⁴R⁵, -S(O)₂NHC(O)alquilo C₁-C₃, -S(O)₂NR⁴R⁵, -C(O)OH, -C(O)Oalquilo C₁-C₆, -C(O)NHS-(O)₂-alquilo C₁-C₆, -C(O)NR⁴R⁵, -NR⁴C(O)NR⁴R⁵, alquil C₁-C₆-carbonil(alquil C₁-C₆)amino-, haloalquil C₁-C₆-carbonilamino-, haloalquil C₁-C₆-carbonil(alquil C₁-C₆)amino-, -NR⁴C(O)NR⁴R⁵, alquil C₁-C₆-sulfonilamino-, alquil C₁-C₆-sulfonil(alquil C₁-C₆)amino-, haloalquil C₁-C₆-sulfonilamino-, haloalquil C₁-C₆-sulfonil(alquil C₁-C₆)amino-, cicloalquil C₃-C₆-sulfonilamino-, cicloalquil C₃-C₆-sulfonil(alquil C₁-C₆)amino-, hidroxiamino-, hidroxi(alquil C₁-C₆)amino, alcoxi C₁-C₆-amino, alcoxi C₁-C₆(alquil C₁-C₆)amino, haloalcoxi C₁-C₆-amino, haloalcoxi C₁-C₆(alquil C₁-C₆)amino; o un sistema de anillos seleccionado del grupo que consiste en un anillo de fenilo, un anillo de heteroarilo de 5-6 miembros y un anillo de heterociclilo de 3-6 miembros, en donde dicho sistema de anillos está sustituido por 0 a 5 R¹⁶;

m es un número entero de 0, 1 o 2 (preferentemente 0 o 2); y cada R⁹ es independientemente hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₃-alquilo C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃-alquil C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃-alcoxi C₁-C₃-alquil C₁-C₃, hidroxialquil C₁-C₆, -alquil C₁-C₃-S(O)_m-alquilo C₁-C₆, -alquil C₁-C₃-S(O)_m-haloalquilo C₁-C₆, -alquil C₁-C₃-S(O)_m-cicloalquilo C₃-C₆, cianoalquil C₁-C₆, o un sistema de anillos

seleccionado del grupo que consiste en: un anillo de fenilo, un anillo de heteroarilo de 5-6 miembros y un anillo de heterociclilo de 3-6 miembros, en donde dicho sistema de anillos está sustituido por 0 a 5 R¹⁶;

cada R¹⁶ es independientemente halógeno, ciano, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆ o haloalcoxi C₁-C₆.

Si tanto X como Y son distintos de ciclopropilo, y D es un anillo de fenilo, D se sustituirá por al menos un R⁸ seleccionado del grupo que consiste en haloalquil C₁-C₆-carbonil-, cicloalquil C₃-C₆-carbonil-, -S(O)_m-haloalquilo C₁-C₆, -S(O)_m-cicloalquilo C₃-C₆, -O-S(O)₂-alquilo C₁-C₃, -alquil C₁-C₃-S(O)_m-alquilo C₁-C₆, -alquil C₁-C₃-S(O)_m-haloalquilo C₁-C₆, -alquil C₁-C₃-S(O)_m-cicloalquilo C₃-C₆, cianoalquil C₁-C₆-, -NR^{4a}R^{5a}-, -C(S)NR⁴R⁵-, -S(O)₂NHC(O)-alquilo C₁-C₃, -S(O)₂NR⁴R⁵-, -C(O)OH-, -C(O)O-alquilo C₁-C₆-, -C(O)NHS-(O)₂-alquilo C₁-C₆-, -C(O)NR⁴R⁵-, -NR⁴C(O)NR⁴R⁵-, alquil C₁-C₆-carbonil(alquil C₁-C₆)amino-, haloalquil C₁-C₆-carbonilamino-, haloalquil C₁-C₆-carbonil(alquil C₁-C₆)amino-, alquil C₁-C₆-sulfonilamino-, alquil C₁-C₆-sulfonil(alquil C₁-C₆)amino-, haloalquil C₁-C₆-sulfonilamino-, haloalquil C₁-C₆-sulfonil(alquil C₁-C₆)amino-, cicloalquil C₃-C₆-sulfonilamino-, cicloalquil C₃-C₆-sulfonil(alquil C₁-C₆)amino-, hidroxiamino-, hidroxi(alquil C₁-C₆)amino, alcoxi C₁-C₆-amino, alcoxi C₁-C₆(alquil C₁-C₆)amino, haloalcoxi C₁-C₆-amino, haloalcoxi C₁-C₆(alquil C₁-C₆)amino; o un sistema de anillos seleccionado del grupo que consiste en un anillo de fenilo, un anillo de heteroarilo de 5-6 miembros y un anillo de heterociclilo de 3-6 miembros, en donde dicho sistema de anillos está sustituido por 0 a 5 R¹⁶; en donde m, R⁴, R⁵ y R¹⁶ son como se definen en el presente documento.

Como se define en el presente documento, en el contexto en el que tanto X como Y son distintos de ciclopropilo, cada R^{4a} y R^{5a} se selecciona independientemente del grupo que consiste en alcoxi C₁-C₆ y cicloalquilo C₃-C₆, o R⁴ y R⁵ juntos pueden formar un anillo morfolinilo.

Cualquier sustituyente R⁸ adicional se puede seleccionar del grupo que consiste en oxígeno, hidroxilo, halógeno, ciano, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alcoxi C₁-C₃-alquilo C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃-alquil C₁-C₃-, alcoxi C₁-C₃-alcoxi C₁-C₃-alquil C₁-C₃-, alquenilo C₂-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, hidroxialquil C₁-C₆-, alquil C₁-C₆-carbonil-, haloalquil C₁-C₆-carbonil-, cicloalquil C₃-C₆-carbonil-, -S(O)_m-haloalquilo C₁-C₆-, -S(O)_m-cicloalquilo C₃-C₆-, -O-S(O)₂-alquilo C₁-C₃-, -alquil C₁-C₃-S(O)_m-alquilo C₁-C₆-, -alquil C₁-C₃-S(O)_m-haloalquilo C₁-C₆-, -alquil C₁-C₃-S(O)_m-cicloalquilo C₃-C₆-, cianoalquil C₁-C₆-, NR⁴R⁵-, -C(S)NR⁴R⁵-, -S(O)₂NHC(O)alquilo C₁-C₃-, -S(O)₂NR⁴R⁵-, -C(O)OH-, -C(O)Oalquilo C₁-C₆-, -C(O)NHS-(O)₂-alquilo C₁-C₆-, -C(O)NR⁴R⁵-, -NR⁴C(O)NR⁴R⁵-, alquil C₁-C₆-carbonil(alquil C₁-C₆)amino-, haloalquil C₁-C₆-carbonilamino-, haloalquil C₁-C₆-carbonil(alquil C₁-C₆)amino-, -NR⁴C(O)NR⁴R⁵-, alquil C₁-C₆-sulfonilamino-, alquil C₁-C₆-sulfonil(alquil C₁-C₆)amino-, haloalquil C₁-C₆-sulfonilamino-, haloalquil C₁-C₆-sulfonil(alquil C₁-C₆)amino-, cicloalquil C₃-C₆-sulfonilamino-, cicloalquil C₃-C₆-sulfonil(alquil C₁-C₆)amino-, hidroxiamino-, hidroxi(alquil C₁-C₆)amino, alcoxi C₁-C₆-amino, alcoxi C₁-C₆(alquil C₁-C₆)amino, haloalcoxi C₁-C₆-amino, haloalcoxi C₁-C₆(alquil C₁-C₆)amino; o un sistema de anillos seleccionado del grupo que consiste en un anillo de fenilo, un anillo de heteroarilo de 5-6 miembros y un anillo de heterociclilo de 3-6 miembros, en donde dicho sistema de anillos está sustituido por 0 a 5 R¹⁶; en donde m, R⁴, R⁵ y R¹⁶ son como se definen en el presente documento.

Si tanto X como Y son distintos de ciclopropilo y D es un anillo de heteroarilo monocíclico, D se sustituirá en un carbono del anillo por al menos un R⁸ seleccionado del grupo que consiste en haloalquil C₁-C₆-carbonil-, cicloalquil C₃-C₆-carbonil-, -S(O)_m-haloalquilo C₁-C₆-, -S(O)_m-cicloalquilo C₃-C₆-, -O-S(O)₂-alquilo C₁-C₃-, -alquil C₁-C₃-S(O)_m-alquilo C₁-C₆-, -alquil C₁-C₃-S(O)_m-haloalquilo C₁-C₆-, -alquil C₁-C₃-S(O)_m-cicloalquilo C₃-C₆-, cianoalquil C₁-C₆-, NR^{4a}R^{5a}-, -C(S)NR⁴R⁵-, -S(O)₂NHC(O)alquilo C₁-C₃-, -S(O)₂NR⁴R⁵-, -C(O)OH-, -C(O)O-alquilo C₁-C₆-, -C(O)NHS-(O)₂-alquilo C₁-C₆-, -C(O)NR⁴R⁵-, -NR⁴C(O)NR⁴R⁵-, alquil C₁-C₆-carbonil(alquil C₁-C₆)amino-, haloalquil C₁-C₆-carbonilamino-, haloalquil C₁-C₆-carbonil(alquil C₁-C₆)amino-, alquil C₁-C₆-sulfonilamino-, alquil C₁-C₆-sulfonil(alquil C₁-C₆)amino-, haloalquil C₁-C₆-sulfonilamino-, haloalquil C₁-C₆-sulfonil(alquil C₁-C₆)amino-, cicloalquil C₃-C₆-sulfonilamino-, cicloalquil C₃-C₆-sulfonil(alquil C₁-C₆)amino-, hidroxiamino-, hidroxi(alquil C₁-C₆)amino, alcoxi C₁-C₆-amino, alcoxi C₁-C₆(alquil C₁-C₆)amino, haloalcoxi C₁-C₆-amino, haloalcoxi C₁-C₆(alquil C₁-C₆)amino; y un sistema de anillos seleccionado del grupo que consiste en un anillo de fenilo, un anillo de heteroarilo de 5-6 miembros y un anillo de heterociclilo de 3-6 miembros, en donde dicho sistema de anillos está sustituido por 0 a 5 R¹⁶; y/o D se sustituirá en un nitrógeno del anillo por al menos un R⁹ seleccionado del grupo que consiste en alquilo C₅-C₆, haloalquilo C₅-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₃-alquil C₃-, alcoxi C₃-alquil C₁-C₂-, haloalcoxi C₁-C₃-alquil C₁-C₃-, alcoxi C₁-C₃-alcoxi C₁-C₃-alquil C₁-C₃-, hidroxialquil C₁-C₆-, -alquil C₁-C₃-S(O)_m-alquilo C₁-C₆-, -alquil C₁-C₃-S(O)_m-haloalquilo C₁-C₆-, -alquil C₁-C₃-S(O)_m-cicloalquilo C₃-C₆-, cianoalquil C₁-C₆- y un sistema de anillos seleccionado del grupo que consiste en: un anillo de fenilo, un anillo de heteroarilo de 5-6 miembros y un anillo de heterociclilo de 3-6 miembros, en donde dicho sistema de anillos está sustituido por 0 a 5 R¹⁶; en donde m, R⁴, R⁵, R^{4a}, R^{5a} y R¹⁶ son como se definen en el presente documento.

En dichas realizaciones donde tanto X como Y son distintos de ciclopropilo, cualquier sustituyente R⁸ del carbono del anillo adicional se puede seleccionar del grupo que consiste en el grupo que consiste en oxígeno, hidroxilo, halógeno, ciano, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alcoxi C₁-C₃-alquilo C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃-alquil C₁-C₃-, alcoxi C₁-C₃-alcoxi C₁-C₃-alquil C₁-C₃-, alquenilo C₂-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, hidroxialquil C₁-C₆-, alquil C₁-C₆-carbonil-, haloalquil C₁-C₆-carbonil-, cicloalquil C₃-C₆-carbonil-, -S(O)_m-haloalquilo C₁-C₆-, -S(O)_m-cicloalquilo C₃-C₆-, -O-S(O)₂-alquilo C₁-C₃-, -alquil C₁-C₃-S(O)_m-alquilo C₁-C₆-, -alquil C₁-C₃-S(O)_m-haloalquilo C₁-C₆-, -alquil C₁-C₃-S(O)_m-cicloalquilo C₃-C₆-, cianoalquil C₁-C₆-, NR⁴R⁵-, -C(S)NR⁴R⁵-, -S(O)₂NHC(O)alquilo C₁-C₃-, -S(O)₂NR⁴R⁵-, -C(O)OH-, -C(O)Oalquilo C₁-C₆-, -C(O)NHS-(O)₂-alquilo C₁-C₆-,

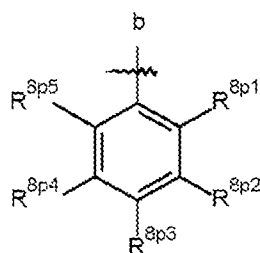
-C(O)NR⁴R⁵, -NR⁴C(O)NR⁴R⁵, alquil C₁-C₆-carbonil(alquil C₁-C₆)amino-, haloalquil C₁-C₆-carbonilamino-, haloalquil C₁-C₆-carbonil(alquil C₁-C₆)amino-, alquil C₁-C₆-sulfonilamino-, alquil C₁-C₆-sulfonil(alquil C₁-C₆)amino-, haloalquil C₁-C₆-sulfonilamino-, haloalquil C₁-C₆-sulfonil(alquil C₁-C₆)amino-, cicloalquil C₃-C₆-sulfonilamino-, cicloalquil C₃-C₆-sulfonil(alquil C₁-C₆)amino-, hidroxiamino-, hidroxi(alquil C₁-C₆)amino, alcoxi C₁-C₆-amino, alcoxi C₁-C₆(alquil C₁-C₆)amino, haloalcoxi C₁-C₆-amino, haloalcoxi C₁-C₆(alquil C₁-C₆)amino; o un sistema de anillos seleccionado del grupo que consiste: en un anillo de fenilo, un anillo de heteroarilo de 5-6 miembros y un anillo de heterociclilo de 3-6 miembros, en donde dicho sistema de anillos está sustituido por 0 a 5 R¹⁶; en donde m, R⁴, R⁵ y R¹⁶ son como se definen en el presente documento, y/o cualquier sustituyente R⁹ del nitrógeno del anillo adicional se puede seleccionar del grupo que consiste en alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₃-alquilo C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃-alquil C₁-C₃-, alcoxi C₁-C₃-alcoxi C₁-C₃-alquil C₁-C₃-, hidroxialquil C₁-C₆-, -alquil C₁-C₃-S(O)_m-alquilo C₁-C₆-, -alquil C₁-C₃-S(O)_m-haloalquilo C₁-C₆-, -alquil C₁-C₃-S(O)_m-cicloalquilo C₃-C₆-, cianoalquil C₁-C₆- y un sistema de anillos seleccionado del grupo que consiste en: un anillo de fenilo, un anillo de heteroarilo de 5-6 miembros y un anillo de heterociclilo de 3-6 miembros, en donde dicho sistema de anillos está sustituido por 0 a 5 R¹⁶; en donde m, R⁴, R⁵ y R¹⁶ son como se definen en el presente documento.

En las realizaciones en las que al menos uno de X e Y es ciclopropilo, cada R⁸ es preferentemente independientemente oxo, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, halógeno, ciano, amino, -NHC(O)CH₃, hidroxilo, alcoxi C₁-C₄ o alquiltio C₁-C₄. Más preferentemente, cada R⁸ es independientemente oxo, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, halógeno, ciano, hidroxilo, alcoxi C₁-C₄ o alquiltio C₁-C₄, lo más preferentemente cada R⁸ es independientemente halógeno o haloalquilo C₁-C₄.

En las realizaciones en las que al menos uno de X e Y es ciclopropilo, cada R⁹ es preferentemente independientemente alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, hidroxilo, alcoxi C₁-C₄, o alquiltio C₁-C₄.

En realizaciones particulares en las que al menos uno de X e Y es ciclopropilo y D es un anillo de heteroarilo monocíclico de 5 o 6 miembros sustituido o no sustituir como se ha descrito anteriormente, D se selecciona del grupo que consiste en 4-cloro-3-piridilo, 4-trifluorometilpiridilo, 3-piridilo, y 2-cloro-tiazo-5-ilo, 2-cloro-3-piridilo, 3-cloro-4-piridilo, 1-metil-3-(trifluorometil)-pirazol-4-ilo, tiazol-2-ilo, tiazol-5-ilo, pirimidin-5-ilo, 4-(*tert*-butoxi)fenilo, 2-cloro-4-piridilo, 2-metil-4-piridilo, 2-trifluorometil-4-piridilo, 4-piridilo, 2-amino-4-piridilo, tiofen-3-ilo, 1-metil-pirazol-4-ilo, 2-metil-tiazol-4-ilo, 5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-ilo, 5-metil-3-piridilo, 5-metil-2-piridilo, 6-metil-2-piridilo, 3-metil-2-piridilo, 6-choro-3-piridilo, 3-trifluorometil-3-piridilo, 4-metil-2-piridilo, 2-acetamidotiazol-5-ilo, 2-fluoro-4-piridilo y 2-trifluorometil-3-piridilo. En un subconjunto de estas realizaciones D se selecciona del grupo que consiste en 4-cloro-3-piridilo, 4-trifluorometilpiridilo, 3-piridilo, y 2-cloro-tiazo-5-ilo, 2-cloro-3-piridilo, 3-cloro-4-piridilo, 1-metil-3-(trifluorometil)-pirazol-4-ilo, tiazol-2-ilo, tiazol-5-ilo, pirimidin-5-ilo, 4-(*tert*-butoxi)fenilo, 2-cloro-4-piridilo, 2-metil-4-piridilo, 2-trifluorometil-4-piridilo, 4-piridilo, tiofen-3-ilo, 5-metil-3-piridilo, 5-metil-2-piridilo, 6-metil-2-piridilo, 3-trifluorometil-3-piridilo, 2-fluoro-4-piridilo, y 2-trifluorometil-3-piridilo. En un subconjunto adicional de estas realizaciones, D se selecciona del grupo que consiste en 4-cloro-3-piridilo, 4-trifluorometilpiridilo, 3-piridilo, 2-fluoro-4-piridilo y 2-cloro-tiazo-5-ilo (preferiblemente 2-fluoro-4-piridilo).

Si D es un anillo de fenilo D_p, y está sustituido, se puede sustituir por 1 a 5 R⁸ y así se puede representar por la siguiente estructura:



(D_p), en donde al menos un R^{8p1}, R^{8p2}, R^{8p3}, R^{8p4} y R^{8p5} es distinto de hidrógeno. El experto apreciará si al menos uno de R^{8p1}, R^{8p2}, R^{8p3}, R^{8p4} y R^{8p5} no es hidrógeno, cualquier posición restante en el anillo de fenilo puede estar sin sustituir, o, alternatively, llevar un sustituyente R⁸ adicional en la posición en el anillo de fenilo que se indica por el número p en superíndice. Si D_p está sin sustituir, R^{8p1}, R^{8p2}, R^{8p3}, R^{8p4} y R^{8p5} estarán ausentes.

Como se ha establecido anteriormente, la sustitución de D por R⁸ dependerá de la presencia o ausencia de ciclopropilo en la posición X y/o Y. Así, en D_p, donde al menos uno de X y Y es ciclopropilo, se prefiere que uno o más de R^{8p1}, R^{8p2}, R^{8p3}, R^{8p4} y R^{8p5} se seleccione independientemente del grupo que consiste en ciano, amino, dialquil C₁-C₃-amino, hidroxilo, alquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃ y halógeno, y b es el punto de unión al resto de la molécula.

En dicho conjunto de realizaciones, uno o más de R^{8p1}, R^{8p2}, R^{8p3}, R^{8p4} y R^{8p5} se selecciona cada uno independientemente de ciano, alquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃ o halógeno. Preferentemente uno o más de R^{8p1}, R^{8p2}, R^{8p3}, R^{8p4} y R^{8p5} se selecciona independientemente de, ciano, halógeno (en particular cloro o flúor), metilo, metoxi y trifluorometilo.

En otro conjunto más de realizaciones, cada uno de R^{8p1} , R^{8p2} , R^{8p4} y R^{8p5} están ausentes y R^{8p3} es ciano, alquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃ o halógeno. Preferiblemente, en este conjunto de realizaciones, R^{8p3} es halógeno, más preferiblemente cloro.

En todavía otro conjunto de realizaciones, cada uno de R^{8p1} , R^{8p4} y R^{8p5} están ausentes, y R^{8p2} y R^{8p3} se seleccionan cada uno independientemente de ciano, alquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃ o halógeno. En este conjunto de realizaciones, se prefiere particularmente que R^{8p2} y R^{8p3} sean, cada uno independientemente, halógeno, y más preferido que R^{8p2} y R^{8p3} sean ambos cloro.

En un conjunto particularmente preferido de realizaciones donde al menos un de X y/o Y es ciclopropilo, D es un anillo de fenilo sin sustituir.

En realizaciones adicionales, en el conjunto particularmente preferido de realizaciones donde al menos uno de X y/o Y es ciclopropilo, D se selecciona del grupo que consiste en 4-cloro-fenilo, 4-trifluorometil-fenilo, 4-cianofenilo, 4-fluoro-fenilo, 3,4-di-fluoro-fenilo, 2-trifluorometilfenilo y 4-tolilo.

W actúa como un grupo conector, que une el anillo D al resto de la molécula (es decir, al grupo fenil-piridazinona/fenil-piridazina diona). Los compuestos de fórmula (I) en donde el conector es W1 son herbicidas, mientras que los compuestos de fórmula (I) en donde el conector es W2 pueden ser no solo herbicidas, sino también productos intermedios útiles en la producción de compuestos de fórmula (I) con conectores W1. Por tanto, en un conjunto de realizaciones, W es W1, mientras que en un segundo conjunto de realizaciones, W es W2. En un tercer conjunto de realizaciones, W es -C=C-.

Preferiblemente R^{10} , R^{11} , R^{12} y R^{13} se seleccionan cada uno independientemente de hidrógeno o alquilo C₁-C₃. En un conjunto de realizaciones R^{10} , R^{11} , R^{12} y R^{13} son todos hidrógeno.

Preferiblemente R^{14} y R^{15} se seleccionan cada uno independientemente de hidrógeno o alquilo C₁-C₃. En un conjunto de realizaciones R^{14} y R^{15} son los dos hidrógeno.

Ejemplos específicos de W incluyen -CH₂-CH₂- y -CH=CH-, *cis*



y *trans*



y -C=C-. En realizaciones más preferidas W es cualquiera de -CH₂-CH₂-, o -CH=CH- (en particular (*E*)-CH=CH-), más preferentemente todavía -CH₂-CH₂-.

En un conjunto preferido de realizaciones (donde tanto X como Y son distintos de ciclopropilo) en un compuesto de la fórmula (I):

R^1 es metilo, etilo, ciclopropilo, propargilo o fluoroalquilo C₁;

R^2 es cloro, ciclopropilo, trifluorometilo o metilo;

G es hidrógeno o -C(O)- R^3 , en donde R^3 es isopropilo, t-butilo, metilo, etilo, propargilo, metoxi, etoxi o *terc*-butoxi;

X es flúor, cloro o haloalquilo C₁ y está en *orto* con respecto al resto de piridazinona/piridazina-diona;

Y es hidrógeno, cloro, flúor, o bromo y está en *orto* con respecto al resto -W-D;

D es un anillo de fenilo sustituido con al menos un R^8 seleccionado del grupo que consiste en haloalquil C₁-C₆-carbonil-, cicloalquil C₃-C₆-carbonil-, -S(O)_m-haloalquilo C₁-C₆-, -S(O)_m-cicloalquilo C₃-C₆-, -O-S(O)₂-alquilo C₁-C₃-, -alquil C₁-C₃-S(O)_m-alquilo C₁-C₆-, -alquil C₁-C₃-S(O)_m-haloalquilo C₁-C₆-, -alquil C₁-C₃-S(O)_m-cicloalquilo C₃-C₆-, cianoalquil C₁-C₆-, -NR^{4a}R^{5a}-, -C(S)NR⁴R⁵-, -S(O)₂NHC(O)alquilo C₁-C₃-, -S(O)₂NR⁴R⁵-, C(O)OH-, -C(O)O-alquilo C₁-C₆-, -C(O)NHS-(O)₂-alquilo C₁-C₆-, -C(O)NR⁴R⁵-, -NR⁴C(O)NR⁴R⁵-, alquil C₁-C₆-carbonil(alquil C₁-C₆)amino-, haloalquil C₁-C₆-carbonilamino-, haloalquil C₁-C₆-carbonil(alquil C₁-C₆)amino-,

alquil C₁-C₆-sulfonilamino-, alquil C₁-C₆-sulfonil(alquil C₁-C₆)amino-, haloalquil C₁-C₆-sulfonilamino-, haloalquil C₁-C₆-sulfonil(alquil C₁-C₆)amino-, cicloalquil C₃-C₆-sulfonilamino-, cicloalquil C₃-C₆-sulfonil(alquil C₁-C₆)amino-, hidroxiamino-, hidrox(alquil C₁-C₆)amino, alcoxi C₁-C₆-amino, alcoxi C₁-C₆(alquil C₁-C₆)amino, haloalcoxi C₁-C₆-amino y haloalcoxi C₁-C₆(alquil C₁-C₆)amino; o un sistema de anillos seleccionado del grupo que consiste: en un anillo de fenilo, un anillo de heteroarilo de 5-6 miembros y un anillo de heterociclilo de 3-6 miembros, en donde dicho sistema de anillos está sustituido por 0 a 5 R¹⁶; y cualquier sustituyente R⁸ adicional se puede seleccionar del grupo que consiste en hidroxilo, halógeno, ciano, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆ y alquinilo C₂-C₆; R⁴ y R⁵ son cada uno independientemente hidrógeno, alquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃ o cicloalquilo C₃-C₆;

m es un número entero de 0, 1 o 2 (preferiblemente 0 o 2);

cada R^{4a} y R^{5a} se selecciona independientemente del grupo que consiste en alcoxi C₁-C₆ y cicloalquilo C₃-C₆, o R^{4a} y R^{5a} juntos pueden formar un anillo morfolinilo; y

cada R¹⁶ es independientemente halógeno, ciano, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆ o haloalcoxi C₁-C₆;

W es W₁; y

R¹⁰, R¹¹, R¹² y R¹³ son todos hidrógeno.

En un conjunto más preferido de realizaciones (donde tanto X como Y son distintos de ciclopropilo) en un compuesto de la fórmula (I):

R¹ es metilo;

R² es metilo;

G es hidrógeno o -C(O)-R³, en donde R³ es isopropilo, t-butilo, metilo, etilo, propargilo, metoxi, etoxi o *terc*-butoxi;

X es flúor y está en *orto* con respecto al resto piridazinona/piridazina-diona;

Y es cloro y en *orto* con respecto al resto -W-D;

D es un anillo de fenilo sustituido con 1 o 2 R⁸, en donde al menos un R⁸ se selecciona del grupo que consiste en haloalquil C₁-C₆-carbonil-, cicloalquil C₃-C₆-carbonil-, -S(O)_m-haloalquilo C₁-C₆, -S(O)_m-cicloalquilo C₃-C₆, -O-S(O)₂-alquilo C₁-C₃, -alquil C₁-C₃-S(O)_m-alquilo C₁-C₆, -alquil C₁-C₃-S(O)_m-haloalquilo C₁-C₆, -alquil C₁-C₃-S(O)_m-cicloalquilo C₃-C₆, -S(O)₂NHC(O)alquilo C₁-C₃, -S(O)₂NR⁴R⁵, -C(O)OH, -C(O)Oalquilo C₁-C₆, -C(O)NHS-(O)₂-alquilo C₁-C₆, -C(O)NR⁴R⁵, -NR⁴C(O)NR⁴R⁵, alquil C₁-C₆-carbonil(alquil C₁-C₆)amino-, haloalquil C₁-C₆-carbonilamino- y haloalquil C₁-C₆-carbonil(alquil C₁-C₆)amino-; o un sistema de anillos seleccionado del grupo que consiste: en un anillo de fenilo, un anillo de heteroarilo de 5-6 miembros y un anillo de heterociclilo de 3-6 miembros, en donde dicho sistema de anillos está sustituido por 0 a 5 R¹⁶; y

Cualquier sustituyente R⁸ adicional se puede seleccionar del grupo que consiste en halógeno, alquilo C₁-C₆ y haloalquilo C₁-C₆;

R⁴ y R⁵ son cada uno independientemente hidrógeno, alquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃ o cicloalquilo C₃-C₆;

m es 0 o 2 (preferiblemente 0);

cada R¹⁶ es independientemente halógeno, ciano, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₃ o alcoxi C₁-C₄;

W es W₁; y

R¹⁰, R¹¹, R¹² y R¹³ son todos hidrógeno.

En un conjunto incluso más preferido de realizaciones (donde tanto X como Y son distintos de ciclopropilo) en un compuesto de la fórmula (I):

R¹ es metilo;

R² es metilo;

G es hidrógeno o -C(O)-R³, en donde R³ es isopropilo, t-butilo, metilo, etilo, propargilo o metoxi;

X es flúor y está en *orto* con respecto al resto piridazinona/piridazina-diona;

Y es cloro y en *orto* con respecto al resto -W-D;

D es un anillo de fenilo sustituido con un R⁸ seleccionado del grupo que consiste en -alquil C₁-C₃-S(O)_m-alquilo C₁-C₆, -S(O)₂NHC(O)alquilo C₁-C₃, -S(O)₂NR⁴R⁵, -C(O)OH, -C(O)O-alquil C₁-C₆ y -C(O)NR⁴R⁵; o un sistema de anillos seleccionado del grupo que consiste: en un anillo de fenilo, morfolinilo, tetrahidrofuranilo, furilo, tienilo, pirrolilo, pirazolilo, imidazolilo, 1,2,3-triazolilo, 1,2,4-triazolilo, tetrazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, 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, piridonilo, pirimidinilo, piridazinilo, pirazinilo, 1,2,3-triazinilo, 1,2,4-triazinilo o de 1,3,5-triazinilo, en donde dicho sistema de anillos está sustituido por 0 a 2 R¹⁶;

R⁴ y R⁵ son cada uno independientemente hidrógeno o alquilo C₁-C₃;

m es 0 o 2 (preferiblemente 0);

cada R¹⁶ es independientemente halógeno o alquilo C₁-C₄ (preferiblemente metilo);

W es W1; y

R¹⁰, R¹¹, R¹² y R¹³ son todos hidrógeno.

Aún en un conjunto incluso más preferido de realizaciones (donde tanto X como Y son distintos de ciclopropilo) en un compuesto de la fórmula (I);

R¹ es metilo;

R² es metilo;

G es hidrógeno o -C(O)-R³, en donde R³ es isopropilo;

X es flúor y está en *orto* con respecto al resto piridazinona/piridazina-diona;

Y es cloro y en *orto* con respecto al resto -W-D;

D es un anillo de fenilo sustituido con un R⁸ seleccionado del grupo que consiste en metilsulfanilmetilo, isopropilsulfanilmetilo, sulfamoilo, metilsulfamoilo y carbamoilo; o un sistema de anillos seleccionado del grupo que consiste: en un anillo de fenilo, morfolinilo, tetrahidrofuranilo, furilo, tienilo, pirrolilo, pirazolilo, 1,2,4-triazolilo, oxazolilo y tiazolilo, en donde dicho sistema de anillos está sustituido por 0 a 2 R¹⁶; cada R¹⁶ es metilo;

W es W1; y

R¹⁰, R¹¹, R¹² y R¹³ son todos hidrógeno.

En un conjunto preferido alternativo de realizaciones (donde tanto X como Y son distintos de ciclopropilo) en un compuesto de la fórmula (I);

R¹ es metilo, etilo, ciclopropilo, propargilo o fluoroalquilo C₁;

R² es cloro, ciclopropilo, trifluorometilo o metilo;

G es hidrógeno o -C(O)-R³, en donde R³ es isopropilo, t-butilo, metilo, etilo, propargilo, metoxi, etoxi o *terc*-butoxi;

X es flúor, cloro o haloalquilo C₁ y está en *orto* con respecto al resto de piridazinona/piridazina-diona;

Y es hidrógeno, cloro, flúor, o bromo y está en *orto* con respecto al resto -W-D;

D es un anillo de heteroarilo monocíclico de 5 o 6 miembros que contiene 1, 2 o 3 heteroátomos independientemente seleccionados de oxígeno, nitrógeno y azufre sustituido en un carbono del anillo por al menos un R⁸ seleccionado del grupo que consiste en haloalquil C₁-C₆-carbonil-, cicloalquil C₃-C₆-carbonil-, -S(O)_m-haloalquilo C₁-C₆, -S(O)_m-cicloalquilo C₃-C₆, -O-S(O)₂-alquilo C₁-C₃, -alquil C₁-C₃-S(O)_m-alquilo C₁-C₆, -alquil C₁-C₃-S(O)_m-haloalquilo C₁-C₆, -alquil C₁-C₃-S(O)_m-cicloalquilo C₃-C₆, cianoalquil C₁-C₆, NR^{4a}R^{5a}, -C(S)NR⁴R⁵, -S(O)₂NHC(O)alquilo C₁-C₃, -S(O)₂NR⁴R⁵, -C(O)OH, -C(O)O-alquilo C₁-C₆, -C(O)NHS-(O)₂-

alquilo C₁-C₆, -C(O)NR⁴R⁵, -NR⁴C(O)NR⁴R⁵, alquil C₁-C₆-carbonil(alquil C₁-C₆)amino-, haloalquil C₁-C₆-carbonilamino-, haloalquil C₁-C₆-carbonil(alquil C₁-C₆)amino-, alquil C₁-C₆-sulfonilamino-, alquil C₁-C₆-sulfonil(alquil C₁-C₆)amino-, haloalquil C₁-C₆-sulfonilamino-, haloalquil C₁-C₆-sulfonil(alquil C₁-C₆)amino-, cicloalquil C₃-C₆-sulfonilamino-, cicloalquil C₃-C₆-sulfonil(alquil C₁-C₆)amino-, hidroxiamino-, hidroxi(alquil C₁-C₆)amino, alcoxi C₁-C₆-amino, alcoxi C₁-C₆(alquil C₁-C₆)amino, haloalcoxi C₁-C₆-amino, haloalcoxi C₁-C₆(alquil C₁-C₆)amino; y un sistema de anillos seleccionado del grupo que consiste: en un anillo de fenilo, un anillo de heteroarilo de 5-6 miembros y un anillo de heterociclilo de 3-6 miembros, en donde dicho sistema de anillos está sustituido por 0 a 5 R¹⁶; y cualquier sustituyente R⁸ adicional se puede seleccionar del grupo que consiste en hidroxilo, halógeno, ciano, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆, alqueno C₂-C₆ y alquino C₂-C₆; y/o D se sustituirá en un nitrógeno del anillo por al menos un R⁹ seleccionado del grupo que consiste en alquilo C₅-C₆, haloalquilo C₅-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₃-alquil C₃-, alcoxi C₃-alquil C₁-C₂-, haloalcoxi C₁-C₃-alquil C₁-C₃-, alcoxi C₁-C₃-alcoxi C₁-C₃-alquil C₁-C₃-, hidroxialquil C₁-C₆-, alquil C₁-C₃-S(O)_m-alquilo C₁-C₆-, alquil C₁-C₃-S(O)_m-haloalquilo C₁-C₆-, alquil C₁-C₃-S(O)_m-cicloalquilo C₃-C₆-, cianoalquil C₁-C₆- y un sistema de anillos seleccionado del grupo que consiste en: un anillo de fenilo, un anillo de heteroarilo de 5-6 miembros y un anillo de heterociclilo de 3-6 miembros, en donde dicho sistema de anillos está sustituido por 0 a 5 R¹⁶;

R⁴ y R⁵ son cada uno independientemente hidrógeno, alquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃ o cicloalquilo C₃-C₆;

m es un número entero de 0, 1 o 2 (preferiblemente 0 o 2);

cada R^{4a} y R^{5a} se selecciona independientemente del grupo que consiste en alcoxi C₁-C₆ y cicloalquilo C₃-C₆, o R^{4a} y R^{5a} juntos pueden formar un anillo morfolino; y

cada R¹⁶ es independientemente halógeno, ciano, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆ o haloalcoxi C₁-C₆;

W es W₁; y

R¹⁰, R¹¹, R¹² y R¹³ son todos hidrógeno.

En un conjunto más preferido alternativo de realizaciones (donde tanto X como Y son distintos de ciclopropilo) en un compuesto de la fórmula (I);

R¹ es metilo;

R² es metilo;

G es hidrógeno o -C(O)-R³, en donde R³ es isopropilo, t-butilo, metilo, etilo, propargilo, metoxi, etoxi o *terc*-butoxi;

X es flúor y está en *orto* con respecto al resto piridazinona/piridazina-diona;

Y es cloro y en *orto* con respecto al resto -W-D;

D es un anillo de heteroarilo monocíclico de 5 o 6 miembros que contiene 1, 2 o 3 heteroátomos independientemente seleccionados de oxígeno, nitrógeno y azufre sustituidos en un carbono del anillo por 1 o 2 R⁸, en donde al menos un R⁸ se selecciona del grupo que consiste en haloalquil C₁-C₆-carbonil-, cicloalquil C₃-C₆-carbonil-, -S(O)_m-haloalquilo C₁-C₆-, -S(O)_m-cicloalquilo C₃-C₆-, -O-S(O)₂-alquilo C₁-C₃-, alquil C₁-C₃-S(O)_m-alquilo C₁-C₆-, alquil C₁-C₃-S(O)_m-haloalquilo C₁-C₆-, alquil C₁-C₃-S(O)_m-cicloalquilo C₃-C₆-, -S(O)₂NHC(O)alquilo C₁-C₃-, -S(O)₂NR⁴R⁵-, -C(O)OH, -C(O)Oalquilo C₁-C₆-, -C(O)NHS-(O)₂-alquilo C₁-C₆-, -C(O)NR⁴R⁵-, -NR⁴C(O)NR⁴R⁵-, alquil C₁-C₆-carbonil(alquil C₁-C₆)amino-, haloalquil C₁-C₆-carbonilamino- y haloalquil C₁-C₆-carbonil(alquil C₁-C₆)amino-; o un sistema de anillos seleccionado del grupo que consiste: en un anillo de fenilo, un anillo de heteroarilo de 5-6 miembros y un anillo de heterociclilo de 3-6 miembros, en donde dicho sistema de anillos está sustituido por 0 a 5 R¹⁶; y cualquier sustituyente R⁸ adicional se puede seleccionar del grupo que consiste en halógeno, alquil C₁-C₆ y haloalquilo C₁-C₆; y/o D se sustituirá en un nitrógeno del anillo por un R⁹ seleccionado del grupo que consiste en alquilo C₅-C₆, haloalquilo C₅-C₆, cicloalquilo C₃-C₆-, alquil C₁-C₃-S(O)_m-alquilo C₁-C₆-, alquil C₁-C₃-S(O)_m-haloalquilo C₁-C₆-, alquil C₁-C₃-S(O)_m-cicloalquilo C₃-C₆-, y un sistema de anillos seleccionado del grupo que consiste en: un anillo de fenilo, un anillo de heteroarilo de 5-6 miembros y un anillo de heterociclilo de 3-6 miembros, en donde dicho sistema de anillos está sustituido por 0 a 5 R¹⁶;

R⁴ y R⁵ son cada uno independientemente hidrógeno, alquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃ o cicloalquilo C₃-C₆;

m es 0 o 2 (preferiblemente 0);

cada R¹⁶ es independientemente halógeno, ciano, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₃ o alcoxi C₁-C₄;

W es W1; y

5 R¹⁰, R¹¹, R¹² y R¹³ son todos hidrógeno.

En un conjunto incluso más preferido alternativo de realizaciones (donde tanto X como Y son distintos de ciclopropilo) en un compuesto de la fórmula (I);

10 R¹ es metilo;

R² es metilo;

G es hidrógeno o -C(O)-R³, en donde R³ es isopropilo, t-butilo, metilo, etilo, propargilo o metoxi;

15 X es flúor y está en *orto* con respecto al resto piridazinona/piridazina-diona;

Y es cloro y en *orto* con respecto al resto -W-D;

20 D es un anillo de heteroarilo monocíclico de 5 o 6 miembros que contiene 1, 2 o 3 átomos de nitrógeno sustituidos en un carbono del anillo por un R⁸ seleccionado del grupo que consiste en -alquil C₁-C₃-S(O)_m-alquilo C₁-C₆, -S(O)₂NHC(O)alquilo C₁-C₃, -S(O)₂NR⁴R⁵, -C(O)OH, -C(O)O-alquil C₁-C₆ y -C(O)NR⁴R⁵; o un sistema de anillos seleccionado del grupo que consiste: en un anillo de fenilo, morfolinilo, tetrahydrofuranilo, furilo, tienilo, pirrolilo, pirazolilo, imidazolilo, 1,2,3-triazolilo, 1,2,4-triazolilo, tetrazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, 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, piridonilo, pirimidinilo, piridazinilo, pirazinilo, 1,2,3-triazinilo, 1,2,4-triazinilo o 1,3,5-triazinilo, en donde dicho sistema de anillos está sustituido por 0 a 2 R¹⁶; y/o D se sustituirá en un nitrógeno del anillo por un R⁹ seleccionado del grupo que consiste en alquilo C₅-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, y un sistema de anillos seleccionado del grupo que consiste en: un anillo de fenilo, un anillo de heteroarilo de 5-6 miembros y un anillo de heterociclilo de 3-6 miembros, en donde dicho sistema de anillos está sustituido por 0 a 2 R¹⁶;

R⁴ y R⁵ son cada uno independientemente hidrógeno o alquilo C₁-C₃;

35 m es 0 o 2 (preferiblemente 0);

cada R¹⁶ es independientemente halógeno o alquilo C₁-C₄ (preferiblemente metilo);

W es W1; y

40 R¹⁰, R¹¹, R¹² y R¹³ son todos hidrógeno.

Aún en un conjunto incluso más preferido alternativo de realizaciones (donde tanto X como Y son distintos de ciclopropilo) en un compuesto de la fórmula (I);

45 R¹ es metilo;

R² es metilo;

50 G es hidrógeno o -C(O)-R³, en donde R³ es isopropilo;

X es flúor y está en *orto* con respecto al resto piridazinona/piridazina-diona;

Y es cloro y en *orto* con respecto al resto -W-D;

55 D es un pirazolilo o piridilo sustituido en un carbono del anillo por un R⁸ seleccionado del grupo que consiste en metilsulfanilmetilo, isopropilsulfanilmetilo, sulfamoilo, metilsulfamoilo y carbamoilo; o un sistema de anillos seleccionado del grupo que consiste: en un anillo de fenilo, morfolinilo, tetrahydrofuranilo, furilo, tienilo, pirrolilo, pirazolilo, 1,2,4-triazolilo, oxazolilo y tiazolilo, en donde dicho sistema de anillos está sustituido por 0 a 2 R¹⁶; y/o D se sustituirá en un nitrógeno del anillo por un R⁹ seleccionado de ciclopropilo o fenilo;

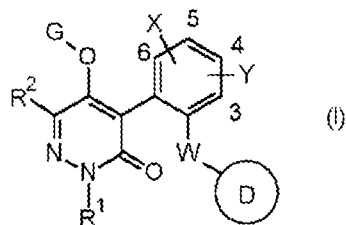
60 cada R¹⁶ es metilo;

W es W1; y

65 R¹⁰, R¹¹, R¹² y R¹³ son todos hidrógeno.

Las Tablas A-1, A-2, A-3, A-4, B-1, B-2, B-3, B-4, C-1, C-2, C-3 y C-4 ilustran a continuación ejemplos específicos de los compuestos de la fórmula (I) de la invención.

- 5 **Compuestos herbicidas de la presente invención.** El sistema de numeración usado para describir las posiciones de X e Y en el compuesto de la fórmula (I) mostrado a continuación se muestra únicamente a efectos de claridad.



- 10 La **Tabla A-1** proporciona 672 compuestos A-1.001 a A-1.672 de fórmula (I), en donde G es -H, W es -CH₂-CH₂- y R¹, R², X, Y, D son como se definió para los n.º de compuesto 1.001 a 1.672 respectivamente en la siguiente Tabla 1.

Tabla 1: Definiciones de sustituyentes de R¹, R², X, Y y D:

N.º de comp.	R ¹	R ²	X	Y	D
1,001	-Me	-Me	6-F	3-F	4-oxazol-5-ilfenil-
1,002	-Me	-Me	6-F	3-F	4-acetamidofenil-
1,003	-Me	-Me	6-F	3-F	4-(dimetilsulfamoil)fenil-
1,004	-Me	-Me	6-F	3-F	4-terc-butilfenil-
1,005	-Me	-Me	6-F	3-F	4-bifenil-
1,006	-Me	-Me	6-F	3-F	4-[etil(metil)carbamoil]-3-fluoro-fenil-
1,007	-Me	-Me	6-F	3-F	2-cianofenil-
1,008	-Me	-Me	6-F	3-F	3-cianofenil-
1,009	-Me	-Me	6-F	3-F	4-amino-3-metilfenil-
1,010	-Me	-Me	6-F	3-F	4-metilsulfonilfenil-
1,011	-Me	-Me	6-F	3-F	4-dimetilaminofenil-
1,012	-Me	-Me	6-F	3-F	4-metilaminofenil-
1,013	-Me	-Me	6-F	3-F	4-terc-butoxifenil-
1,014	-Me	-Me	6-F	3-F	4-cianofenil-
1,015	-Me	-Me	6-F	3-F	4-hidroxifenil-
1,016	-Me	-Me	6-F	3-F	4-ciclopropilfenil-
1,017	-Me	-Me	6-F	3-F	4-(metilsulfanil)fenil-
1,018	-Me	-Me	6-F	3-F	4-carboxifenil-
1,019	-Me	-Me	6-F	3-F	4-metoxycarbonilfenil-
1,020	-Me	-Me	6-F	3-F	4-(terc-butoxycarbonilamino)-3-fluoro-2-fenil-
1,021	-Me	-Me	6-F	3-F	2-(metilsulfanil)-4-piridil-
1,022	-Me	-Me	6-F	3-F	2-acetamido-4-piridil-
1,023	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-oxazol-5-ilfenil-
1,024	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-acetamidofenil-
1,025	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-(dimetilsulfamoil)fenil-
1,026	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-terc-butilfenil-
1,027	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-bifenil-
1,028	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-[etil(metil)carbamoil]-3-fluoro-fenil-
1,029	-Me	-Me	6-F	3-Cl	2-cianofenil-

N.º de comp.	R ¹	R ²	X	Y	D
1,030	-Me	-Me	6-F	3-Cl	3-cianofenil-
1,031	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-amino-3-metilfenil-
1,032	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-metilsulfonilfenil-
1,033	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-dimetilaminofenil-
1,034	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-metilaminofenil-
1,035	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-terc-butoxifenil-
1,036	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-cianofenil-
1,037	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-hidroxifenil-
1,038	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-ciclopropilfenil-
1,039	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-(metilsulfanil)fenil-
1,040	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-carboxifenil-
1,041	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-metoxicarbonilfenil-
1,042	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-(terc-butoxicarbonilamino)-3-fluoro-2-fenil-
1,043	-Me	-Me	6-F	3-Cl	2-(metilsulfanil)-4-piridil-
1,044	-Me	-Me	6-F	3-Cl	2-acetamido-4-piridil-
1,045	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-oxazol-5-ilfenil-
1,046	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-acetamidofenil-
1,047	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-(dimetilsulfamoil)fenil-
1,048	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-terc-butilfenil-
1,049	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-bifenil-
1,050	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-[etil(metil)carbamoil]-3-fluoro-fenil-
1,051	-Me	-Me	6-Cl	3-F	2-cianofenil-
1,052	-Me	-Me	6-Cl	3-F	3-cianofenil-
1,053	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-amino-3-metilfenil-
1,054	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-metilsulfonilfenil-
1,055	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-dimetilaminofenil-
1,056	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-metilaminofenil-
1,057	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-terc-butoxifenil-
1,058	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-cianofenil-
1,059	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-hidroxifenil-
1,060	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-ciclopropilfenil-
1,061	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-(metilsulfanil)fenil-
1,062	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-carboxifenil-
1,063	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-metoxicarbonilfenil-
1,064	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-(terc-butoxicarbonilamino)-3-fluoro-2-fenil-
1,065	-Me	-Me	6-Cl	3-F	2-(metilsulfanil)-4-piridil-
1,066	-Me	-Me	6-Cl	3-F	2-acetamido-4-piridil-
1,067	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-oxazol-5-ilfenil-
1,068	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-acetamidofenil-
1,069	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(dimetilsulfamoil)fenil-
1,070	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-terc-butilfenil-
1,071	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-bifenil-
1,072	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-[etil(metil)carbamoil]-3-fluoro-fenil-

N.º de comp.	R ¹	R ²	X	Y	D
1,073	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	2-cianofenil-
1,074	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	3-cianofenil-
1,075	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-amino-3-metilfenil-
1,076	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-metilsulfonilfenil-
1,077	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-dimetilaminofenil-
1,078	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-metilaminofenil-
1,079	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-terc-butoxifenil-
1,080	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-cianofenil-
1,081	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-hidroxifenil-
1,082	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-ciclopropilfenil-
1,083	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(metilsulfanil)fenil-
1,084	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-carboxifenil-
1,085	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-metoxycarbonilfenil-
1,086	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(terc-butoxicarbonilamino)-3-fluoro-2-fenil-
1,087	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	2-(metilsulfanil)-4-piridil-
1,088	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	2-acetamido-4-piridil-
1,089	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-oxazol-5-ilfenil-
1,090	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-acetamidofenil-
1,091	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-(dimetilsulfamoil)fenil-
1,092	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-terc-butilfenil-
1,093	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-bifenil-
1,094	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-[etil(metil)carbamoil]-3-fluoro-fenil-
1,095	-Me	-Cl	6-F	3-F	2-cianofenil-
1,096	-Me	-Cl	6-F	3-F	3-cianofenil-
1,097	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-amino-3-metilfenil-
1,098	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-metilsulfonilfenil-
1,099	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-dimetilaminofenil-
1,100	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-metilaminofenil-
1,101	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-terc-butoxifenil-
1,102	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-cianofenil-
1,103	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-hidroxifenil-
1,104	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-ciclopropilfenil-
1,105	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-(metilsulfanil)fenil-
1,106	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-carboxifenil-
1,107	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-metoxycarbonilfenil-
1,108	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-(terc-butoxicarbonilamino)-3-fluoro-2-fenil-
1,109	-Me	-Cl	6-F	3-F	2-(metilsulfanil)-4-piridil-
1,110	-Me	-Cl	6-F	3-F	2-acetamido-4-piridil-
1,111	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-oxazol-5-ilfenil-
1,112	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-acetamidofenil-
1,113	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-(dimetilsulfamoil)fenil-
1,114	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-terc-butilfenil-
1,115	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-bifenil-

N.º de comp.	R ¹	R ²	X	Y	D
1,116	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-[etil(metil)carbamoil]-3-fluoro-fenil-
1,117	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	2-cianofenil-
1,118	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	3-cianofenil-
1,119	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-amino-3-metilfenil-
1,120	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-metilsulfonilfenil-
1,121	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-dimetilaminofenil-
1,122	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-metilaminofenil-
1,123	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-terc-butoxifenil-
1,124	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-cianofenil-
1,125	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-hidroxifenil-
1,126	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-ciclopropilfenil-
1,127	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-(metilsulfanil)fenil-
1,128	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-carboxifenil-
1,129	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-metoxicarbonilfenil-
1,130	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-(terc-butoxicarbonilamino)-3-fluoro-2-fenil-
1,131	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	2-(metilsulfanil)-4-piridil-
1,132	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	2-acetamido-4-piridil-
1,133	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-oxazol-5-ilfenil-
1,134	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-acetamidofenil-
1,135	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-(dimetilsulfamoil)fenil-
1,136	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-terc-butilfenil-
1,137	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-bifenil-
1,138	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-[etil(metil)carbamoil]-3-fluoro-fenil-
1,139	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	2-cianofenil-
1,140	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	3-cianofenil-
1,141	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-amino-3-metilfenil-
1,142	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-metilsulfonilfenil-
1,143	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-dimetilaminofenil-
1,144	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-metilaminofenil-
1,145	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-terc-butoxifenil-
1,146	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-cianofenil-
1,147	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-hidroxifenil-
1,148	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-ciclopropilfenil-
1,149	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-(metilsulfanil)fenil-
1,150	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-carboxifenil-
1,151	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-metoxicarbonilfenil-
1,152	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-(terc-butoxicarbonilamino)-3-fluoro-2-fenil-
1,153	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	2-(metilsulfanil)-4-piridil-
1,154	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	2-acetamido-4-piridil-
1,155	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-oxazol-5-ilfenil-
1,156	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-acetamidofenil-
1,157	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(dimetilsulfamoil)fenil-
1,158	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-terc-butilfenil-

N.º de comp.	R ¹	R ²	X	Y	D
1,159	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-bifenil-
1,160	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-[etil(metil)carbamoil]-3-fluoro-fenil-
1,161	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	2-cianofenil-
1,162	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	3-cianofenil-
1,163	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-amino-3-metilfenil-
1,164	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-metilsulfonilfenil-
1,165	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-dimetilaminofenil-
1,166	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-metilaminofenil-
1,167	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-terc-butoxifenil-
1,168	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-cianofenil-
1,169	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-hidroxifenil-
1,170	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-ciclopropilfenil-
1,171	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(metilsulfanil)fenil-
1,172	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-carboxifenil-
1,173	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-metoxycarbonilfenil-
1,174	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(terc-butoxicarbonilamino)-3-fluoro-2-fenil-
1,175	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	2-(metilsulfanil)-4-piridil-
1,176	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	2-acetamido-4-piridil-
1,177	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-oxazol-5-ilfenil-
1,178	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-acetamidofenil-
1,179	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-(dimetilsulfamoil)fenil-
1,180	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-terc-butilfenil-
1,181	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-bifenil-
1,182	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-[etil(metil)carbamoil]-3-fluoro-fenil-
1,183	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-F	2-cianofenil-
1,184	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-F	3-cianofenil-
1,185	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-amino-3-metilfenil-
1,186	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-metilsulfonilfenil-
1,187	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-dimetilaminofenil-
1,188	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-metilaminofenil-
1,189	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-terc-butoxifenil-
1,190	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-cianofenil-
1,191	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-hidroxifenil-
1,192	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-ciclopropilfenil-
1,193	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-(metilsulfanil)fenil-
1,194	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-carboxifenil-
1,195	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-metoxycarbonilfenil-
1,196	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-(terc-butoxicarbonilamino)-3-fluoro-2-fenil-
1,197	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-F	2-(metilsulfanil)-4-piridil-
1,198	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-F	2-acetamido-4-piridil-
1,199	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-oxazol-5-ilfenil-
1,200	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-acetamidofenil-
1,201	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-(dimetilsulfamoil)fenil-

N.º de comp.	R ¹	R ²	X	Y	D
1,202	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-terc-butilfenil-
1,203	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-bifenil-
1,204	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-[etil(metil)carbamoil]-3-fluoro-fenil-
1,205	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	2-cianofenil-
1,206	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	3-cianofenil-
1,207	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-amino-3-metilfenil-
1,208	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-metilsulfonilfenil-
1,209	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-dimetilaminofenil-
1,210	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-metilaminofenil-
1,211	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-terc-butoxifenil-
1,212	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-cianofenil-
1,213	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-hidroxifenil-
1,214	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-ciclopropilfenil-
1,215	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-(metilsulfanil)fenil-
1,216	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-carboxifenil-
1,217	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-metoxycarbonilfenil-
1,218	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-(terc-butoxicarbonilamino)-3-fluoro-2-fenil-
1,219	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	2-(metilsulfanil)-4-piridil-
1,220	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	2-acetamido-4-piridil-
1,221	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-oxazol-5-ilfenil-
1,222	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-acetamidofenil-
1,223	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-(dimetilsulfamoil)fenil-
1,224	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-terc-butilfenil-
1,225	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-bifenil-
1,226	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-[etil(metil)carbamoil]-3-fluoro-fenil-
1,227	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	2-cianofenil-
1,228	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	3-cianofenil-
1,229	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-amino-3-metilfenil-
1,230	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-metilsulfonilfenil-
1,231	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-dimetilaminofenil-
1,232	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-metilaminofenil-
1,233	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-terc-butoxifenil-
1,234	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-cianofenil-
1,235	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-hidroxifenil-
1,236	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-ciclopropilfenil-
1,237	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-(metilsulfanil)fenil-
1,238	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-carboxifenil-
1,239	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-metoxycarbonilfenil-
1,240	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-(terc-butoxicarbonilamino)-3-fluoro-2-fenil-
1,241	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	2-(metilsulfanil)-4-piridil-
1,242	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	2-acetamido-4-piridil-
1,243	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-oxazol-5-ilfenil-
1,244	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-acetamidofenil-

N.º de comp.	R ¹	R ²	X	Y	D
1,245	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(dimetilsulfamoil)fenil-
1,246	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-terc-butilfenil-
1,247	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-bifenil-
1,248	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-[etil(metil)carbamoil]-3-fluoro-fenil-
1,249	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	2-cianofenil-
1,250	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	3-cianofenil-
1,251	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-amino-3-metilfenil-
1,252	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-metilsulfonilfenil-
1,253	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-dimetilaminofenil-
1,254	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-metilaminofenil-
1,255	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-terc-butoxifenil-
1,256	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-cianofenil-
1,257	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-hidroxifenil-
1,258	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-ciclopropilfenil-
1,259	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(metilsulfanil)fenil-
1,260	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-carboxifenil-
1,261	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-metoxicarbonilfenil-
1,262	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(terc-butoxicarbonilamino)-3-fluoro-2-fenil-
1,263	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	2-(metilsulfanil)-4-piridil-
1,264	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	2-acetamido-4-piridil-
1,265	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-oxazol-5-ilfenil-
1,266	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-acetamidofenil-
1,267	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-(dimetilsulfamoil)fenil-
1,268	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-terc-butilfenil-
1,269	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-bifenil-
1,270	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-[etil(metil)carbamoil]-3-fluoro-fenil-
1,271	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	2-cianofenil-
1,272	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	3-cianofenil-
1,273	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-amino-3-metilfenil-
1,274	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-metilsulfonilfenil-
1,275	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-dimetilaminofenil-
1,276	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-metilaminofenil-
1,277	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-terc-butoxifenil-
1,278	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-cianofenil-
1,279	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-hidroxifenil-
1,280	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-ciclopropilfenil-
1,281	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-(metilsulfanil)fenil-
1,282	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-carboxifenil-
1,283	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-metoxicarbonilfenil-
1,284	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-(terc-butoxicarbonilamino)-3-fluoro-2-fenil-
1,285	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	2-(metilsulfanil)-4-piridil-
1,286	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	2-acetamido-4-piridil-
1,287	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-oxazol-5-ilfenil-

N.º de comp.	R ¹	R ²	X	Y	D
1,288	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-acetamidofenil-
1,289	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-(dimetilsulfamoil)fenil-
1,290	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-terc-butilfenil-
1,291	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-bifenil-
1,292	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-[etil(metil)carbamoil]-3-fluoro-fenil-
1,293	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	2-cianofenil-
1,294	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	3-cianofenil-
1,295	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-amino-3-metilfenil-
1,296	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-metilsulfonilfenil-
1,297	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-dimetilaminofenil-
1,298	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-metilaminofenil-
1,299	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-terc-butoxifenil-
1,300	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-cianofenil-
1,301	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-hidroxifenil-
1,302	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-ciclopropilfenil-
1,303	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-(metilsulfanil)fenil-
1,304	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-carboxifenil-
1,305	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-metoxicarbonilfenil-
1,306	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-(terc-butoxicarbonilamino)-3-fluoro-2-fenil-
1,307	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	2-(metilsulfanil)-4-piridil-
1,308	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	2-acetamido-4-piridil-
1,309	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-oxazol-5-ilfenil-
1,310	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-acetamidofenil-
1,311	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-(dimetilsulfamoil)fenil-
1,312	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-terc-butilfenil-
1,313	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-bifenil-
1,314	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-[etil(metil)carbamoil]-3-fluoro-fenil-
1,315	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	2-cianofenil-
1,316	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	3-cianofenil-
1,317	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-amino-3-metilfenil-
1,318	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-metilsulfonilfenil-
1,319	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-dimetilaminofenil-
1,320	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-metilaminofenil-
1,321	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-terc-butoxifenil-
1,322	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-cianofenil-
1,323	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-hidroxifenil-
1,324	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-ciclopropilfenil-
1,325	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-(metilsulfanil)fenil-
1,326	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-carboxifenil-
1,327	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-metoxicarbonilfenil-
1,328	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-(terc-butoxicarbonilamino)-3-fluoro-2-fenil-
1,329	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	2-(metilsulfanil)-4-piridil-
1,330	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	2-acetamido-4-piridil-

N.º de comp.	R ¹	R ²	X	Y	D
1,331	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-oxazol-5-ilfenil-
1,332	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-acetamidofenil-
1,333	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(dimetilsulfamoil)fenil-
1,334	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-terc-butilfenil-
1,335	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-bifenil-
1,336	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-[etil(metil)carbamoil]-3-fluoro-fenil-
1,337	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	2-cianofenil-
1,338	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	3-cianofenil-
1,339	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-amino-3-metilfenil-
1,340	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-metilsulfonilfenil-
1,341	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-dimetilaminofenil-
1,342	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-metilaminofenil-
1,343	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-terc-butoxifenil-
1,344	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-cianofenil-
1,345	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-hidroxifenil-
1,346	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-ciclopropilfenil-
1,347	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(metilsulfanil)fenil-
1,348	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-carboxifenil-
1,349	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-metoxicarbonilfenil-
1,350	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(terc-butoxicarbonilamino)-3-fluoro-2-fenil-
1,351	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	2-(metilsulfanil)-4-piridil-
1,352	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	2-acetamido-4-piridil-
1,353	-Me	-Me	6-F	3-F	4-(1-metilpirazol-3-il)fenil-
1,354	-Me	-Me	6-F	3-F	4-(5-metiltetrazol-1-il)fenil-
1,355	-Me	-Me	6-F	3-F	4-morfolinofenil-
1,356	-Me	-Me	6-F	3-F	4-(3-metilpirazol-1-il)fenil-
1,357	-Me	-Me	6-F	3-F	4-(3,5-dimetilpirazol-1-il)fenil-
1,358	-Me	-Me	6-F	3-F	4-pirazol-1-ilfenil-
1,359	-Me	-Me	6-F	3-F	4-pirrol-1-ilfenil-
1,360	-Me	-Me	6-F	3-F	4-(5-metiltetrahidrofuran-2-il)fenil-
1,361	-Me	-Me	6-F	3-F	4-(5-metil-2-furil)fenil-
1,362	-Me	-Me	6-F	3-F	4-oxazol-2-ilfenil-
1,363	-Me	-Me	6-F	3-F	4-(2-metiltiazol-4-il)fenil-
1,364	-Me	-Me	6-F	3-F	4-(2-tienil)fenil-
1,365	-Me	-Me	6-F	3-F	4-(1,2,4-triazol-1-il)fenil-
1,366	-Me	-Me	6-F	3-F	1-fenil-4-pirazolil-
1,367	-Me	-Me	6-F	3-F	1-ciclopropil-4-pirazolil-
1,368	-Me	-Me	6-F	3-F	4-(metilsulfanilmetil)fenil-
1,369	-Me	-Me	6-F	3-F	4-(isopropilsulfanilmetil)fenil-
1,370	-Me	-Me	6-F	3-F	4-(metilsulfamoil)fenil-
1,371	-Me	-Me	6-F	3-F	4-sulfamoilfenil-
1,372	-Me	-Me	6-F	3-F	4-carbamoilfenil-
1,373	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-(1-metilpirazol-3-il)fenil-

N.º de comp.	R ¹	R ²	X	Y	D
1,374	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-(5-metiltetrazol-1-il)fenil-
1,375	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-morfolinofenil-
1,376	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-(3-metilpirazol-1-il)fenil-
1,377	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-(3,5-dimetilpirazol-1-il)fenil-
1,378	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-pirazol-1-ilfenil-
1,379	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-pirrol-1-ilfenil-
1,380	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-(5-metiltetrahidrofuran-2-il)fenil-
1,381	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-(5-metil-2-furil)fenil-
1,382	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-oxazol-2-ilfenil-
1,383	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-(2-metiltiazol-4-il)fenil-
1,384	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-(2-tienil)fenil-
1,385	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-(1,2,4-triazol-1-il)fenil-
1,386	-Me	-Me	6-F	3-Cl	1-fenil-4-pirazolil-
1,387	-Me	-Me	6-F	3-Cl	1-ciclopropil-4-pirazolil-
1,388	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-(metilsulfanilmetil)fenil-
1,389	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-(isopropilsulfanilmetil)fenil-
1,390	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-(metilsulfamoil)fenil-
1,391	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-sulfamoilfenil-
1,392	-Me	-Me	6-F	3-Cl	4-carbamoilfenil-
1,393	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-(1-metilpirazol-3-il)fenil-
1,394	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-(5-metiltetrazol-1-il)fenil-
1,395	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-morfolinofenil-
1,396	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-(3-metilpirazol-1-il)fenil-
1,397	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-(3,5-dimetilpirazol-1-il)fenil-
1,398	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-pirazol-1-ilfenil-
1,399	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-pirrol-1-ilfenil-
1,400	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-(5-metiltetrahidrofuran-2-il)fenil-
1,401	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-(5-metil-2-furil)fenil-
1,402	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-oxazol-2-ilfenil-
1,403	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-(2-metiltiazol-4-il)fenil-
1,404	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-(2-tienil)fenil-
1,405	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-(1,2,4-triazol-1-il)fenil-
1,406	-Me	-Me	6-Cl	3-F	1-fenil-4-pirazolil-
1,407	-Me	-Me	6-Cl	3-F	1-ciclopropil-4-pirazolil-
1,408	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-(metilsulfanilmetil)fenil-
1,409	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-(isopropilsulfanilmetil)fenil-
1,410	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-(metilsulfamoil)fenil-
1,411	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-sulfamoilfenil-
1,412	-Me	-Me	6-Cl	3-F	4-carbamoilfenil-
1,413	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(1-metilpirazol-3-il)fenil-
1,414	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(5-metiltetrazol-1-il)fenil-
1,415	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-morfolinofenil-
1,416	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(3-metilpirazol-1-il)fenil-

N.º de comp.	R ¹	R ²	X	Y	D
1,417	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(3,5-dimetilpirazol-1-il)fenil-
1,418	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-pirazol-1-ilfenil-
1,419	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-pirrol-1-ilfenil-
1,420	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(5-metiltetrahidrofuran-2-il)fenil-
1,421	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(5-metil-2-furil)fenil-
1,422	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-oxazol-2-ilfenil-
1,423	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(2-metiltiazol-4-il)fenil-
1,424	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(2-tienil)fenil-
1,425	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(1,2,4-triazol-1-il)fenil-
1,426	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	1-fenil-4-pirazolil-
1,427	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	1-ciclopropil-4-pirazolil-
1,428	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(metilsulfanilmetil)fenil-
1,429	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(isopropilsulfanilmetil)fenil-
1,430	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(metilsulfamoil)fenil-
1,431	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-sulfamoilfenil-
1,432	-Me	-Me	6-Cl	3-Cl	4-carbamoilfenil-
1,433	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-(1-metilpirazol-3-il)fenil-
1,434	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-(5-metiltetrazol-1-il)fenil-
1,435	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-morfolinofenil-
1,436	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-(3-metilpirazol-1-il)fenil-
1,437	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-(3,5-dimetilpirazol-1-il)fenil-
1,438	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-pirazol-1-ilfenil-
1,439	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-pirrol-1-ilfenil-
1,440	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-(5-metiltetrahidrofuran-2-il)fenil-
1,441	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-(5-metil-2-furil)fenil-
1,442	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-oxazol-2-ilfenil-
1,443	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-(2-metiltiazol-4-il)fenil-
1,444	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-(2-tienil)fenil-
1,445	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-(1,2,4-triazol-1-il)fenil-
1,446	-Me	-Cl	6-F	3-F	1-fenil-4-pirazolil-
1,447	-Me	-Cl	6-F	3-F	1-ciclopropil-4-pirazolil-
1,448	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-(metilsulfanilmetil)fenil-
1,449	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-(isopropilsulfanilmetil)fenil-
1,450	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-(metilsulfamoil)fenil-
1,451	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-sulfamoilfenil-
1,452	-Me	-Cl	6-F	3-F	4-carbamoilfenil-
1,453	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-(1-metilpirazol-3-il)fenil-
1,454	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-(5-metiltetrazol-1-il)fenil-
1,455	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-morfolinofenil-
1,456	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-(3-metilpirazol-1-il)fenil-
1,457	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-(3,5-dimetilpirazol-1-il)fenil-
1,458	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-pirazol-1-ilfenil-
1,459	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-pirrol-1-ilfenil-

N.º de comp.	R ¹	R ²	X	Y	D
1,460	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-(5-metiltetrahidrofuran-2-il)fenil-
1,461	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-(5-metil-2-furil)fenil-
1,462	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-oxazol-2-ilfenil-
1,463	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-(2-metiltiazol-4-il)fenil-
1,464	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-(2-tienil)fenil-
1,465	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-(1,2,4-triazol-1-il)fenil-
1,466	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	1-fenil-4-pirazolil-
1,467	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	1-ciclopropil-4-pirazolil-
1,468	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-(metilsulfanilmetil)fenil-
1,469	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-(isopropilsulfanilmetil)fenil-
1,470	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-(metilsulfamoil)fenil-
1,471	-Me	-Cl	6-F	3-Cl	4-sulfamoilfenil-
1,472	-Me	-Cl	6-F	-Cl	4-carbamoilfenil-
1,473	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-(1-metilpirazol-3-il)fenil-
1,474	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-(5-metiltetrazol-1-il)fenil-
1,475	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-morfolinofenil-
1,476	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-(3-metilpirazol-1-il)fenil-
1,477	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-(3,5-dimetilpirazol-1-il)fenil-
1,478	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-pirazol-1-ilfenil-
1,479	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-pirrol-1-ilfenil-
1,480	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-(5-metiltetrahidrofuran-2-il)fenil-
1,481	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-(5-metil-2-furil)fenil-
1,482	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-oxazol-2-ilfenil-
1,483	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-(2-metiltiazol-4-il)fenil-
1,484	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-(2-tienil)fenil-
1,485	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-(1,2,4-triazol-1-il)fenil-
1,486	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	1-fenil-4-pirazolil-
1,487	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	1-ciclopropil-4-pirazolil-
1,488	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-(metilsulfanilmetil)fenil-
1,489	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-(isopropilsulfanilmetil)fenil-
1,490	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-(metilsulfamoil)fenil-
1,491	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-sulfamoilfenil-
1,492	-Me	-Cl	6-Cl	3-F	4-carbamoilfenil-
1,493	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(1-metilpirazol-3-il)fenil-
1,494	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(5-metiltetrazol-1-il)fenil-
1,495	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-morfolinofenil-
1,496	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(3-metilpirazol-1-il)fenil-
1,497	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(3,5-dimetilpirazol-1-il)fenil-
1,498	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-pirazol-1-ilfenil-
1,499	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-pirrol-1-ilfenil-
1,500	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(5-metiltetrahidrofuran-2-il)fenil-
1,501	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(5-metil-2-furil)fenil-
1,502	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-oxazol-2-ilfenil-

N.º de comp.	R ¹	R ²	X	Y	D
1,503	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(2-metiltiazol-4-il)fenil-
1,504	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(2-tienil)fenil-
1,505	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(1,2,4-triazol-1-il)fenil-
1,506	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	1-fenil-4-pirazolil-
1,507	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	1-ciclopropil-4-pirazolil-
1,508	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(metilsulfanilmetil)fenil-
1,509	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(isopropilsulfanilmetil)fenil-
1,510	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(metilsulfamoil)fenil-
1,511	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-sulfamoilfenil-
1,512	-Me	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-carbamoilfenil-
1,513	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-(1-metilpirazol-3-il)fenil-
1,514	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-(5-metiltetrazol-1-il)fenil-
1,515	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-morfolinofenil-
1,516	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-(3-metilpirazol-1-il)fenil-
1,517	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-(3,5-dimetilpirazol-1-il)fenil-
1,518	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-pirazol-1-ilfenil-
1,519	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-pirrol-1-ilfenil-
1,520	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-(5-metiltetrahidrofuran-2-il)fenil-
1,521	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-(5-metil-2-furil)fenil-
1,522	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-oxazol-2-ilfenil-
1,523	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-(2-metiltiazol-4-il)fenil-
1,524	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-(2-tienil)fenil-
1,525	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-(1,2,4-triazol-1-il)fenil-
1,526	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-F	1-fenil-4-pirazolil-
1,527	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-F	1-ciclopropil-4-pirazolil-
1,528	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-(metilsulfanilmetil)fenil-
1,529	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-(isopropilsulfanilmetil)fenil-
1,530	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-(metilsulfamoil)fenil-
1,531	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-sulfamoilfenil-
1,532	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-F	4-carbamoilfenil-
1,533	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-(1-metilpirazol-3-il)fenil-
1,534	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-(5-metiltetrazol-1-il)fenil-
1,535	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-morfolinofenil-
1,536	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-(3-metilpirazol-1-il)fenil-
1,537	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-(3,5-dimetilpirazol-1-il)fenil-
1,538	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-pirazol-1-ilfenil-
1,539	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-pirrol-1-ilfenil-
1,540	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-(5-metiltetrahidrofuran-2-il)fenil-
1,541	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-(5-metil-2-furil)fenil-
1,542	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-oxazol-2-ilfenil-
1,543	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-(2-metiltiazol-4-il)fenil-
1,544	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-(2-tienil)fenil-
1,545	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-(1,2,4-triazol-1-il)fenil-

N.º de comp.	R ¹	R ²	X	Y	D
1,546	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	1-fenil-4-pirazolil-
1,547	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	1-ciclopropil-4-pirazolil-
1,548	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-(metilsulfanilmetil)fenil-
1,549	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-(isopropilsulfanilmetil)fenil-
1,550	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-(metilsulfamoil)fenil-
1,551	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-sulfamoilfenil-
1,552	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-Cl	4-carbamoilfenil-
1,553	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-(1-metilpirazol-3-il)fenil-
1,554	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-(5-metiltetrazol-1-il)fenil-
1,555	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-morfolinofenil-
1,556	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-(3-metilpirazol-1-il)fenil-
1,557	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-(3,5-dimetilpirazol-1-il)fenil-
1,558	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-pirazol-1-ilfenil-
1,559	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-pirrol-1-ilfenil-
1,560	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-(5-metiltetrahidrofuran-2-il)fenil-
1,561	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-(5-metil-2-furil)fenil-
1,562	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-oxazol-2-ilfenil-
1,563	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-(2-metiltiazol-4-il)fenil-
1,564	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-(2-tienil)fenil-
1,565	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-(1,2,4-triazol-1-il)fenil-
1,566	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	1-fenil-4-pirazolil-
1,567	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	1-ciclopropil-4-pirazolil-
1,568	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-(metilsulfanilmetil)fenil-
1,569	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-(isopropilsulfanilmetil)fenil-
1,570	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-(metilsulfamoil)fenil-
1,571	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-sulfamoilfenil-
1,572	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-F	4-carbamoilfenil-
1,573	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(1-metilpirazol-3-il)fenil-
1,574	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(5-metiltetrazol-1-il)fenil-
1,575	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-morfolinofenil-
1,576	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(3-metilpirazol-1-il)fenil-
1,577	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(3,5-dimetilpirazol-1-il)fenil-
1,578	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-pirazol-1-ilfenil-
1,579	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-pirrol-1-ilfenil-
1,580	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(5-metiltetrahidrofuran-2-il)fenil-
1,581	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(5-metil-2-furil)fenil-
1,582	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-oxazol-2-ilfenil-
1,583	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(2-metiltiazol-4-il)fenil-
1,584	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(2-tienil)fenil-
1,585	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(1,2,4-triazol-1-il)fenil-
1,586	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	1-fenil-4-pirazolil-
1,587	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	1-ciclopropil-4-pirazolil-
1,588	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(metilsulfanilmetil)fenil-

N.º de comp.	R ¹	R ²	X	Y	D
1,589	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(isopropilsulfanilmetil)fenil-
1,590	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-(metilsulfamoil)fenil-
1,591	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-sulfamoilfenil-
1,592	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-Cl	4-carbamoilfenil-
1,593	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-(1-metilpirazol-3-il)fenil-
1,594	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-(5-metiltetrazol-1-il)fenil-
1,595	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-morfolinofenil-
1,596	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-(3-metilpirazol-1-il)fenil-
1,597	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-(3,5-dimetilpirazol-1-il)fenil-
1,598	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-pirazol-1-ilfenil-
1,599	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-pirrol-1-ilfenil-
1,600	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-(5-metiltetrahidrofuran-2-il)fenil-
1,601	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-(5-metil-2-furil)fenil-
1,602	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-oxazol-2-ilfenil-
1,603	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-(2-metiltiazol-4-il)fenil-
1,604	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-(2-tienil)fenil-
1,605	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-(1,2,4-triazol-1-il)fenil-
1,606	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	1-fenil-4-pirazolil-
1,607	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	1-ciclopropil-4-pirazolil-
1,608	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-(metilsulfanilmetil)fenil-
1,609	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-(isopropilsulfanilmetil)fenil-
1,610	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-(metilsulfamoil)fenil-
1,611	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-sulfamoilfenil-
1,612	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-F	4-carbamoilfenil-
1,613	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-(1-metilpirazol-3-il)fenil-
1,614	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-(5-metiltetrazol-1-il)fenil-
1,615	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-morfolinofenil-
1,616	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-(3-metilpirazol-1-il)fenil-
1,617	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-(3,5-dimetilpirazol-1-il)fenil-
1,618	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-pirazol-1-ilfenil-
1,619	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-pirrol-1-ilfenil-
1,620	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-(5-metiltetrahidrofuran-2-il)fenil-
1,621	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-(5-metil-2-furil)fenil-
1,622	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-oxazol-2-ilfenil-
1,623	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-(2-metiltiazol-4-il)fenil-
1,624	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-(2-tienil)fenil-
1,625	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-(1,2,4-triazol-1-il)fenil-
1,626	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	1-fenil-4-pirazolil-
1,627	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	1-ciclopropil-4-pirazolil-
1,628	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-(metilsulfanilmetil)fenil-
1,629	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-(isopropilsulfanilmetil)fenil-
1,630	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-(metilsulfamoil)fenil-
1,631	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-sulfamoilfenil-

N.º de comp.	R ¹	R ²	X	Y	D
1,632	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-Cl	4-carbamoilfenil-
1,633	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-(1-metilpirazol-3-il)fenil-
1,634	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-(5-metiltetrazol-1-il)fenil-
1,635	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-morfolinofenil-
1,636	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-(3-metilpirazol-1-il)fenil-
1,637	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-(3,5-dimetilpirazol-1-il)fenil-
1,638	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-pirazol-1-ilfenil-
1,639	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-pirrol-1-ilfenil-
1,640	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-(5-metiltetrahidrofuran-2-il)fenil-
1,641	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-(5-metil-2-furil)fenil-
1,642	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-oxazol-2-ilfenil-
1,643	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-(2-metiltiazol-4-il)fenil-
1,644	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-(2-tienil)fenil-
1,645	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-(1,2,4-triazol-1-il)fenil-
1,646	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	1-fenil-4-pirazolil-
1,647	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	1-ciclopropil-4-pirazolil-
1,648	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-(metilsulfanilmetil)fenil-
1,649	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-(isopropilsulfanilmetil)fenil-
1,650	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-(metilsulfamoil)fenil-
1,651	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-sulfamoilfenil-
1,652	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-F	4-carbamoilfenil-
1,653	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(1-metilpirazol-3-il)fenil-
1,654	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(5-metiltetrazol-1-il)fenil-
1,655	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-morfolinofenil-
1,656	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(3-metilpirazol-1-il)fenil-
1,657	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(3,5-dimetilpirazol-1-il)fenil-
1,658	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-pirazol-1-ilfenil-
1,659	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-pirrol-1-ilfenil-
1,660	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(5-metiltetrahidrofuran-2-il)fenil-
1,661	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(5-metil-2-furil)fenil-
1,662	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-oxazol-2-ilfenil-
1,663	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(2-metiltiazol-4-il)fenil-
1,664	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(2-tienil)fenil-
1,665	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(1,2,4-triazol-1-il)fenil-
1,666	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	1-fenil-4-pirazolil-
1,667	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	1-ciclopropil-4-pirazolil-
1,668	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(metilsulfanilmetil)fenil-
1,669	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(isopropilsulfanilmetil)fenil-
1,670	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-(metilsulfamoil)fenil-
1,671	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-sulfamoilfenil-
1,672	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-Cl	4-carbamoilfenil-

La **Tabla A-2** proporciona 672 compuestos A-2.001 a A-2.672 de fórmula (I), en donde G es -H, W es (E)-CH=CH- y R¹, R², X, Y, D son como se definió para los n.º de compuesto 1.001 a 1.672 respectivamente en la Tabla 1 anterior.

La **Tabla A-3** proporciona 672 compuestos A-3.001 a A-3.672 de fórmula (I), en donde G es $-(C=O)iPr$, W es $-CH_2-CH_2-$ y R^1 , R^2 , X, Y, D son como se definió para los n.º de compuesto 1.001 a 1.672 respectivamente en la Tabla 1 anterior.

La **Tabla A-4** proporciona 672 compuestos A-4.001 a A-4.672 de fórmula (I), en donde G es $-(C=O)iPr$, W es $(E)-CH=CH-$ y R^1 , R^2 , X, Y, D son como se definió para los n.º de compuesto 1.001 a 1.672 respectivamente en la Tabla 1 anterior.

La **Tabla B-1** proporciona 744 compuestos B-1.001 a B-1.744 de fórmula (I), en donde G es $-H$, W es $-CH_2-CH_2-$, X es 6-ciclopropilo y R^1 , R^2 , Y, D son como se definió para los n.º de compuesto 1.001 a 2.744 respectivamente en la siguiente Tabla 2.

Tabla 2: Definiciones de sustituyentes de R^1 , R^2 , Y y D:

N.º de compuesto	R^1	R^2	Y	D
2,001	-Me	-Me	3-F	-Ph
2,002	-Me	-Me	3-F	1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-4-il-
2,003	-Me	-Me	3-F	1-metil-pirazol-4-il-
2,004	-Me	-Me	3-F	2-(metilsulfanil)-4-piridil-
2,005	-Me	-Me	3-F	2-acetamido-4-piridil-
2,006	-Me	-Me	3-F	2-acetamidotiazol-5-il-
2,007	-Me	-Me	3-F	2-amino-4-piridil-
2,008	-Me	-Me	3-F	2-cloro-3-piridil-
2,009	-Me	-Me	3-F	2-cloro-4-piridil-
2,010	-Me	-Me	3-F	2-clorotiazol-5-il-
2,011	-Me	-Me	3-F	2-cianofenil-
2,012	-Me	-Me	3-F	2-ciano-fenil-
2,013	-Me	-Me	3-F	2-fluoro-4-piridil-
2,014	-Me	-Me	3-F	2-metil-4-piridil-
2,015	-Me	-Me	3-F	2-metil-triazol-4-il-
2,016	-Me	-Me	3-F	2-tolil-
2,017	-Me	-Me	3-F	2-trifluorometil-4-piridil-
2,018	-Me	-Me	3-F	2-trifluorometil-fenil-
2,019	-Me	-Me	3-F	3,4-difluoro-fenil-
2,020	-Me	-Me	3-F	3,5-difluoro-fenil-
2,021	-Me	-Me	3-F	3-cloro-4-fluoro-fenil-
2,022	-Me	-Me	3-F	3-cloro-4-piridil-
2,023	-Me	-Me	3-F	3-cianofenil-
2,024	-Me	-Me	3-F	3-ciano-fenil-
2,025	-Me	-Me	3-F	3-metil-2-piridil-
2,026	-Me	-Me	3-F	3-metil-4-amino-fenil-
2,027	-Me	-Me	3-F	3-piridilo-
2,028	-Me	-Me	3-F	3-tolil-
2,029	-Me	-Me	3-F	3-trifluorometil-3-piridil-
2,030	-Me	-Me	3-F	3-trifluorometil-fenil-
2,031	-Me	-Me	3-F	4-(dimetilamino)-fenil-
2,032	-Me	-Me	3-F	4-(dimetilsulfamoil)fenil-
2,033	-Me	-Me	3-F	4-(metilamino)-fenil-

N.º de compuesto	R ¹	R ²	Y	D
2,034	-Me	-Me	3-F	4-(metilsulfanil)fenil-
2,035	-Me	-Me	3-F	4-(terc-butoxi)-fenil-
2,036	-Me	-Me	3-F	4-(terc-butoxicarbonilamino)-3-fluorofenil-
2,037	-Me	-Me	3-F	4-(trifluorometoxi)-fenil-
2,038	-Me	-Me	3-F	4-[etil(metil)carbamoil]-3-fluoro-fenil-
2,039	-Me	-Me	3-F	4-acetamidofenil-
2,040	-Me	-Me	3-F	4-amino-3-metilfenil-
2,041	-Me	-Me	3-F	4- amino-fenil-
2,042	-Me	-Me	3-F	4-bifenil-
2,043	-Me	-Me	3-F	4-carboxifenil-
2,044	-Me	-Me	3-F	4-cloro-3-piridil-
2,045	-Me	-Me	3-F	4-cloro-fenil-
2,046	-Me	-Me	3-F	4-cianofenil-
2,047	-Me	-Me	3-F	4-ciano-fenil-
2,048	-Me	-Me	3-F	4-ciclopropilfenil-
2,049	-Me	-Me	3-F	4-ciclopropil-fenil-
2,050	-Me	-Me	3-F	4-dimetilaminofenil-
2,051	-Me	-Me	3-F	4-fluoro-fenil-
2,052	-Me	-Me	3-F	4-hidroxifenil-
2,053	-Me	-Me	3-F	4-hidroxi-fenil-
2,054	-Me	-Me	3-F	4-metoxicarbonilfenil-
2,055	-Me	-Me	3-F	4-metil-2-piridil-
2,056	-Me	-Me	3-F	4-metilaminofenil-
2,057	-Me	-Me	3-F	4-metilsulfonilfenil-
2,058	-Me	-Me	3-F	4-oxazol-5-ilfenil-
2,059	-Me	-Me	3-F	4-piridilo-
2,060	-Me	-Me	3-F	4-terc-butoxifenil-
2,061	-Me	-Me	3-F	4-terc-butilfenil-
2,062	-Me	-Me	3-F	4-tolil-
2,063	-Me	-Me	3-F	4-trifluorometil-3-piridil-
2,064	-Me	-Me	3-F	4-trifluorometil-fenil-
2,065	-Me	-Me	3-F	5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-il-
2,066	-Me	-Me	3-F	5-metil-2-piridil-
2,067	-Me	-Me	3-F	5-metil-3-piridil-
2,068	-Me	-Me	3-F	6-cloro-3-piridil-
2,069	-Me	-Me	3-F	6-metil-2-piridil-
2,070	-Me	-Me	3-F	pirimidin-5-il-
2,071	-Me	-Me	3-F	tiazol-2-il-
2,072	-Me	-Me	3-F	tiazol-5-il-
2,073	-Me	-Me	3-F	tiofen-3-il-
2,074	-Me	-Me	3-Cl	-Ph
2,075	-Me	-Me	3-Cl	1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-4-il-
2,076	-Me	-Me	3-Cl	1-metil-pirazol-4-il-

N.º de compuesto	R ¹	R ²	Y	D
2,077	-Me	-Me	3-Cl	2-(metilsulfanil)-4-piridil-
2,078	-Me	-Me	3-Cl	2-acetamido-4-piridil-
2,079	-Me	-Me	3-Cl	2-acetamidotiazol-5-il-
2,080	-Me	-Me	3-Cl	2-amino-4-piridil-
2,081	-Me	-Me	3-Cl	2-cloro-3-piridil-
2,082	-Me	-Me	3-Cl	2-cloro-4-piridil-
2,083	-Me	-Me	3-Cl	2-clorotiazol-5-il-
2,084	-Me	-Me	3-Cl	2-cianofenil-
2,085	-Me	-Me	3-Cl	2-ciano-fenil-
2,086	-Me	-Me	3-Cl	2-fluoro-4-piridil-
2,087	-Me	-Me	3-Cl	2-metil-4-piridil-
2,088	-Me	-Me	3-Cl	2-metil-triazol-4-il-
2,089	-Me	-Me	3-Cl	2-tolil-
2,090	-Me	-Me	3-Cl	2-trifluorometil-4-piridil-
2,091	-Me	-Me	3-Cl	2-trifluorometil-fenil-
2,092	-Me	-Me	3-Cl	3,4-difluoro-fenil-
2,093	-Me	-Me	3-Cl	3,5-difluoro-fenil-
2,094	-Me	-Me	3-Cl	3-cloro-4-fluoro-fenil-
2,095	-Me	-Me	3-Cl	3-cloro-4-piridil-
2,096	-Me	-Me	3-Cl	3-cianofenil-
2,097	-Me	-Me	3-Cl	3-ciano-fenil-
2,098	-Me	-Me	3-Cl	3-metil-2-piridil-
2,099	-Me	-Me	3-Cl	3-metil-4-amino-fenil-
2,100	-Me	-Me	3-Cl	3-piridil-
2,101	-Me	-Me	3-Cl	3-tolil-
2,102	-Me	-Me	3-Cl	3-trifluorometil-3-piridil-
2,103	-Me	-Me	3-Cl	3-trifluorometil-fenil-
2,104	-Me	-Me	3-Cl	4-(dimetilamino)-fenil-
2,105	-Me	-Me	3-Cl	4-(dimetilsulfamoil)fenil-
2,106	-Me	-Me	3-Cl	4-(metilamino)-fenil-
2,107	-Me	-Me	3-Cl	4-(metilsulfanil)fenil-
2,108	-Me	-Me	3-Cl	4-(terc-butoxi)-fenil-
2,109	-Me	-Me	3-Cl	4-(terc-butoxicarbonilamino)-3-fluorofenil-
2,110	-Me	-Me	3-Cl	4-(trifluorometoxi)-fenil-
2,111	-Me	-Me	3-Cl	4-[etil(metil)carbamoil]-3-fluoro-fenil-
2,112	-Me	-Me	3-Cl	4-acetamidofenil-
2,113	-Me	-Me	3-Cl	4-amino-3-metilfenil-
2,114	-Me	-Me	3-Cl	4- amino-fenil-
2,115	-Me	-Me	3-Cl	4-bifenil-
2,116	-Me	-Me	3-Cl	4-carboxifenil-
2,117	-Me	-Me	3-Cl	4-cloro-3-piridil-
2,118	-Me	-Me	3-Cl	4-cloro-fenil-
2,119	-Me	-Me	3-Cl	4-cianofenil-

N.º de compuesto	R ¹	R ²	Y	D
2,120	-Me	-Me	3-Cl	4-ciano-fenil-
2,121	-Me	-Me	3-Cl	4-ciclopropilfenil-
2,122	-Me	-Me	3-Cl	4-ciclopropil-fenil-
2,123	-Me	-Me	3-Cl	4-dimetilaminofenil-
2,124	-Me	-Me	3-Cl	4-fluoro-fenil-
2,125	-Me	-Me	3-Cl	4-hidroxifenil-
2,126	-Me	-Me	3-Cl	4-hidroxi-fenil-
2,127	-Me	-Me	3-Cl	4-metoxycarbonilfenil-
2,128	-Me	-Me	3-Cl	4-metil-2-piridil-
2,129	-Me	-Me	3-Cl	4-metilaminofenil-
2,130	-Me	-Me	3-Cl	4-metilsulfonilfenil-
2,131	-Me	-Me	3-Cl	4-oxazol-5-ilfenil-
2,132	-Me	-Me	3-Cl	4-piridil-
2,133	-Me	-Me	3-Cl	4-terc-butoxifenil-
2,134	-Me	-Me	3-Cl	4-terc-butilfenil-
2,135	-Me	-Me	3-Cl	4-tolil-
2,136	-Me	-Me	3-Cl	4-trifluorometil-3-piridil-
2,137	-Me	-Me	3-Cl	4-trifluorometil-fenil-
2,138	-Me	-Me	3-Cl	5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-il-
2,139	-Me	-Me	3-Cl	5-metil-2-piridil-
2,140	-Me	-Me	3-Cl	5-metil-3-piridil-
2,141	-Me	-Me	3-Cl	6-cloro-3-piridil-
2,142	-Me	-Me	3-Cl	6-metil-2-piridil-
2,143	-Me	-Me	3-Cl	pirimidin-5-il-
2,144	-Me	-Me	3-Cl	tiazol-2-il-
2,145	-Me	-Me	3-Cl	tiazol-5-il-
2,146	-Me	-Me	3-Cl	tiofen-3-il-
2,147	-Me	-Cl	3-F	-Ph
2,148	-Me	-Cl	3-F	1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-4-il-
2,149	-Me	-Cl	3-F	1-metil-pirazol-4-il-
2,150	-Me	-Cl	3-F	2-(metilsulfanil)-4-piridil-
2,151	-Me	-Cl	3-F	2-acetamido-4-piridil-
2,152	-Me	-Cl	3-F	2-acetamidotiazol-5-il-
2,153	-Me	-Cl	3-F	2-amino-4-piridil-
2,154	-Me	-Cl	3-F	2-cloro-3-piridil-
2,155	-Me	-Cl	3-F	2-cloro-4-piridil-
2,156	-Me	-Cl	3-F	2-clorotiazol-5-il-
2,157	-Me	-Cl	3-F	2-cianofenil-
2,158	-Me	-Cl	3-F	2-ciano-fenil-
2,159	-Me	-Cl	3-F	2-fluoro-4-piridil-
2,160	-Me	-Cl	3-F	2-metil-4-piridil-
2,161	-Me	-Cl	3-F	2-metil-triazol-4-il-
2,162	-Me	-Cl	3-F	2-tolil-

N.º de compuesto	R ¹	R ²	Y	D
2,163	-Me	-Cl	3-F	2-trifluorometil-4-piridil-
2,164	-Me	-Cl	3-F	2-trifluorometil-fenil-
2,165	-Me	-Cl	3-F	3,4-difluoro-fenil-
2,166	-Me	-Cl	3-F	3,5-difluoro-fenil-
2,167	-Me	-Cl	3-F	3-cloro-4-fluoro-fenil-
2,168	-Me	-Cl	3-F	3-cloro-4-piridil-
2,169	-Me	-Cl	3-F	3-cianofenil-
2,170	-Me	-Cl	3-F	3-ciano-fenil-
2,171	-Me	-Cl	3-F	3-metil-2-piridil-
2,172	-Me	-Cl	3-F	3-metil-4-amino-fenil-
2,173	-Me	-Cl	3-F	3-piridilo-
2,174	-Me	-Cl	3-F	3-tolil-
2,175	-Me	-Cl	3-F	3-trifluorometil-3-piridil-
2,176	-Me	-Cl	3-F	3-trifluorometil-fenil-
2,177	-Me	-Cl	3-F	4-(dimetilamino)-fenil-
2,178	-Me	-Cl	3-F	4-(dimetilsulfamoil)fenil-
2,179	-Me	-Cl	3-F	4-(metilamino)-fenil-
2,180	-Me	-Cl	3-F	4-(metilsulfanil)fenil-
2,181	-Me	-Cl	3-F	4-(terc-butoxi)-fenil-
2,182	-Me	-Cl	3-F	4-(terc-butoxicarbonilamino)-3-fluorofenil-
2,183	-Me	-Cl	3-F	4-(trifluorometoxi)-fenil-
2,184	-Me	-Cl	3-F	4-[etil(metil)carbamoil]-3-fluoro-fenil-
2,185	-Me	-Cl	3-F	4-acetamidofenil-
2,186	-Me	-Cl	3-F	4-amino-3-metilfenil-
2,187	-Me	-Cl	3-F	4-amino-fenil-
2,188	-Me	-Cl	3-F	4-bifenil-
2,189	-Me	-Cl	3-F	4-carboxifenil-
2,190	-Me	-Cl	3-F	4-cloro-3-piridil-
2,191	-Me	-Cl	3-F	4-cloro-fenil-
2,192	-Me	-Cl	3-F	4-cianofenil-
2,193	-Me	-Cl	3-F	4-ciano-fenil-
2,194	-Me	-Cl	3-F	4-ciclopropilfenil-
2,195	-Me	-Cl	3-F	4-ciclopropil-fenil-
2,196	-Me	-Cl	3-F	4-dimetilaminofenil-
2,197	-Me	-Cl	3-F	4-fluoro-fenil-
2,198	-Me	-Cl	3-F	4-hidroxifenil-
2,199	-Me	-Cl	3-F	4-hidroxi-fenil-
2,200	-Me	-Cl	3-F	4-metoxicarbonilfenil-
2,201	-Me	-Cl	3-F	4-metil-2-piridil-
2,202	-Me	-Cl	3-F	4-metilaminofenil-
2,203	-Me	-Cl	3-F	4-metilsulfonilfenil-
2,204	-Me	-Cl	3-F	4-oxazol-5-ilfenil-
2,205	-Me	-Cl	3-F	4-piridilo-

N.º de compuesto	R ¹	R ²	Y	D
2,206	-Me	-Cl	3-F	4-terc-butoxifenil-
2,207	-Me	-Cl	3-F	4-terc-butilfenil-
2,208	-Me	-Cl	3-F	4-tolil-
2,209	-Me	-Cl	3-F	4-trifluorometil-3-piridil-
2,210	-Me	-Cl	3-F	4-trifluorometil-fenil-
2,211	-Me	-Cl	3-F	5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-il-
2,212	-Me	-Cl	3-F	5-metil-2-piridil-
2,213	-Me	-Cl	3-F	5-metil-3-piridil-
2,214	-Me	-Cl	3-F	6-cloro-3-piridil-
2,215	-Me	-Cl	3-F	6-metil-2-piridil-
2,216	-Me	-Cl	3-F	pirimidin-5-il-
2,217	-Me	-Cl	3-F	tiazol-2-il-
2,218	-Me	-Cl	3-F	tiazol-5-il-
2,219	-Me	-Cl	3-F	tiofen-3-il-
2,220	-Me	-Cl	3-Cl	-Ph
2,221	-Me	-Cl	3-Cl	1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-4-il-
2,222	-Me	-Cl	3-Cl	1-metil-pirazol-4-il-
2,223	-Me	-Cl	3-Cl	2-(metilsulfanil)-4-piridil-
2,224	-Me	-Cl	3-Cl	2-acetamido-4-piridil-
2,225	-Me	-Cl	3-Cl	2-acetamidotiazol-5-il-
2,226	-Me	-Cl	3-Cl	2-amino-4-piridil-
2,227	-Me	-Cl	3-Cl	2-cloro-3-piridil-
2,228	-Me	-Cl	3-Cl	2-cloro-4-piridil-
2,229	-Me	-Cl	3-Cl	2-clorotiazol-5-il-
2,230	-Me	-Cl	3-Cl	2-cianofenil-
2,231	-Me	-Cl	3-Cl	2-ciano-fenil-
2,232	-Me	-Cl	3-Cl	2-fluoro-4-piridil-
2,233	-Me	-Cl	3-Cl	2-metil-4-piridil-
2,234	-Me	-Cl	3-Cl	2-metil-triazol-4-il-
2,235	-Me	-Cl	3-Cl	2-tolil-
2,236	-Me	-Cl	3-Cl	2-trifluorometil-4-piridil-
2,237	-Me	-Cl	3-Cl	2-trifluorometil-fenil-
2,238	-Me	-Cl	3-Cl	3,4-difluoro-fenil-
2,239	-Me	-Cl	3-Cl	3,5-difluoro-fenil-
2,240	-Me	-Cl	3-Cl	3-cloro-4-fluoro-fenil-
2,241	-Me	-Cl	3-Cl	3-cloro-4-piridil-
2,242	-Me	-Cl	3-Cl	3-cianofenil-
2,243	-Me	-Cl	3-Cl	3-ciano-fenil-
2,244	-Me	-Cl	3-Cl	3-metil-2-piridil-
2,245	-Me	-Cl	3-Cl	3-metil-4-amino-fenil-
2,246	-Me	-Cl	3-Cl	3-piridil-
2,247	-Me	-Cl	3-Cl	3-tolil-
2,248	-Me	-Cl	3-Cl	3-trifluorometil-3-piridil-

N.º de compuesto	R ¹	R ²	Y	D
2,249	-Me	-Cl	3-Cl	3-trifluorometil-fenil-
2,250	-Me	-Cl	3-Cl	4-(dimetilamino)-fenil-
2,251	-Me	-Cl	3-Cl	4-(dimetilsulfamoil)fenil-
2,252	-Me	-Cl	3-Cl	4-(metilamino)-fenil-
2,253	-Me	-Cl	3-Cl	4-(metilsulfanil)fenil-
2,254	-Me	-Cl	3-Cl	4-(terc-butoxi)-fenil-
2,255	-Me	-Cl	3-Cl	4-(terc-butoxicarbonilamino)-3-fluorofenil-
2,256	-Me	-Cl	3-Cl	4-(trifluorometoxi)-fenil-
2,257	-Me	-Cl	3-Cl	4-[etil(metil)carbamoil]-3-fluoro-fenil-
2,258	-Me	-Cl	3-Cl	4-acetamidofenil-
2,259	-Me	-Cl	3-Cl	4-amino-3-metilfenil-
2,260	-Me	-Cl	3-Cl	4- amino-fenil-
2,261	-Me	-Cl	3-Cl	4-bifenil-
2,262	-Me	-Cl	3-Cl	4-carboxifenil-
2,263	-Me	-Cl	3-Cl	4-cloro-3-piridil-
2,264	-Me	-Cl	3-Cl	4-cloro-fenil-
2,265	-Me	-Cl	3-Cl	4-cianofenil-
2,266	-Me	-Cl	3-Cl	4-ciano-fenil-
2,267	-Me	-Cl	3-Cl	4-ciclopropilfenil-
2,268	-Me	-Cl	3-Cl	4-ciclopropil-fenil-
2,269	-Me	-Cl	3-Cl	4-dimetilaminofenil-
2,270	-Me	-Cl	3-Cl	4-fluoro-fenil-
2,271	-Me	-Cl	3-Cl	4-hidroxifenil-
2,272	-Me	-Cl	3-Cl	4-hidroxi-fenil-
2,273	-Me	-Cl	3-Cl	4-metoxicarbonilfenil-
2,274	-Me	-Cl	3-Cl	4-metil-2-piridil-
2,275	-Me	-Cl	3-Cl	4-metilaminofenil-
2,276	-Me	-Cl	3-Cl	4-metilsulfonilfenil-
2,277	-Me	-Cl	3-Cl	4-oxazol-5-ilfenil-
2,278	-Me	-Cl	3-Cl	4-piridil-
2,279	-Me	-Cl	3-Cl	4-terc-butoxifenil-
2,280	-Me	-Cl	3-Cl	4-terc-butilfenil-
2,281	-Me	-Cl	3-Cl	4-tolil-
2,282	-Me	-Cl	3-Cl	4-trifluorometil-3-piridil-
2,283	-Me	-Cl	3-Cl	4-trifluorometil-fenil-
2,284	-Me	-Cl	3-Cl	5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-il-
2,285	-Me	-Cl	3-Cl	5-metil-2-piridil-
2,286	-Me	-Cl	3-Cl	5-metil-3-piridil-
2,287	-Me	-Cl	3-Cl	6-cloro-3-piridil-
2,288	-Me	-Cl	3-Cl	6-metil-2-piridil-
2,289	-Me	-Cl	3-Cl	pirimidin-5-il-
2,290	-Me	-Cl	3-Cl	tiazol-2-il-
2,291	-Me	-Cl	3-Cl	tiazol-5-il-

N.º de compuesto	R ¹	R ²	Y	D
2,292	-Me	-Cl	3-Cl	tiofen-3-il-
2,293	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	-Ph
2,294	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-4-il-
2,295	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	1-metil-pirazol-4-il-
2,296	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	2-(metilsulfanil)-4-piridil-
2,297	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	2-acetamido-4-piridil-
2,298	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	2-acetamidotiazol-5-il-
2,299	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	2-amino-4-piridil-
2,300	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	2-cloro-3-piridil-
2,301	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	2-cloro-4-piridil-
2,302	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	2-clorotiazol-5-il-
2,303	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	2-cianofenil-
2,304	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	2-ciano-fenil-
2,305	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	2-fluoro-4-piridil-
2,306	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	2-metil-4-piridil-
2,307	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	2-metil-triazol-4-il-
2,308	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	2-tolil-
2,309	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	2-trifluorometil-4-piridil-
2,310	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	2-trifluorometil-fenil-
2,311	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	3,4-difluoro-fenil-
2,312	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	3,5-difluoro-fenil-
2,313	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	3-cloro-4-fluoro-fenil-
2,314	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	3-cloro-4-piridil-
2,315	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	3-cianofenil-
2,316	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	3-ciano-fenil-
2,317	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	3-metil-2-piridil-
2,318	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	3-metil-4-amino-fenil-
2,319	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	3-piridilo-
2,320	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	3-tolil-
2,321	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	3-trifluorometil-3-piridil-
2,322	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	3-trifluorometil-fenil-
2,323	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-(dimetilamino)-fenil-
2,324	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-(dimetilsulfamoi)fenil-
2,325	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-(metilamino)-fenil-
2,326	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-(metilsulfanil)fenil-
2,327	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-(terc-butoxi)-fenil-
2,328	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-(terc-butoxicarbonilamino)-3-fluorofenil-
2,329	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-(trifluorometoxi)-fenil-
2,330	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-[etil(metil)carbamoil]-3-fluoro-fenil-
2,331	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-acetamidofenil-
2,332	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-amino-3-metilfenil-
2,333	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4- amino-fenil-
2,334	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-bifenil-

N.º de compuesto	R ¹	R ²	Y	D
2,335	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-carboxifenil-
2,336	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-cloro-3-piridil-
2,337	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-cloro-fenil-
2,338	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-cianofenil-
2,339	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-ciano-fenil-
2,340	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-ciclopropilfenil-
2,341	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-ciclopropil-fenil-
2,342	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-dimetilaminofenil-
2,343	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-fluoro-fenil-
2,344	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-hidroxifenil-
2,345	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-hidroxi-fenil-
2,346	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-metoxycarbonilfenil-
2,347	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-metil-2-piridil-
2,348	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-metilaminofenil-
2,349	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-metilsulfonilfenil-
2,350	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-oxazol-5-ilfenil-
2,351	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-piridilo-
2,352	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-terc-butoxifenil-
2,353	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-terc-butilfenil-
2,354	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-tolil-
2,355	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-trifluorometil-3-piridil-
2,356	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-trifluorometil-fenil-
2,357	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-il-
2,358	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	5-metil-2-piridil-
2,359	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	5-metil-3-piridil-
2,360	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	6-cloro-3-piridil-
2,361	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	6-metil-2-piridil-
2,362	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	pirimidin-5-il-
2,363	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	tiazol-2-il-
2,364	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	tiazol-5-il-
2,365	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	tiofen-3-il-
2,366	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	-Ph
2,367	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-4-il-
2,368	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	1-metil-pirazol-4-il-
2,369	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	2-(metilsulfanil)-4-piridil-
2,370	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	2-acetamido-4-piridil-
2,371	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	2-acetamidotiazol-5-il-
2,372	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	2-amino-4-piridil-
2,373	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	2-cloro-3-piridil-
2,374	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	2-cloro-4-piridil-
2,375	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	2-clorotiazol-5-il-
2,376	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	2-cianofenil-
2,377	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	2-ciano-fenil-

N.º de compuesto	R ¹	R ²	Y	D
2,378	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	2-fluoro-4-piridil-
2,379	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	2-metil-4-piridil-
2,380	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	2-metil-triazol-4-il-
2,381	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	2-tolil-
2,382	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	2-trifluorometil-4-piridil-
2,383	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	2-trifluorometil-fenil-
2,384	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	3,4-difluoro-fenil-
2,385	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	3,5-difluoro-fenil-
2,386	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	3-cloro-4-fluoro-fenil-
2,387	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	3-cloro-4-piridil-
2,388	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	3-cianofenil-
2,389	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	3-ciano-fenil-
2,390	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	3-metil-2-piridil-
2,391	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	3-metil-4-amino-fenil-
2,392	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	3-piridil-
2,393	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	3-tolil-
2,394	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	3-trifluorometil-3-piridil-
2,395	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	3-trifluorometil-fenil-
2,396	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-(dimetilamino)-fenil-
2,397	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-(dimetilsulfamoil)-fenil-
2,398	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-(metilamino)-fenil-
2,399	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-(metilsulfanil)-fenil-
2,400	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-(terc-butoxi)-fenil-
2,401	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-(terc-butoxicarbonilamino)-3-fluorofenil-
2,402	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-(trifluorometoxi)-fenil-
2,403	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-[etil(metil)carbamoil]-3-fluoro-fenil-
2,404	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-acetamidofenil-
2,405	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-amino-3-metilfenil-
2,406	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-amino-fenil-
2,407	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-bifenil-
2,408	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-carboxifenil-
2,409	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-cloro-3-piridil-
2,410	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-cloro-fenil-
2,411	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-cianofenil-
2,412	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-ciano-fenil-
2,413	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-ciclopropilfenil-
2,414	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-ciclopropil-fenil-
2,415	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-dimetilaminofenil-
2,416	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-fluoro-fenil-
2,417	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-hidroxifenil-
2,418	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-hidroxi-fenil-
2,419	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-metoxicarbonilfenil-
2,420	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-metil-2-piridil-

N.º de compuesto	R ¹	R ²	Y	D
2,421	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-metilaminofenil-
2,422	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-metilsulfonilfenil-
2,423	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-oxazol-5-ilfenil-
2,424	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-piridil-
2,425	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-terc-butoxifenil-
2,426	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-terc-butilfenil-
2,427	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-tolil-
2,428	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-trifluorometil-3-piridil-
2,429	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-trifluorometil-fenil-
2,430	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-il-
2,431	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	5-metil-2-piridil-
2,432	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	5-metil-3-piridil-
2,433	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	6-cloro-3-piridil-
2,434	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	6-metil-2-piridil-
2,435	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	pirimidin-5-il-
2,436	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	tiazol-2-il-
2,437	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	tiazol-5-il-
2,438	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	tiofen-3-il-
2,439	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	-Ph
2,440	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-4-il-
2,441	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	1-metil-pirazol-4-il-
2,442	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	2-(metilsulfanil)-4-piridil-
2,443	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	2-acetamido-4-piridil-
2,444	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	2-acetamidotiazol-5-il-
2,445	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	2-amino-4-piridil-
2,446	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	2-cloro-3-piridil-
2,447	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	2-cloro-4-piridil-
2,448	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	2-clorotiazol-5-il-
2,449	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	2-cianofenil-
2,450	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	2-ciano-fenil-
2,451	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	2-fluoro-4-piridil-
2,452	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	2-metil-4-piridil-
2,453	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	2-metil-triazol-4-il-
2,454	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	2-tolil-
2,455	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	2-trifluorometil-4-piridil-
2,456	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	2-trifluorometil-fenil-
2,457	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	3,4-difluoro-fenil-
2,458	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	3,5-difluoro-fenil-
2,459	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	3-cloro-4-fluoro-fenil-
2,460	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	3-cloro-4-piridil-
2,461	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	3-cianofenil-
2,462	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	3-ciano-fenil-
2,463	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	3-metil-2-piridil-

N.º de compuesto	R ¹	R ²	Y	D
2,464	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	3-metil-4-amino-fenil-
2,465	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	3-piridilo-
2,466	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	3-tolil-
2,467	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	3-trifluorometil-3-piridil-
2,468	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	3-trifluorometil-fenil-
2,469	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-(dimetilamino)-fenil-
2,470	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-(dimetilsulfamoil)fenil-
2,471	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-(metilamino)-fenil-
2,472	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-(metilsulfanil)fenil-
2,473	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-(terc-butoxi)-fenil-
2,474	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-(terc-butoxicarbonilamino)-3-fluorofenil-
2,475	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-(trifluorometoxi)-fenil-
2,476	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-[etil(metil)carbamoil]-3-fluoro-fenil-
2,477	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-acetamidofenil-
2,478	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-amino-3-metilfenil-
2,479	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4- amino-fenil-
2,480	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-bifenil-
2,481	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-carboxifenil-
2,482	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-cloro-3-piridil-
2,483	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-cloro-fenil-
2,484	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-cianofenil-
2,485	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-ciano-fenil-
2,486	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-ciclopropilfenil-
2,487	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-ciclopropil-fenil-
2,488	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-dimetilaminofenil-
2,489	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-fluoro-fenil-
2,490	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-hidroxifenil-
2,491	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-hidroxi-fenil-
2,492	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-metoxicarbonilfenil-
2,493	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-metil-2-piridil-
2,494	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-metilaminofenil-
2,495	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-metilsulfonilfenil-
2,496	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-oxazol-5-ilfenil-
2,497	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-piridilo-
2,498	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-terc-butoxifenil-
2,499	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-terc-butilfenil-
2,500	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-tolil-
2,501	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-trifluorometil-3-piridil-
2,502	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-trifluorometil-fenil-
2,503	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-il-
2,504	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	5-metil-2-piridil-
2,505	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	5-metil-3-piridil-
2,506	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	6-cloro-3-piridil-

N.º de compuesto	R ¹	R ²	Y	D
2,507	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	6-metil-2-piridil-
2,508	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	pirimidin-5-il-
2,509	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	tiazol-2-il-
2,510	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	tiazol-5-il-
2,511	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	tiofen-3-il-
2,512	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	-Ph
2,513	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-4-il-
2,514	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	1-metil-pirazol-4-il-
2,515	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	2-(metilsulfanil)-4-piridil-
2,516	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	2-acetamido-4-piridil-
2,517	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	2-acetamidotiazol-5-il-
2,518	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	2-amino-4-piridil-
2,519	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	2-cloro-3-piridil-
2,520	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	2-cloro-4-piridil-
2,521	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	2-clorotiazol-5-il-
2,522	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	2-cianofenil-
2,523	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	2-ciano-fenil-
2,524	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	2-fluoro-4-piridil-
2,525	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	2-metil-4-piridil-
2,526	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	2-metil-triazol-4-il-
2,527	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	2-tolil-
2,528	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	2-trifluorometil-4-piridil-
2,529	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	2-trifluorometil-fenil-
2,530	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	3,4-difluoro-fenil-
2,531	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	3,5-difluoro-fenil-
2,532	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	3-cloro-4-fluoro-fenil-
2,533	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	3-cloro-4-piridil-
2,534	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	3-cianofenil-
2,535	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	3-ciano-fenil-
2,536	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	3-metil-2-piridil-
2,537	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	3-metil-4-amino-fenil-
2,538	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	3-piridil-
2,539	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	3-tolil-
2,540	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	3-trifluorometil-3-piridil-
2,541	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	3-trifluorometil-fenil-
2,542	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-(dimetilamino)-fenil-
2,543	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-(dimetilsulfamoil)fenil-
2,544	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-(metilamino)-fenil-
2,545	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-(metilsulfanil)fenil-
2,546	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-(terc-butoxi)-fenil-
2,547	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-(terc-butoxicarbonilamino)-3-fluorofenil-
2,548	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-(trifluorometoxi)-fenil-
2,549	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-[etil(metil)carbamoil]-3-fluoro-fenil-

N.º de compuesto	R ¹	R ²	Y	D
2,550	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-acetamidofenil-
2,551	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-amino-3-metilfenil-
2,552	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-amino-fenil-
2,553	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-bifenil-
2,554	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-carboxifenil-
2,555	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-cloro-3-piridil-
2,556	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-cloro-fenil-
2,557	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-cianofenil-
2,558	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-ciano-fenil-
2,559	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-ciclopropilfenil-
2,560	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-ciclopropil-fenil-
2,561	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-dimetilaminofenil-
2,562	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-fluoro-fenil-
2,563	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-hidroxifenil-
2,564	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-hidroxi-fenil-
2,565	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-metoxycarbonilfenil-
2,566	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-metil-2-piridil-
2,567	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-metilaminofenil-
2,568	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-metilsulfonilfenil-
2,569	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-oxazol-5-ilfenil-
2,570	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-piridil-
2,571	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-terc-butoxifenil-
2,572	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-terc-butilfenil-
2,573	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-tolil-
2,574	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-trifluorometil-3-piridil-
2,575	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-trifluorometil-fenil-
2,576	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-il-
2,577	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	5-metil-2-piridil-
2,578	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	5-metil-3-piridil-
2,579	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	6-cloro-3-piridil-
2,580	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	6-metil-2-piridil-
2,581	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	pirimidin-5-il-
2,582	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	tiazol-2-il-
2,583	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	tiazol-5-il-
2,584	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	tiofen-3-il-
2,585	-Me	-Me	3-F	4-(1-metilpirazol-3-il)fenil-
2,586	-Me	-Me	3-F	4-(5-metiltetrazol-1-il)fenil-
2,587	-Me	-Me	3-F	4-morfolinofenil-
2,588	-Me	-Me	3-F	4-(3-metilpirazol-1-il)fenil-
2,589	-Me	-Me	3-F	4-(3,5-dimetilpirazol-1-il)fenil-
2,590	-Me	-Me	3-F	4-pirazol-1-ilfenil-
2,591	-Me	-Me	3-F	4-pirrol-1-ilfenil-
2,592	-Me	-Me	3-F	4-(5-metiltetrahidrofuran-2-il)fenil-

N.º de compuesto	R ¹	R ²	Y	D
2,593	-Me	-Me	3-F	4-(5-metil-2-furil)fenil-
2,594	-Me	-Me	3-F	4-oxazol-2-ilfenil-
2,595	-Me	-Me	3-F	4-(2-metiltiazol-4-il)fenil-
2,596	-Me	-Me	3-F	4-(2-tienil)fenil-
2,597	-Me	-Me	3-F	4-(1,2,4-triazol-1-il)fenil-
2,598	-Me	-Me	3-F	1-fenil-4-pirazolil-
2,599	-Me	-Me	3-F	1-ciclopropil-4-pirazolil-
2,600	-Me	-Me	3-F	4-(metilsulfanilmetil)fenil-
2,601	-Me	-Me	3-F	4-(isopropilsulfanilmetil)fenil-
2,602	-Me	-Me	3-F	4-(metilsulfamoil)fenil-
2,603	-Me	-Me	3-F	4-sulfamoilfenil-
2,604	-Me	-Me	3-F	4-carbamoilfenil-
2,605	-Me	-Me	3-Cl	4-(1-metilpirazol-3-il)fenil-
2,606	-Me	-Me	3-Cl	4-(5-metiltetrazol-1-il)fenil-
2,607	-Me	-Me	3-Cl	4-morfolinofenil-
2,608	-Me	-Me	3-Cl	4-(3-metilpirazol-1-il)fenil-
2,609	-Me	-Me	3-Cl	4-(3,5-dimetilpirazol-1-il)fenil-
2,610	-Me	-Me	3-Cl	4-pirazol-1-ilfenil-
2,611	-Me	-Me	3-Cl	4-pirrol-1-ilfenil-
2,612	-Me	-Me	3-Cl	4-(5-metiltetrahidrofuran-2-il)fenil-
2,613	-Me	-Me	3-Cl	4-(5-metil-2-furil)fenil-
2,614	-Me	-Me	3-Cl	4-oxazol-2-ilfenil-
2,615	-Me	-Me	3-Cl	4-(2-metiltiazol-4-il)fenil-
2,616	-Me	-Me	3-Cl	4-(2-tienil)fenil-
2,617	-Me	-Me	3-Cl	4-(1,2,4-triazol-1-il)fenil-
2,618	-Me	-Me	3-Cl	1-fenil-4-pirazolil-
2,619	-Me	-Me	3-Cl	1-ciclopropil-4-pirazolil-
2,620	-Me	-Me	3-Cl	4-(metilsulfanilmetil)fenil-
2,621	-Me	-Me	3-Cl	4-(isopropilsulfanilmetil)fenil-
2,622	-Me	-Me	3-Cl	4-(metilsulfamoil)fenil-
2,623	-Me	-Me	3-Cl	4-sulfamoilfenil-
2,624	-Me	-Me	3-Cl	4-carbamoilfenil-
2,625	-Me	-Cl	3-F	4-(1-metilpirazol-3-il)fenil-
2,626	-Me	-Cl	3-F	4-(5-metiltetrazol-1-il)fenil-
2,627	-Me	-Cl	3-F	4-morfolinofenil-
2,628	-Me	-Cl	3-F	4-(3-metilpirazol-1-il)fenil-
2,629	-Me	-Cl	3-F	4-(3,5-dimetilpirazol-1-il)fenil-
2,630	-Me	-Cl	3-F	4-pirazol-1-ilfenil-
2,631	-Me	-Cl	3-F	4-pirrol-1-ilfenil-
2,632	-Me	-Cl	3-F	4-(5-metiltetrahidrofuran-2-il)fenil-
2,633	-Me	-Cl	3-F	4-(5-metil-2-furil)fenil-
2,634	-Me	-Cl	3-F	4-oxazol-2-ilfenil-
2,635	-Me	-Cl	3-F	4-(2-metiltiazol-4-il)fenil-

N.º de compuesto	R ¹	R ²	Y	D
2,636	-Me	-Cl	3-F	4-(2-tienil)fenil-
2,637	-Me	-Cl	3-F	4-(1,2,4-triazol-1-il)fenil-
2,638	-Me	-Cl	3-F	1-fenil-4-pirazolil-
2,639	-Me	-Cl	3-F	1-ciclopropil-4-pirazolil-
2,640	-Me	-Cl	3-F	4-(metilsulfanilmetil)fenil-
2,641	-Me	-Cl	3-F	4-(isopropilsulfanilmetil)fenil-
2,642	-Me	-Cl	3-F	4-(metilsulfamoil)fenil-
2,643	-Me	-Cl	3-F	4-sulfamoilfenil-
2,644	-Me	-Cl	3-F	4-carbamoilfenil-
2,645	-Me	-Cl	3-Cl	4-(1-metilpirazol-3-il)fenil-
2,646	-Me	-Cl	3-Cl	4-(5-metiltetrazol-1-il)fenil-
2,647	-Me	-Cl	3-Cl	4-morfolinofenil-
2,648	-Me	-Cl	3-Cl	4-(3-metilpirazol-1-il)fenil-
2,649	-Me	-Cl	3-Cl	4-(3,5-dimetilpirazol-1-il)fenil-
2,650	-Me	-Cl	3-Cl	4-pirazol-1-ilfenil-
2,651	-Me	-Cl	3-Cl	4-pirrol-1-ilfenil-
2,652	-Me	-Cl	3-Cl	4-(5-metiltetrahidrofuran-2-il)fenil-
2,653	-Me	-Cl	3-Cl	4-(5-metil-2-furil)fenil-
2,654	-Me	-Cl	3-Cl	4-oxazol-2-ilfenil-
2,655	-Me	-Cl	3-Cl	4-(2-metiltiazol-4-il)fenil-
2,656	-Me	-Cl	3-Cl	4-(2-tienil)fenil-
2,657	-Me	-Cl	3-Cl	4-(1,2,4-triazol-1-il)fenil-
2,658	-Me	-Cl	3-Cl	1-fenil-4-pirazolil-
2,659	-Me	-Cl	3-Cl	1-ciclopropil-4-pirazolil-
2,660	-Me	-Cl	3-Cl	4-(metilsulfanilmetil)fenil-
2,661	-Me	-Cl	3-Cl	4-(isopropilsulfanilmetil)fenil-
2,662	-Me	-Cl	3-Cl	4-(metilsulfamoil)fenil-
2,663	-Me	-Cl	3-Cl	4-sulfamoilfenil-
2,664	-Me	-Cl	3-Cl	4-carbamoilfenil-
2,665	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-(1-metilpirazol-3-il)fenil-
2,666	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-(5-metiltetrazol-1-il)fenil-
2,667	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-morfolinofenil-
2,668	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-(3-metilpirazol-1-il)fenil-
2,669	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-(3,5-dimetilpirazol-1-il)fenil-
2,670	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-pirazol-1-ilfenil-
2,671	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-pirrol-1-ilfenil-
2,672	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-(5-metiltetrahidrofuran-2-il)fenil-
2,673	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-(5-metil-2-furil)fenil-
2,674	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-oxazol-2-ilfenil-
2,675	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-(2-metiltiazol-4-il)fenil-
2,676	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-(2-tienil)fenil-
2,677	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-(1,2,4-triazol-1-il)fenil-
2,678	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	1-fenil-4-pirazolil-

N.º de compuesto	R ¹	R ²	Y	D
2,679	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	1-ciclopropil-4-pirazolil-
2,680	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-(metilsulfanilmetil)fenil-
2,681	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-(isopropilsulfanilmetil)fenil-
2,682	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-(metilsulfamoil)fenil-
2,683	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-sulfamoilfenil-
2,684	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-F	4-carbamoilfenil-
2,685	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-(1-metilpirazol-3-il)fenil-
2,686	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-(5-metiltetrazol-1-il)fenil-
2,687	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-morfolinofenil-
2,688	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-(3-metilpirazol-1-il)fenil-
2,689	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-(3,5-dimetilpirazol-1-il)fenil-
2,690	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-pirazol-1-ilfenil-
2,691	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-pirrol-1-ilfenil-
2,692	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-(5-metiltetrahidrofuran-2-il)fenil-
2,693	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-(5-metil-2-furil)fenil-
2,694	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-oxazol-2-ilfenil-
2,695	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-(2-metiltiazol-4-il)fenil-
2,696	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-(2-tienil)fenil-
2,697	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-(1,2,4-triazol-1-il)fenil-
2,698	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	1-fenil-4-pirazolil-
2,699	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	1-ciclopropil-4-pirazolil-
2,700	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-(metilsulfanilmetil)fenil-
2,701	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-(isopropilsulfanilmetil)fenil-
2,702	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-(metilsulfamoil)fenil-
2,703	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-sulfamoilfenil-
2,704	-CH ₂ -C≡CH	-Me	3-Cl	4-carbamoilfenil-
2,705	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-(1-metilpirazol-3-il)fenil-
2,706	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-(5-metiltetrazol-1-il)fenil-
2,707	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-morfolinofenil-
2,708	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-(3-metilpirazol-1-il)fenil-
2,709	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-(3,5-dimetilpirazol-1-il)fenil-
2,710	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-pirazol-1-ilfenil-
2,711	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-pirrol-1-ilfenil-
2,712	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-(5-metiltetrahidrofuran-2-il)fenil-
2,713	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-(5-metil-2-furil)fenil-
2,714	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-oxazol-2-ilfenil-
2,715	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-(2-metiltiazol-4-il)fenil-
2,716	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-(2-tienil)fenil-
2,717	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-(1,2,4-triazol-1-il)fenil-
2,718	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	1-fenil-4-pirazolil-
2,719	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	1-ciclopropil-4-pirazolil-
2,720	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-(metilsulfanilmetil)fenil-
2,721	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-(isopropilsulfanilmetil)fenil-

N.º de compuesto	R ¹	R ²	Y	D
2,722	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-(metilsulfamoil)fenil-
2,723	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-sulfamoilfenil-
2,724	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-F	4-carbamoilfenil-
2,725	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-(1-metilpirazol-3-il)fenil-
2,726	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-(5-metiltetrazol-1-il)fenil-
2,727	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-morfolinofenil-
2,728	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-(3-metilpirazol-1-il)fenil-
2,729	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-(3,5-dimetilpirazol-1-il)fenil-
2,730	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-pirazol-1-ilfenil-
2,731	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-pirrol-1-ilfenil-
2,732	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-(5-metiltetrahidrofuran-2-il)fenil-
2,733	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-(5-metil-2-furil)fenil-
2,734	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-oxazol-2-ilfenil-
2,735	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-(2-metiltiazol-4-il)fenil-
2,736	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-(2-tienil)fenil-
2,737	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-(1,2,4-triazol-1-il)fenil-
2,738	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	1-fenil-4-pirazolil-
2,739	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	1-ciclopropil-4-pirazolil-
2,740	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-(metilsulfanilmetil)fenil-
2,741	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-(isopropilsulfanilmetil)fenil-
2,742	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-(metilsulfamoil)fenil-
2,743	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-sulfamoilfenil-
2,744	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	3-Cl	4-carbamoilfenil-

La **Tabla B-2** proporciona 744 compuestos B-2.001 a B-2.744 de fórmula (I), en donde G es -H, W es (E)-CH=CH-, X es 6-ciclopropilo y R¹, R², Y, D son como se definió para los n.º de compuesto 2.001 a 2.744 respectivamente en la Tabla 2 anterior.

5

La **Tabla B-3** proporciona 744 compuestos B-3.001 a B-3.744 de fórmula (I), en donde G es -(C=O)iPr, W es -CH₂-CH₂-, X es 6-ciclopropilo y R¹, R², Y, D son como se definió para los n.º de compuesto 2.001 a 2.744 respectivamente en la Tabla 2 anterior.

10 La **Tabla B-4** proporciona 744 compuestos B-4.001 a B-4.744 de fórmula (I), en donde G es -(C=O)iPr, W es (E)-CH=CH-, X es 6-ciclopropilo y R¹, R², Y, D son como se definió para los n.º de compuesto 2.001 a 2.744 respectivamente en la Tabla 2 anterior.

15 La **Tabla C-1** proporciona 744 compuestos C-1.001 a C-1.744 de fórmula (I), en donde G es -H, W es -CH₂-CH₂-, Y es 3-ciclopropilo y R¹, R², Y y D son como se definió para los n.º de compuesto 3.001 a 3.744 respectivamente en la siguiente Tabla 3.

Tabla 3: Definiciones de sustituyentes de R¹, R², X y D:

N.º de compuesto	R ¹	R ²	X	D
3,001	-Me	-Me	6-F	-Ph
3,002	-Me	-Me	6-F	1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-4-il-
3,003	-Me	-Me	6-F	1-metil-pirazol-4-il-
3,004	-Me	-Me	6-F	2-(metilsulfanil)-4-piridil-
3,005	-Me	-Me	6-F	2-acetamido-4-piridil-
3,006	-Me	-Me	6-F	2-acetamidotiazol-5-il-

N.º de compuesto	R ¹	R ²	X	D
3,007	-Me	-Me	6-F	2-amino-4-piridil-
3,008	-Me	-Me	6-F	2-cloro-3-piridil-
3,009	-Me	-Me	6-F	2-cloro-4-piridil-
3,010	-Me	-Me	6-F	2-clorotiazol-5-il-
3,011	-Me	-Me	6-F	2-cianofenil-
3,012	-Me	-Me	6-F	2-ciano-fenil-
3,013	-Me	-Me	6-F	2-fluoro-4-piridil-
3,014	-Me	-Me	6-F	2-metil-4-piridil-
3,015	-Me	-Me	6-F	2-metil-triazol-4-il-
3,016	-Me	-Me	6-F	2-tolil-
3,017	-Me	-Me	6-F	2-trifluorometil-4-piridil-
3,018	-Me	-Me	6-F	2-trifluorometil-fenil-
3,019	-Me	-Me	6-F	3,4-difluoro-fenil-
3,020	-Me	-Me	6-F	3,5-difluoro-fenil-
3,021	-Me	-Me	6-F	3-cloro-4-fluoro-fenil-
3,022	-Me	-Me	6-F	3-cloro-4-piridil-
3,023	-Me	-Me	6-F	3-cianofenil-
3,024	-Me	-Me	6-F	3-ciano-fenil-
3,025	-Me	-Me	6-F	3-metil-2-piridil-
3,026	-Me	-Me	6-F	3-metil-4-amino-fenil-
3,027	-Me	-Me	6-F	3-piridilo-
3,028	-Me	-Me	6-F	3-tolil-
3,029	-Me	-Me	6-F	3-trifluorometil-3-piridil-
3,030	-Me	-Me	6-F	3-trifluorometil-fenil-
3,031	-Me	-Me	6-F	4-(dimetilamino)-fenil-
3,032	-Me	-Me	6-F	4-(dimetilsulfamoi)fenil-
3,033	-Me	-Me	6-F	4-(metilamino)-fenil-
3,034	-Me	-Me	6-F	4-(metilsulfanil)fenil-
3,035	-Me	-Me	6-F	4-(terc-butoxi)-fenil-
3,036	-Me	-Me	6-F	4-(terc-butoxicarbonilamino)-3-fluoro-2-fenil-
3,037	-Me	-Me	6-F	4-(trifluorometoxi)-fenil-
3,038	-Me	-Me	6-F	4-[etil(metil)carbamoil]-3-fluoro-fenil-
3,039	-Me	-Me	6-F	4-acetamidofenil-
3,040	-Me	-Me	6-F	4-amino-3-metilfenil-
3,041	-Me	-Me	6-F	4- amino-fenil-
3,042	-Me	-Me	6-F	4-bifenil-
3,043	-Me	-Me	6-F	4-carboxifenil-
3,044	-Me	-Me	6-F	4-cloro-3-piridil-
3,045	-Me	-Me	6-F	4-cloro-fenil-
3,046	-Me	-Me	6-F	4-cianofenil-
3,047	-Me	-Me	6-F	4-ciano-fenil-
3,048	-Me	-Me	6-F	4-ciclopropilfenil-
3,049	-Me	-Me	6-F	4-ciclopropil-fenil-

N.º de compuesto	R ¹	R ²	X	D
3,050	-Me	-Me	6-F	4-dimetilaminofenil-
3,051	-Me	-Me	6-F	4-fluoro-fenil-
3,052	-Me	-Me	6-F	4-hidroxifenil-
3,053	-Me	-Me	6-F	4-hidroxi-fenil-
3,054	-Me	-Me	6-F	4-metoxycarbonilfenil-
3,055	-Me	-Me	6-F	4-metil-2-piridil-
3,056	-Me	-Me	6-F	4-metilaminofenil-
3,057	-Me	-Me	6-F	4-metilsulfonilfenil-
3,058	-Me	-Me	6-F	4-oxazol-5-ilfenil-
3,059	-Me	-Me	6-F	4-piridilo-
3,060	-Me	-Me	6-F	4-terc-butoxifenil-
3,061	-Me	-Me	6-F	4-terc-butilfenil-
3,062	-Me	-Me	6-F	4-tolil-
3,063	-Me	-Me	6-F	4-trifluorometil-3-piridil-
3,064	-Me	-Me	6-F	4-trifluorometil-fenil-
3,065	-Me	-Me	6-F	5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-il-
3,066	-Me	-Me	6-F	5-metil-2-piridil-
3,067	-Me	-Me	6-F	5-metil-3-piridil-
3,068	-Me	-Me	6-F	6-cloro-3-piridil-
3,069	-Me	-Me	6-F	6-metil-2-piridil-
3,070	-Me	-Me	6-F	pirimidin-5-il-
3,071	-Me	-Me	6-F	tiazol-2-il-
3,072	-Me	-Me	6-F	tiazol-5-il-
3,073	-Me	-Me	6-F	tiofen-3-il-
3,074	-Me	-Me	6-Cl	-Ph
3,075	-Me	-Me	6-Cl	1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-4-il-
3,076	-Me	-Me	6-Cl	1-metil-pirazol-4-il-
3,077	-Me	-Me	6-Cl	2-(metilsulfanil)-4-piridil-
3,078	-Me	-Me	6-Cl	2-acetamido-4-piridil-
3,079	-Me	-Me	6-Cl	2-acetamidotiazol-5-il-
3,080	-Me	-Me	6-Cl	2-amino-4-piridil-
3,081	-Me	-Me	6-Cl	2-cloro-3-piridil-
3,082	-Me	-Me	6-Cl	2-cloro-4-piridil-
3,083	-Me	-Me	6-Cl	2-clorotiazol-5-il-
3,084	-Me	-Me	6-Cl	2-cianofenil-
3,085	-Me	-Me	6-Cl	2-ciano-fenil-
3,086	-Me	-Me	6-Cl	2-fluoro-4-piridil-
3,087	-Me	-Me	6-Cl	2-metil-4-piridil-
3,088	-Me	-Me	6-Cl	2-metil-triazol-4-il-
3,089	-Me	-Me	6-Cl	2-tolil-
3,090	-Me	-Me	6-Cl	2-trifluorometil-4-piridil-
3,091	-Me	-Me	6-Cl	2-trifluorometil-fenil-
3,092	-Me	-Me	6-Cl	3,4-difluoro-fenil-

N.º de compuesto	R ¹	R ²	X	D
3,093	-Me	-Me	6-Cl	3,5-difluoro-fenil-
3,094	-Me	-Me	6-Cl	3-cloro-4-fluoro-fenil-
3,095	-Me	-Me	6-Cl	3-cloro-4-piridil-
3,096	-Me	-Me	6-Cl	3-cianofenil-
3,097	-Me	-Me	6-Cl	3-ciano-fenil-
3,098	-Me	-Me	6-Cl	3-metil-2-piridil-
3,099	-Me	-Me	6-Cl	3-metil-4-amino-fenil-
3,100	-Me	-Me	6-Cl	3-piridil-
3,101	-Me	-Me	6-Cl	3-tolil-
3,102	-Me	-Me	6-Cl	3-trifluorometil-3-piridil-
3,103	-Me	-Me	6-Cl	3-trifluorometil-fenil-
3,104	-Me	-Me	6-Cl	4-(dimetilamino)-fenil-
3,105	-Me	-Me	6-Cl	4-(dimetilsulfamoil)fenil-
3,106	-Me	-Me	6-Cl	4-(metilamino)-fenil-
3,107	-Me	-Me	6-Cl	4-(metilsulfanil)fenil-
3,108	-Me	-Me	6-Cl	4-(terc-butoxi)-fenil-
3,109	-Me	-Me	6-Cl	4-(terc-butoxicarbonilamino)-3-fluoro-2-fenil-
3,110	-Me	-Me	6-Cl	4-(trifluorometoxi)-fenil-
3,111	-Me	-Me	6-Cl	4-[etil(metil)carbamoil]-3-fluoro-fenil-
3,112	-Me	-Me	6-Cl	4-acetamidofenil-
3,113	-Me	-Me	6-Cl	4-amino-3-metilfenil-
3,114	-Me	-Me	6-Cl	4-amino-fenil-
3,115	-Me	-Me	6-Cl	4-bifenil-
3,116	-Me	-Me	6-Cl	4-carboxifenil-
3,117	-Me	-Me	6-Cl	4-cloro-3-piridil-
3,118	-Me	-Me	6-Cl	4-cloro-fenil-
3,119	-Me	-Me	6-Cl	4-cianofenil-
3,120	-Me	-Me	6-Cl	4-ciano-fenil-
3,121	-Me	-Me	6-Cl	4-ciclopropilfenil-
3,122	-Me	-Me	6-Cl	4-ciclopropil-fenil-
3,123	-Me	-Me	6-Cl	4-dimetilaminofenil-
3,124	-Me	-Me	6-Cl	4-fluoro-fenil-
3,125	-Me	-Me	6-Cl	4-hidroxifenil-
3,126	-Me	-Me	6-Cl	4-hidroxi-fenil-
3,127	-Me	-Me	6-Cl	4-metoxicarbonilfenil-
3,128	-Me	-Me	6-Cl	4-metil-2-piridil-
3,129	-Me	-Me	6-Cl	4-metilaminofenil-
3,130	-Me	-Me	6-Cl	4-metilsulfonilfenil-
3,131	-Me	-Me	6-Cl	4-oxazol-5-ilfenil-
3,132	-Me	-Me	6-Cl	4-piridil-
3,133	-Me	-Me	6-Cl	4-terc-butoxifenil-
3,134	-Me	-Me	6-Cl	4-terc-butilfenil-
3,135	-Me	-Me	6-Cl	4-tolil-

N.º de compuesto	R ¹	R ²	X	D
3,136	-Me	-Me	6-Cl	4-trifluorometil-3-piridil-
3,137	-Me	-Me	6-Cl	4-trifluorometil-fenil-
3,138	-Me	-Me	6-Cl	5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-il-
3,139	-Me	-Me	6-Cl	5-metil-2-piridil-
3,140	-Me	-Me	6-Cl	5-metil-3-piridil-
3,141	-Me	-Me	6-Cl	6-cloro-3-piridil-
3,142	-Me	-Me	6-Cl	6-metil-2-piridil-
3,143	-Me	-Me	6-Cl	pirimidin-5-il-
3,144	-Me	-Me	6-Cl	tiazol-2-il-
3,145	-Me	-Me	6-Cl	tiazol-5-il-
3,146	-Me	-Me	6-Cl	tiofen-3-il-
3,147	-Me	-Cl	6-F	-Ph
3,148	-Me	-Cl	6-F	1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-4-il-
3,149	-Me	-Cl	6-F	1-metil-pirazol-4-il-
3,150	-Me	-Cl	6-F	2-(metilsulfanil)-4-piridil-
3,151	-Me	-Cl	6-F	2-acetamido-4-piridil-
3,152	-Me	-Cl	6-F	2-acetamidotiazol-5-il-
3,153	-Me	-Cl	6-F	2-amino-4-piridil-
3,154	-Me	-Cl	6-F	2-cloro-3-piridil-
3,155	-Me	-Cl	6-F	2-cloro-4-piridil-
3,156	-Me	-Cl	6-F	2-clorotiazol-5-il-
3,157	-Me	-Cl	6-F	2-cianofenil-
3,158	-Me	-Cl	6-F	2-ciano-fenil-
3,159	-Me	-Cl	6-F	2-fluoro-4-piridil-
3,160	-Me	-Cl	6-F	2-metil-4-piridil-
3,161	-Me	-Cl	6-F	2-metil-triazol-4-il-
3,162	-Me	-Cl	6-F	2-tolil-
3,163	-Me	-Cl	6-F	2-trifluorometil-4-piridil-
3,164	-Me	-Cl	6-F	2-trifluorometil-fenil-
3,165	-Me	-Cl	6-F	3,4-difluoro-fenil-
3,166	-Me	-Cl	6-F	3,5-difluoro-fenil-
3,167	-Me	-Cl	6-F	3-cloro-4-fluoro-fenil-
3,168	-Me	-Cl	6-F	3-cloro-4-piridil-
3,169	-Me	-Cl	6-F	3-cianofenil-
3,170	-Me	-Cl	6-F	3-ciano-fenil-
3,171	-Me	-Cl	6-F	3-metil-2-piridil-
3,172	-Me	-Cl	6-F	3-metil-4-amino-fenil-
3,173	-Me	-Cl	6-F	3-piridilo-
3,174	-Me	-Cl	6-F	3-tolil-
3,175	-Me	-Cl	6-F	3-trifluorometil-3-piridil-
3,176	-Me	-Cl	6-F	3-trifluorometil-fenil-
3,177	-Me	-Cl	6-F	4-(dimetilamino)-fenil-
3,178	-Me	-Cl	6-F	4-(dimetilsulfamoi)fenil-

N.º de compuesto	R ¹	R ²	X	D
3,179	-Me	-Cl	6-F	4-(metilamino)-fenil-
3,180	-Me	-Cl	6-F	4-(metilsulfanil)fenil-
3,181	-Me	-Cl	6-F	4-(terc-butoxi)-fenil-
3,182	-Me	-Cl	6-F	4-(terc-butoxicarbonilamino)-3-fluoro-2-fenil-
3,183	-Me	-Cl	6-F	4-(trifluorometoxi)-fenil-
3,184	-Me	-Cl	6-F	4-[etil(metil)carbamoil]-3-fluoro-fenil-
3,185	-Me	-Cl	6-F	4-acetamidofenil-
3,186	-Me	-Cl	6-F	4-amino-3-metilfenil-
3,187	-Me	-Cl	6-F	4- amino-fenil-
3,188	-Me	-Cl	6-F	4-bifenil-
3,189	-Me	-Cl	6-F	4-carboxifenil-
3,190	-Me	-Cl	6-F	4-cloro-3-piridil-
3,191	-Me	-Cl	6-F	4-cloro-fenil-
3,192	-Me	-Cl	6-F	4-cianofenil-
3,193	-Me	-Cl	6-F	4-ciano-fenil-
3,194	-Me	-Cl	6-F	4-ciclopropilfenil-
3,195	-Me	-Cl	6-F	4-ciclopropil-fenil-
3,196	-Me	-Cl	6-F	4-dimetilaminofenil-
3,197	-Me	-Cl	6-F	4-fluoro-fenil-
3,198	-Me	-Cl	6-F	4-hidroxifenil-
3,199	-Me	-Cl	6-F	4-hidroxi-fenil-
3,200	-Me	-Cl	6-F	4-metoxicarbonilfenil-
3,201	-Me	-Cl	6-F	4-metil-2-piridil-
3,202	-Me	-Cl	6-F	4-metilaminofenil-
3,203	-Me	-Cl	6-F	4-metilsulfonilfenil-
3,204	-Me	-Cl	6-F	4-oxazol-5-il-fenil-
3,205	-Me	-Cl	6-F	4-piridilo-
3,206	-Me	-Cl	6-F	4-terc-butoxifenil-
3,207	-Me	-Cl	6-F	4-terc-butilfenil-
3,208	-Me	-Cl	6-F	4-tolil-
3,209	-Me	-Cl	6-F	4-trifluorometil-3-piridil-
3,210	-Me	-Cl	6-F	4-trifluorometil-fenil-
3,211	-Me	-Cl	6-F	5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-il-
3,212	-Me	-Cl	6-F	5-metil-2-piridil-
3,213	-Me	-Cl	6-F	5-metil-3-piridil-
3,214	-Me	-Cl	6-F	6-cloro-3-piridil-
3,215	-Me	-Cl	6-F	6-metil-2-piridil-
3,216	-Me	-Cl	6-F	pirimidin-5-il-
3,217	-Me	-Cl	6-F	tiazol-2-il-
3,218	-Me	-Cl	6-F	tiazol-5-il-
3,219	-Me	-Cl	6-F	tiofen-3-il-
3,220	-Me	-Cl	6-Cl	-Ph
3,221	-Me	-Cl	6-Cl	1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-4-il-

N.º de compuesto	R ¹	R ²	X	D
3,222	-Me	-Cl	6-Cl	1-metil-pirazol-4-il-
3,223	-Me	-Cl	6-Cl	2-(metilsulfanil)-4-piridil-
3,224	-Me	-Cl	6-Cl	2-acetamido-4-piridil-
3,225	-Me	-Cl	6-Cl	2-acetamidotiazol-5-il-
3,226	-Me	-Cl	6-Cl	2-amino-4-piridil-
3,227	-Me	-Cl	6-Cl	2-cloro-3-piridil-
3,228	-Me	-Cl	6-Cl	2-cloro-4-piridil-
3,229	-Me	-Cl	6-Cl	2-clorotiazol-5-il-
3,230	-Me	-Cl	6-Cl	2-cianofenil-
3,231	-Me	-Cl	6-Cl	2-ciano-fenil-
3,232	-Me	-Cl	6-Cl	2-fluoro-4-piridil-
3,233	-Me	-Cl	6-Cl	2-metil-4-piridil-
3,234	-Me	-Cl	6-Cl	2-metil-triazol-4-il-
3,235	-Me	-Cl	6-Cl	2-tolil-
3,236	-Me	-Cl	6-Cl	2-trifluorometil-4-piridil-
3,237	-Me	-Cl	6-Cl	2-trifluorometil-fenil-
3,238	-Me	-Cl	6-Cl	3,4-difluoro-fenil-
3,239	-Me	-Cl	6-Cl	3,5-difluoro-fenil-
3,240	-Me	-Cl	6-Cl	3-cloro-4-fluoro-fenil-
3,241	-Me	-Cl	6-Cl	3-cloro-4-piridil-
3,242	-Me	-Cl	6-Cl	3-cianofenil-
3,243	-Me	-Cl	6-Cl	3-ciano-fenil-
3,244	-Me	-Cl	6-Cl	3-metil-2-piridil-
3,245	-Me	-Cl	6-Cl	3-metil-4-amino-fenil-
3,246	-Me	-Cl	6-Cl	3-piridil-
3,247	-Me	-Cl	6-Cl	3-tolil-
3,248	-Me	-Cl	6-Cl	3-trifluorometil-3-piridil-
3,249	-Me	-Cl	6-Cl	3-trifluorometil-fenil-
3,250	-Me	-Cl	6-Cl	4-(dimetilamino)-fenil-
3,251	-Me	-Cl	6-Cl	4-(dimetilsulfamoil)fenil-
3,252	-Me	-Cl	6-Cl	4-(metilamino)-fenil-
3,253	-Me	-Cl	6-Cl	4-(metilsulfanil)fenil-
3,254	-Me	-Cl	6-Cl	4-(terc-butoxi)-fenil-
3,255	-Me	-Cl	6-Cl	4-(terc-butoxicarbonilamino)-3-fluoro-2-fenil-
3,256	-Me	-Cl	6-Cl	4-(trifluorometoxi)-fenil-
3,257	-Me	-Cl	6-Cl	4-[etil(metil)carbamoil]-3-fluoro-fenil-
3,258	-Me	-Cl	6-Cl	4-acetamidofenil-
3,259	-Me	-Cl	6-Cl	4-amino-3-metilfenil-
3,260	-Me	-Cl	6-Cl	4-amino-fenil-
3,261	-Me	-Cl	6-Cl	4-bifenil-
3,262	-Me	-Cl	6-Cl	4-carboxifenil-
3,263	-Me	-Cl	6-Cl	4-cloro-3-piridil-
3,264	-Me	-Cl	6-Cl	4-cloro-fenil-

N.º de compuesto	R ¹	R ²	X	D
3,265	-Me	-Cl	6-Cl	4-cianofenil-
3,266	-Me	-Cl	6-Cl	4-ciano-fenil-
3,267	-Me	-Cl	6-Cl	4-ciclopropilfenil-
3,268	-Me	-Cl	6-Cl	4-ciclopropil-fenil-
3,269	-Me	-Cl	6-Cl	4-dimetilaminofenil-
3,270	-Me	-Cl	6-Cl	4-fluoro-fenil-
3,271	-Me	-Cl	6-Cl	4-hidroxifenil-
3,272	-Me	-Cl	6-Cl	4-hidroxi-fenil-
3,273	-Me	-Cl	6-Cl	4-metoxicarbonilfenil-
3,274	-Me	-Cl	6-Cl	4-metil-2-piridil-
3,275	-Me	-Cl	6-Cl	4-metilaminofenil-
3,276	-Me	-Cl	6-Cl	4-metilsulfonilfenil-
3,277	-Me	-Cl	6-Cl	4-oxazol-5-ilfenil-
3,278	-Me	-Cl	6-Cl	4-piridil-
3,279	-Me	-Cl	6-Cl	4-terc-butoxifenil-
3,280	-Me	-Cl	6-Cl	4-terc-butilfenil-
3,281	-Me	-Cl	6-Cl	4-tolil-
3,282	-Me	-Cl	6-Cl	4-trifluorometil-3-piridil-
3,283	-Me	-Cl	6-Cl	4-trifluorometil-fenil-
3,284	-Me	-Cl	6-Cl	5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-il-
3,285	-Me	-Cl	6-Cl	5-metil-2-piridil-
3,286	-Me	-Cl	6-Cl	5-metil-3-piridil-
3,287	-Me	-Cl	6-Cl	6-cloro-3-piridil-
3,288	-Me	-Cl	6-Cl	6-metil-2-piridil-
3,289	-Me	-Cl	6-Cl	pirimidin-5-il-
3,290	-Me	-Cl	6-Cl	tiazol-2-il-
3,291	-Me	-Cl	6-Cl	tiazol-5-il-
3,292	-Me	-Cl	6-Cl	tiofen-3-il-
3,293	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	-Ph
3,294	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-4-il-
3,295	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	1-metil-pirazol-4-il-
3,296	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	2-(metilsulfanil)-4-piridil-
3,297	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	2-acetamido-4-piridil-
3,298	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	2-acetamidotiazol-5-il-
3,299	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	2-amino-4-piridil-
3,300	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	2-cloro-3-piridil-
3,301	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	2-cloro-4-piridil-
3,302	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	2-clorotiazol-5-il-
3,303	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	2-cianofenil-
3,304	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	2-ciano-fenil-
3,305	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	2-fluoro-4-piridil-
3,306	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	2-metil-4-piridil-
3,307	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	2-metil-triazol-4-il-

N.º de compuesto	R ¹	R ²	X	D
3,308	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	2-tolil-
3,309	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	2-trifluorometil-4-piridil-
3,310	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	2-trifluorometil-fenil-
3,311	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3,4-difluoro-fenil-
3,312	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3,5-difluoro-fenil-
3,313	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-cloro-4-fluoro-fenil-
3,314	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-cloro-4-piridil-
3,315	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-cianofenil-
3,316	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-ciano-fenil-
3,317	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-metil-2-piridil-
3,318	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-metil-4-amino-fenil-
3,319	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-piridilo-
3,320	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-tolil-
3,321	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-trifluorometil-3-piridil-
3,322	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	3-trifluorometil-fenil-
3,323	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-(dimetilamino)-fenil-
3,324	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-(dimetilsulfamoil)fenil-
3,325	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-(metilamino)-fenil-
3,326	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-(metilsulfanil)fenil-
3,327	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-(terc-butoxi)-fenil-
3,328	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-(terc-butoxicarbonilamino)-3-fluoro-2-fenil-
3,329	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-(trifluorometoxi)-fenil-
3,330	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-[etil(metil)carbamoil]-3-fluoro-fenil-
3,331	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-acetamidofenil-
3,332	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-amino-3-metilfenil-
3,333	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-amino-fenil-
3,334	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-bifenil-
3,335	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-carboxifenil-
3,336	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-cloro-3-piridil-
3,337	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-cloro-fenil-
3,338	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-cianofenil-
3,339	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-ciano-fenil-
3,340	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-ciclopropilfenil-
3,341	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-ciclopropil-fenil-
3,342	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-dimetilaminofenil-
3,343	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-fluoro-fenil-
3,344	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-hidroxifenil-
3,345	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-hidroxi-fenil-
3,346	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-metoxicarbonilfenil-
3,347	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-metil-2-piridil-
3,348	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-metilaminofenil-
3,349	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-metilsulfonilfenil-
3,350	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-oxazol-5-ilfenil-

N.º de compuesto	R ¹	R ²	X	D
3,351	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-piridilo-
3,352	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-terc-butoxifenil-
3,353	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-terc-butilfenil-
3,354	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-tolil-
3,355	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-trifluorometil-3-piridil-
3,356	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-trifluorometil-fenil-
3,357	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-il-
3,358	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	5-metil-2-piridil-
3,359	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	5-metil-3-piridil-
3,360	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	6-cloro-3-piridil-
3,361	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	6-metil-2-piridil-
3,362	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	pirimidin-5-il-
3,363	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	tiazol-2-il-
3,364	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	tiazol-5-il-
3,365	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	tiofen-3-il-
3,366	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	-Ph
3,367	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-4-il-
3,368	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	1-metil-pirazol-4-il-
3,369	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	2-(metilsulfanil)-4-piridil-
3,370	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	2-acetamido-4-piridil-
3,371	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	2-acetamidotiazol-5-il-
3,372	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	2-amino-4-piridil-
3,373	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	2-cloro-3-piridil-
3,374	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	2-cloro-4-piridil-
3,375	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	2-clorotiazol-5-il-
3,376	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	2-cianofenil-
3,377	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	2-ciano-fenil-
3,378	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	2-fluoro-4-piridil-
3,379	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	2-metil-4-piridil-
3,380	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	2-metil-triazol-4-il-
3,381	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	2-tolil-
3,382	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	2-trifluorometil-4-piridil-
3,383	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	2-trifluorometil-fenil-
3,384	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3,4-difluoro-fenil-
3,385	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3,5-difluoro-fenil-
3,386	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-cloro-4-fluoro-fenil-
3,387	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-cloro-4-piridil-
3,388	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-cianofenil-
3,389	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-ciano-fenil-
3,390	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-metil-2-piridil-
3,391	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-metil-4-amino-fenil-
3,392	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-piridil-
3,393	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-tolil-

N.º de compuesto	R ¹	R ²	X	D
3,394	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-trifluorometil-3-piridil-
3,395	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	3-trifluorometil-fenil-
3,396	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-(dimetilamino)-fenil-
3,397	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-(dimetilsulfamoil)fenil-
3,398	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-(metilamino)-fenil-
3,399	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-(metilsulfanil)fenil-
3,400	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-(terc-butoxi)-fenil-
3,401	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-(terc-butoxicarbonilamino)-3-fluoro-2-fenil-
3,402	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-(trifluorometoxi)-fenil-
3,403	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-[etil(metil)carbamoil]-3-fluoro-fenil-
3,404	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-acetamidofenil-
3,405	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-amino-3-metilfenil-
3,406	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-amino-fenil-
3,407	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-bifenil-
3,408	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-carboxifenil-
3,409	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-cloro-3-piridil-
3,410	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-cloro-fenil-
3,411	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-cianofenil-
3,412	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-ciano-fenil-
3,413	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-ciclopropilfenil-
3,414	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-ciclopropil-fenil-
3,415	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-dimetilaminofenil-
3,416	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-fluoro-fenil-
3,417	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-hidroxifenil-
3,418	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-hidroxi-fenil-
3,419	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-metoxicarbonilfenil-
3,420	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-metil-2-piridil-
3,421	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-metilaminofenil-
3,422	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-metilsulfonilfenil-
3,423	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-oxazol-5-ilfenil-
3,424	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-piridil-
3,425	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-terc-butoxifenil-
3,426	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-terc-butilfenil-
3,427	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-tolil-
3,428	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-trifluorometil-3-piridil-
3,429	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-trifluorometil-fenil-
3,430	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-il-
3,431	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	5-metil-2-piridil-
3,432	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	5-metil-3-piridil-
3,433	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	6-cloro-3-piridil-
3,434	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	6-metil-2-piridil-
3,435	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	pirimidin-5-il-
3,436	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	tiazol-2-il-

N.º de compuesto	R ¹	R ²	X	D
3,437	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	tiazol-5-il-
3,438	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	tiofen-3-il-
3,439	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	-Ph
3,440	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-4-il-
3,441	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	1-metil-pirazol-4-il-
3,442	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	2-(metilsulfanil)-4-piridil-
3,443	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	2-acetamido-4-piridil-
3,444	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	2-acetamidotiazol-5-il-
3,445	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	2-amino-4-piridil-
3,446	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	2-cloro-3-piridil-
3,447	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	2-cloro-4-piridil-
3,448	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	2-clorotiazol-5-il-
3,449	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	2-cianofenil-
3,450	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	2-ciano-fenil-
3,451	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	2-fluoro-4-piridil-
3,452	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	2-metil-4-piridil-
3,453	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	2-metil-triazol-4-il-
3,454	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	2-tolil-
3,455	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	2-trifluorometil-4-piridil-
3,456	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	2-trifluorometil-fenil-
3,457	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3,4-difluoro-fenil-
3,458	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3,5-difluoro-fenil-
3,459	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-cloro-4-fluoro-fenil-
3,460	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-cloro-4-piridil-
3,461	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-cianofenil-
3,462	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-ciano-fenil-
3,463	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-metil-2-piridil-
3,464	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-metil-4-amino-fenil-
3,465	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-piridilo-
3,466	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-tolil-
3,467	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-trifluorometil-3-piridil-
3,468	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	3-trifluorometil-fenil-
3,469	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-(dimetilamino)-fenil-
3,470	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-(dimetilsulfamoil)fenil-
3,471	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-(metilamino)-fenil-
3,472	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-(metilsulfanil)fenil-
3,473	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-(terc-butoxi)-fenil-
3,474	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-(terc-butoxicarbonilamino)-3-fluoro-2-fenil-
3,475	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-(trifluorometoxi)-fenil-
3,476	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-[etil(metil)carbamoil]-3-fluoro-fenil-
3,477	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-acetamidofenil-
3,478	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-amino-3-metilfenil-
3,479	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-amino-fenil-

N.º de compuesto	R ¹	R ²	X	D
3,480	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-bifenil-
3,481	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-carboxifenil-
3,482	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-cloro-3-piridil-
3,483	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-cloro-fenil-
3,484	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-cianofenil-
3,485	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-ciano-fenil-
3,486	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-ciclopropilfenil-
3,487	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-ciclopropil-fenil-
3,488	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-dimetilaminofenil-
3,489	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-fluoro-fenil-
3,490	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-hidroxifenil-
3,491	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-hidroxi-fenil-
3,492	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-metoxicarbonilfenil-
3,493	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-metil-2-piridil-
3,494	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-metilaminofenil-
3,495	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-metilsulfonilfenil-
3,496	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-oxazol-5-ilfenil-
3,497	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-piridilo-
3,498	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-terc-butoxifenil-
3,499	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-terc-butilfenil-
3,500	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-tolil-
3,501	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-trifluorometil-3-piridil-
3,502	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-trifluorometil-fenil-
3,503	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-il-
3,504	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	5-metil-2-piridil-
3,505	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	5-metil-3-piridil-
3,506	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	6-cloro-3-piridil-
3,507	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	6-metil-2-piridil-
3,508	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	pirimidin-5-il-
3,509	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	tiazol-2-il-
3,510	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	tiazol-5-il-
3,511	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	tiofen-3-il-
3,512	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	-Ph
3,513	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	1-metil-3-(trifluorometil)pirazol-4-il-
3,514	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	1-metil-pirazol-4-il-
3,515	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	2-(metilsulfanil)-4-piridil-
3,516	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	2-acetamido-4-piridil-
3,517	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	2-acetamidotiazol-5-il-
3,518	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	2-amino-4-piridil-
3,519	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	2-cloro-3-piridil-
3,520	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	2-cloro-4-piridil-
3,521	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	2-clorotiazol-5-il-
3,522	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	2-cianofenil-

N.º de compuesto	R ¹	R ²	X	D
3,523	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	2-ciano-fenil-
3,524	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	2-fluoro-4-piridil-
3,525	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	2-metil-4-piridil-
3,526	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	2-metil-triazol-4-il-
3,527	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	2-tolil-
3,528	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	2-trifluorometil-4-piridil-
3,529	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	2-trifluorometil-fenil-
3,530	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3,4-difluoro-fenil-
3,531	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3,5-difluoro-fenil-
3,532	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-cloro-4-fluoro-fenil-
3,533	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-cloro-4-piridil-
3,534	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-cianofenil-
3,535	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-ciano-fenil-
3,536	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-metil-2-piridil-
3,537	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-metil-4-amino-fenil-
3,538	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-piridil-
3,539	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-tolil-
3,540	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-trifluorometil-3-piridil-
3,541	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	3-trifluorometil-fenil-
3,542	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-(dimetilamino)-fenil-
3,543	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-(dimetilsulfamoil)fenil-
3,544	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-(metilamino)-fenil-
3,545	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-(metilsulfanil)fenil-
3,546	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-(terc-butoxi)-fenil-
3,547	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-(terc-butoxicarbonilamino)-3-fluoro-2-fenil-
3,548	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-(trifluorometoxi)-fenil-
3,549	-CH ₂ -C≡CH	Cl	6-Cl	4-[etil(metil)carbamoil]-3-fluoro-fenil-
3,550	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-acetamidofenil-
3,551	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-amino-3-metilfenil-
3,552	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-amino-fenil-
3,553	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-bifenil-
3,554	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-carboxifenil-
3,555	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-cloro-3-piridil-
3,556	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-cloro-fenil-
3,557	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-cianofenil-
3,558	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-ciano-fenil-
3,559	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-ciclopropilfenil-
3,560	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-ciclopropil-fenil-
3,561	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-dimetilaminofenil-
3,562	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-fluoro-fenil-
3,563	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-hidroxifenil-
3,564	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-hidroxifenil-
3,565	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-metoxicarbonilfenil-

N.º de compuesto	R ¹	R ²	X	D
3,566	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-metil-2-piridil-
3,567	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-metilaminofenil-
3,568	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-metilsulfonilfenil-
3,569	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-oxazol-5-ilfenil-
3,570	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-piridil-
3,571	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-terc-butoxifenil-
3,572	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-terc-butilfenil-
3,573	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-tolil-
3,574	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-trifluorometil-3-piridil-
3,575	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-trifluorometil-fenil-
3,576	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-il-
3,577	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	5-metil-2-piridil-
3,578	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	5-metil-3-piridil-
3,579	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	6-cloro-3-piridil-
3,580	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	6-metil-2-piridil-
3,581	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	pirimidin-5-il-
3,582	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	tiazol-2-il-
3,583	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	tiazol-5-il-
3,584	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	tiofen-3-il-
3,585	-Me	-Me	6-F	4-(1-metilpirazol-3-il)fenil-
3,586	-Me	-Me	6-F	4-(5-metiltetrazol-1-il)fenil-
3,587	-Me	-Me	6-F	4-morfolinofenil-
3,588	-Me	-Me	6-F	4-(3-metilpirazol-1-il)fenil-
3,589	-Me	-Me	6-F	4-(3,5-dimetilpirazol-1-il)fenil-
3,590	-Me	-Me	6-F	4-pirazol-1-ilfenil-
3,591	-Me	-Me	6-F	4-pirrol-1-ilfenil-
3,592	-Me	-Me	6-F	4-(5-metiltetrahidrofuran-2-il)fenil-
3,593	-Me	-Me	6-F	4-(5-metil-2-furil)fenil-
3,594	-Me	-Me	6-F	4-oxazol-2-ilfenil-
3,595	-Me	-Me	6-F	4-(2-metiltiazol-4-il)fenil-
3,596	-Me	-Me	6-F	4-(2-tienil)fenil-
3,597	-Me	-Me	6-F	4-(1,2,4-triazol-1-il)fenil-
3,598	-Me	-Me	6-F	1-fenil-4-pirazolil-
3,599	-Me	-Me	6-F	1-ciclopropil-4-pirazolil-
3,600	-Me	-Me	6-F	4-(metilsulfanilmetil)fenil-
3,601	-Me	-Me	6-F	4-(isopropilsulfanilmetil)fenil-
3,602	-Me	-Me	6-F	4-(metilsulfamoil)fenil-
3,603	-Me	-Me	6-F	4-sulfamoilfenil-
3,604	-Me	-Me	6-F	4-carbamoilfenil-
3,605	-Me	-Me	6-Cl	4-(1-metilpirazol-3-il)fenil-
3,606	-Me	-Me	6-Cl	4-(5-metiltetrazol-1-il)fenil-
3,607	-Me	-Me	6-Cl	4-morfolinofenil-
3,608	-Me	-Me	6-Cl	4-(3-metilpirazol-1-il)fenil-

N.º de compuesto	R ¹	R ²	X	D
3,609	-Me	-Me	6-Cl	4-(3,5-dimetilpirazol-1-il)fenil-
3,610	-Me	-Me	6-Cl	4-pirazol-1-ilfenil-
3,611	-Me	-Me	6-Cl	4-pirrol-1-ilfenil-
3,612	-Me	-Me	6-Cl	4-(5-metiltetrahidrofuran-2-il)fenil-
3,613	-Me	-Me	6-Cl	4-(5-metil-2-furil)fenil-
3,614	-Me	-Me	6-Cl	4-oxazol-2-ilfenil-
3,615	-Me	-Me	6-Cl	4-(2-metiltiazol-4-il)fenil-
3,616	-Me	-Me	6-Cl	4-(2-tienil)fenil-
3,617	-Me	-Me	6-Cl	4-(1,2,4-triazol-1-il)fenil-
3,618	-Me	-Me	6-Cl	1-fenil-4-pirazolil-
3,619	-Me	-Me	6-Cl	1-ciclopropil-4-pirazolil-
3,620	-Me	-Me	6-Cl	4-(metilsulfanilmetil)fenil-
3,621	-Me	-Me	6-Cl	4-(isopropilsulfanilmetil)fenil-
3,622	-Me	-Me	6-Cl	4-(metilsulfamoil)fenil-
3,623	-Me	-Me	6-Cl	4-sulfamoilfenil-
3,624	-Me	-Me	6-Cl	4-carbamoilfenil-
3,625	-Me	-Cl	6-F	4-(1-metilpirazol-3-il)fenil-
3,626	-Me	-Cl	6-F	4-(5-metiltetrazol-1-il)fenil-
3,627	-Me	-Cl	6-F	4-morfolinofenil-
3,628	-Me	-Cl	6-F	4-(3-metilpirazol-1-il)fenil-
3,629	-Me	-Cl	6-F	4-(3,5-dimetilpirazol-1-il)fenil-
3,630	-Me	-Cl	6-F	4-pirazol-1-ilfenil-
3,631	-Me	-Cl	6-F	4-pirrol-1-ilfenil-
3,632	-Me	-Cl	6-F	4-(5-metiltetrahidrofuran-2-il)fenil-
3,633	-Me	-Cl	6-F	4-(5-metil-2-furil)fenil-
3,634	-Me	-Cl	6-F	4-oxazol-2-ilfenil-
3,635	-Me	-Cl	6-F	4-(2-metiltiazol-4-il)fenil-
3,636	-Me	-Cl	6-F	4-(2-tienil)fenil-
3,637	-Me	-Cl	6-F	4-(1,2,4-triazol-1-il)fenil-
3,638	-Me	-Cl	6-F	1-fenil-4-pirazolil-
3,639	-Me	-Cl	6-F	1-ciclopropil-4-pirazolil-
3,640	-Me	-Cl	6-F	4-(metilsulfanilmetil)fenil-
3,641	-Me	-Cl	6-F	4-(isopropilsulfanilmetil)fenil-
3,642	-Me	-Cl	6-F	4-(metilsulfamoil)fenil-
3,643	-Me	-Cl	6-F	4-sulfamoilfenil-
3,644	-Me	-Cl	6-F	4-carbamoilfenil-
3,645	-Me	-Cl	6-Cl	4-(1-metilpirazol-3-il)fenil-
3,646	-Me	-Cl	6-Cl	4-(5-metiltetrazol-1-il)fenil-
3,647	-Me	-Cl	6-Cl	4-morfolinofenil-
3,648	-Me	-Cl	6-Cl	4-(3-metilpirazol-1-il)fenil-
3,649	-Me	-Cl	6-Cl	4-(3,5-dimetilpirazol-1-il)fenil-
3,650	-Me	-Cl	6-Cl	4-pirazol-1-ilfenil-
3,651	-Me	-Cl	6-Cl	4-pirrol-1-ilfenil-

N.º de compuesto	R ¹	R ²	X	D
3,652	-Me	-Cl	6-Cl	4-(5-metiltetrahidrofuran-2-il)fenil-
3,653	-Me	-Cl	6-Cl	4-(5-metil-2-furil)fenil-
3,654	-Me	-Cl	6-Cl	4-oxazol-2-ilfenil-
3,655	-Me	-Cl	6-Cl	4-(2-metiltiazol-4-il)fenil-
3,656	-Me	-Cl	6-Cl	4-(2-tienil)fenil-
3,657	-Me	-Cl	6-Cl	4-(1,2,4-triazol-1-il)fenil-
3,658	-Me	-Cl	6-Cl	1-fenil-4-pirazolil-
3,659	-Me	-Cl	6-Cl	1-ciclopropil-4-pirazolil-
3,660	-Me	-Cl	6-Cl	4-(metilsulfanilmetil)fenil-
3,661	-Me	-Cl	6-Cl	4-(isopropilsulfanilmetil)fenil-
3,662	-Me	-Cl	6-Cl	4-(metilsulfamoil)fenil-
3,663	-Me	-Cl	6-Cl	4-sulfamoilfenil-
3,664	-Me	-Cl	6-Cl	4-carbamoilfenil-
3,665	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-(1-metilpirazol-3-il)fenil-
3,666	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-(5-metiltetrazol-1-il)fenil-
3,667	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-morfolinofenil-
3,668	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-(3-metilpirazol-1-il)fenil-
3,669	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-(3,5-dimetilpirazol-1-il)fenil-
3,670	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-pirazol-1-ilfenil-
3,671	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-pirrol-1-ilfenil-
3,672	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-(5-metiltetrahidrofuran-2-il)fenil-
3,673	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-(5-metil-2-furil)fenil-
3,674	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-oxazol-2-ilfenil-
3,675	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-(2-metiltiazol-4-il)fenil-
3,676	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-(2-tienil)fenil-
3,677	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-(1,2,4-triazol-1-il)fenil-
3,678	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	1-fenil-4-pirazolil-
3,679	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	1-ciclopropil-4-pirazolil-
3,680	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-(metilsulfanilmetil)fenil-
3,681	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-(isopropilsulfanilmetil)fenil-
3,682	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-(metilsulfamoil)fenil-
3,683	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-sulfamoilfenil-
3,684	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-F	4-carbamoilfenil-
3,685	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-(1-metilpirazol-3-il)fenil-
3,686	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-(5-metiltetrazol-1-il)fenil-
3,687	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-morfolinofenil-
3,688	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-(3-metilpirazol-1-il)fenil-
3,689	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-(3,5-dimetilpirazol-1-il)fenil-
3,690	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-pirazol-1-ilfenil-
3,691	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-pirrol-1-ilfenil-
3,692	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-(5-metiltetrahidrofuran-2-il)fenil-
3,693	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-(5-metil-2-furil)fenil-
3,694	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-oxazol-2-ilfenil-

N.º de compuesto	R ¹	R ²	X	D
3,695	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-(2-metiltiazol-4-il)fenil-
3,696	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-(2-tienil)fenil-
3,697	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-(1,2,4-triazol-1-il)fenil-
3,698	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	1-fenil-4-pirazolil-
3,699	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	1-ciclopropil-4-pirazolil-
3,700	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-(metilsulfanilmetil)fenil-
3,701	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-(isopropilsulfanilmetil)fenil-
3,702	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-(metilsulfamoil)fenil-
3,703	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-sulfamoilfenil-
3,704	-CH ₂ -C≡CH	-Me	6-Cl	4-carbamoilfenil-
3,705	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-(1-metilpirazol-3-il)fenil-
3,706	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-(5-metiltetrazol-1-il)fenil-
3,707	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-morfolinofenil-
3,708	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-(3-metilpirazol-1-il)fenil-
3,709	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-(3,5-dimetilpirazol-1-il)fenil-
3,710	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-pirazol-1-ilfenil-
3,711	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-pirrol-1-ilfenil-
3,712	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-(5-metiltetrahidrofuran-2-il)fenil-
3,713	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-(5-metil-2-furil)fenil-
3,714	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-oxazol-2-ilfenil-
3,715	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-(2-metiltiazol-4-il)fenil-
3,716	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-(2-tienil)fenil-
3,717	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-(1,2,4-triazol-1-il)fenil-
3,718	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	1-fenil-4-pirazolil-
3,719	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	1-ciclopropil-4-pirazolil-
3,720	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-(metilsulfanilmetil)fenil-
3,721	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-(isopropilsulfanilmetil)fenil-
3,722	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-(metilsulfamoil)fenil-
3,723	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-sulfamoilfenil-
3,724	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-F	4-carbamoilfenil-
3,725	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-(1-metilpirazol-3-il)fenil-
3,726	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-(5-metiltetrazol-1-il)fenil-
3,727	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-morfolinofenil-
3,728	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-(3-metilpirazol-1-il)fenil-
3,729	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-(3,5-dimetilpirazol-1-il)fenil-
3,730	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-pirazol-1-ilfenil-
3,731	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-pirrol-1-ilfenil-
3,732	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-(5-metiltetrahidrofuran-2-il)fenil-
3,733	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-(5-metil-2-furil)fenil-
3,734	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-oxazol-2-ilfenil-
3,735	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-(2-metiltiazol-4-il)fenil-
3,736	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-(2-tienil)fenil-
3,737	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-(1,2,4-triazol-1-il)fenil-

N.º de compuesto	R ¹	R ²	X	D
3,738	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	1-fenil-4-pirazolil-
3,739	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	1-ciclopropil-4-pirazolil-
3,740	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-(metilsulfanilmetil)fenil-
3,741	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-(isopropilsulfanilmetil)fenil-
3,742	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-(metilsulfamoil)fenil-
3,743	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-sulfamoilfenil-
3,744	-CH ₂ -C≡CH	-Cl	6-Cl	4-carbamoilfenil-

La **Tabla C-2** proporciona 744 compuestos C-2.001 a C-2.744 de fórmula (I), en donde G es -H, W es (E)-CH=CH-, Y es 3-ciclopropilo, y R¹, R², X, Y y D son como se definió para los n.º de compuesto 3.001 a 3.744 respectivamente en la Tabla 3 anterior.

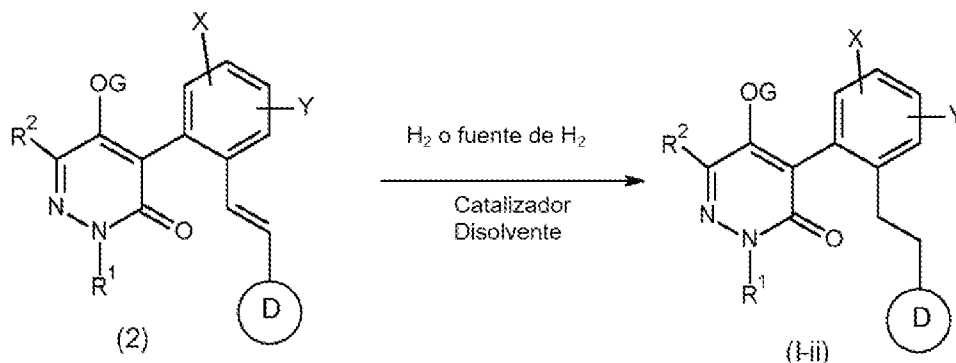
La **Tabla C-3** proporciona 744 compuestos C-3.001 a C-3.744 de fórmula (I), en donde G es -(C=O)iPr, W es -CH₂-CH₂-, Y es 3-ciclopropilo y R¹, R², X y D son como se definió para los n.º de compuesto 3.001 a 3.744 respectivamente en la Tabla 3 anterior.

La **Tabla C-4** proporciona 744 compuestos C-4.001 a C-4.744 de fórmula (I), en donde G es -(C=O)iPr, W es (E)-CH=CH-, Y es 3-ciclopropilo y R¹, R², X y D son como se definió para los n.º de compuesto 3.001 a 3.744 respectivamente en la Tabla 3 anterior.

Los compuestos de esta invención pueden prepararse según los siguientes esquemas, en donde los sustituyentes R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁸, R⁹, R¹⁰, R¹¹, R¹², R¹³, R¹⁴, R¹⁵, R¹⁶, W, D, Dp, G, X, Y y m tienen (a menos que se indique otra cosa explícitamente) las definiciones descritas anteriormente.

Ciertos compuestos (I-ii) de la presente invención pueden prepararse a partir de los compuestos (2) como se muestra en el **Esquema de reacción 1**. Los compuestos (I-ii) son compuestos de fórmula (I) en donde W es -CH₂-CH₂-.

Esquema de reacción 1



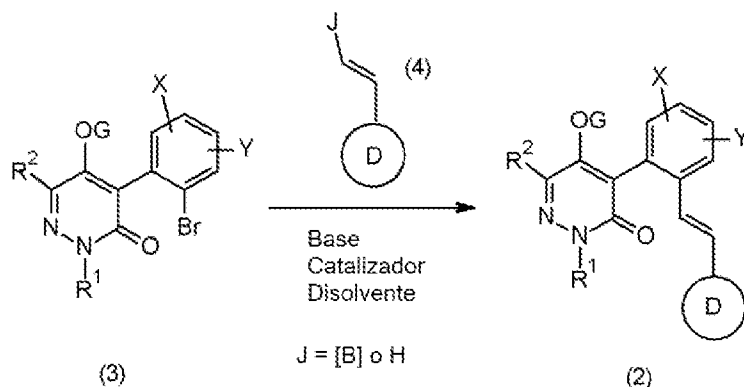
Los compuestos (I-ii) pueden prepararse mediante hidrogenación catalítica de compuestos (2) con gas hidrógeno en un disolvente adecuado [tal como tetrahidrofurano, metanol, etanol, ácido acético o acetato de etilo] en presencia de un catalizador adecuado [tal como Pd/C, Pd/CaCO₃, Rh/Al₂CO₃ o esponja de níquel] a una temperatura entre -10 y 100 °C.

Como alternativa, los compuestos (I-ii) también pueden prepararse mediante hidrogenación por transferencia catalítica de compuestos (2) por tratamiento con una fuente de hidrógeno adecuada en un disolvente adecuado en presencia de un catalizador adecuado a una temperatura entre -10 y 100 °C. Ejemplos de sistemas adecuados son tetrahidrobورو en mezclas de diclorometano/agua o diclorometano/metanol en presencia de Pd/C, Pd(OAc)₂ o Pd(OH)₂/C (J. Am. Chem. Soc., 2016, 138, 6107-6110) o 1,4-dihidro-2,6-dimetil-3,5-piridindicarboxilato de dietilo en etanol en presencia de Pd/C (Tetrahedron Letters, 2009, 50, 1026).

Los compuestos (2) pueden prepararse a partir de los compuestos (3) y compuestos (4) tal como se muestra en el **Esquema de reacción 2**, según el protocolo de Suzuki o el protocolo de Heck descrito a continuación. Cuando se emplea el protocolo de Suzuki, los compuestos (4) son compuestos organoborados tales como ácidos borónicos, ésteres borónicos o sales de tipo trifluoroborato de potasio. Cuando se emplea el protocolo de Heck, los compuestos (4) son estirenos.

Como alternativa, los compuestos (I-ii) también pueden prepararse mediante reducción con diimida generada *in situ* a partir de un precursor adecuado en un disolvente adecuado a una temperatura entre -10 y 200 °C. Ejemplos de reactivos adecuados para generación de diimida incluyen arilsulfonil hidrazidas sustituidas como 2,4,6-triisopropilbencenosulfonil hidrazida, opcionalmente en presencia de una base adecuada. Ejemplos de bases adecuadas incluyen trietilamina, diisopropiletilamina, carbonato potásico y carbonato sódico. Los disolventes adecuados incluyen tetrahidrofurano, 1,4-dioxano, acetato de etilo, acetonitrilo y dimetilformamida.

Esquema de reacción 2



Protocolo de Suzuki

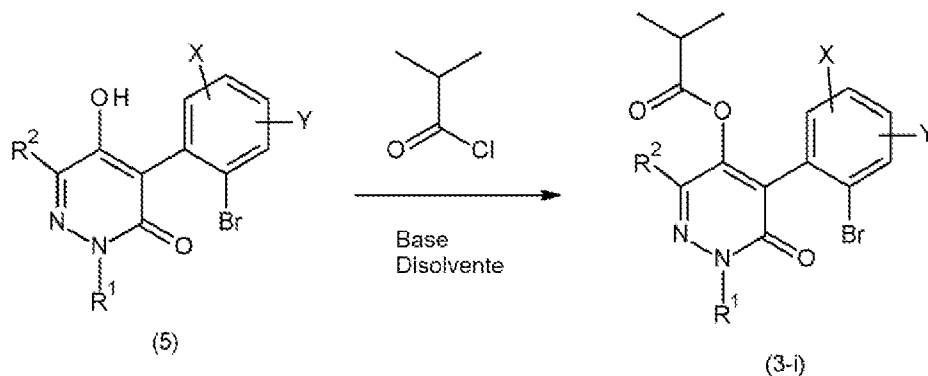
Los compuestos (2) se pueden preparar por tratamiento de los compuestos (3) con los compuestos (4) en presencia de una base adecuada y un catalizador adecuado en un disolvente adecuado a una temperatura entre 10 y 150 °C. Los ejemplos de bases adecuadas incluyen carbonato de potasio, fosfato de potasio, carbonato de sodio, bicarbonato de sodio y fluoruro de potasio. Los ejemplos de catalizadores adecuados incluyen el complejo de 1,1'-bis(difenilfosfina)ferroceno]dicloropaladio (II)-diclorometano [PdCl₂(dppf).DCM], tetraquis(trifenilfosfina)paladio (0) [Pd(PPh₃)₄], y un sistema catalítico formado *in situ* a partir de una mezcla de acetato de paladio (II) y trifenilfosfina. Los ejemplos de disolventes adecuados incluyen agua, 1,4-dioxano, tetrahidrofurano, acetonitrilo y tolueno. Muchos compuestos (4) están disponibles comercialmente [por ejemplo, ácido *trans*-2-(4-bifenil)vinilborónico] o pueden prepararse mediante métodos conocidos. Son ejemplos de compuestos (3) con una utilidad especial en el protocolo de Suzuki los ésteres de isobutirilo (3-i) en donde G es isobutirilo.

El experto apreciará que es probable que las condiciones del protocolo de Suzuki escindan los grupos éster, de manera que el Esquema de reacción 2 también puede describir una reacción en donde el material de partida (3) contenga un resto éster [tal como cuando G es un grupo acilo], pero el producto (2) no lo tenga [tal como cuando G es hidrógeno].

Protocolo de Heck

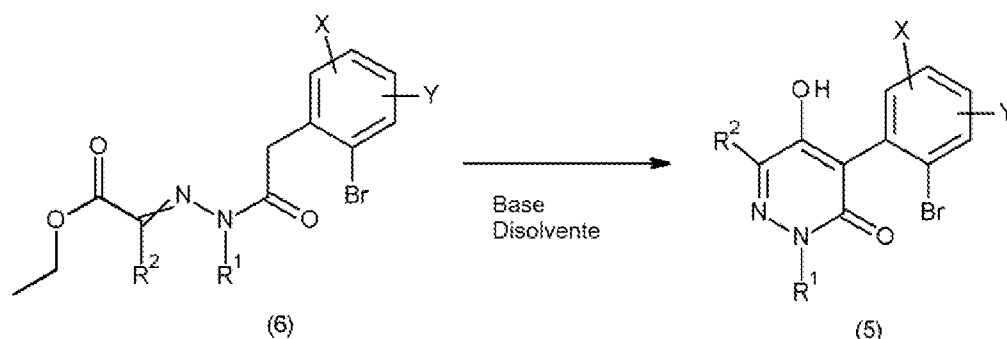
Los compuestos (2) se pueden preparar por tratamiento de los compuestos (3) con los compuestos (4) en presencia de una base adecuada y un catalizador adecuado a una temperatura entre 10 y 150 °C. Opcionalmente, se puede incluir un disolvente adicional. Los ejemplos de bases adecuadas incluyen trietilamina, morfina, N-metilmorfina, diisopropiletilamina y piridina. Los ejemplos de catalizadores adecuados incluyen de tetraquis(trifenilfosfina)paladio (0) [Pd(PPh₃)₄], un sistema catalítico formado *in situ* de una mezcla de acetato de paladio (II) y trifenilfosfina, un sistema catalítico formado *in situ* de una mezcla de tris(dibencilidenacetona)dipaladio (0) y tetrafluoroborato de tri-*tert*-butilfosfonio, y un sistema catalítico formado *in situ* de un precatalizador de paladacilo tal como cloro[(tri-*tert*-butilfosfina)-2-(2-aminobifenil)]paladio (II). Los ejemplos del disolvente adicional opcional incluyen 1,4-dioxano, tetrahidrofurano, acetonitrilo y tolueno. Muchos compuestos (4) están disponibles comercialmente [como 4-cianoestireno] o pueden prepararse mediante métodos conocidos. Son ejemplos de compuestos (3) con una utilidad especial en el protocolo de Heck los ésteres de isobutirilo (3-i) en donde G es isobutirilo.

Los compuestos (3-i) se pueden preparar a partir de compuestos (5) como se muestra en el Esquema de reacción 3.

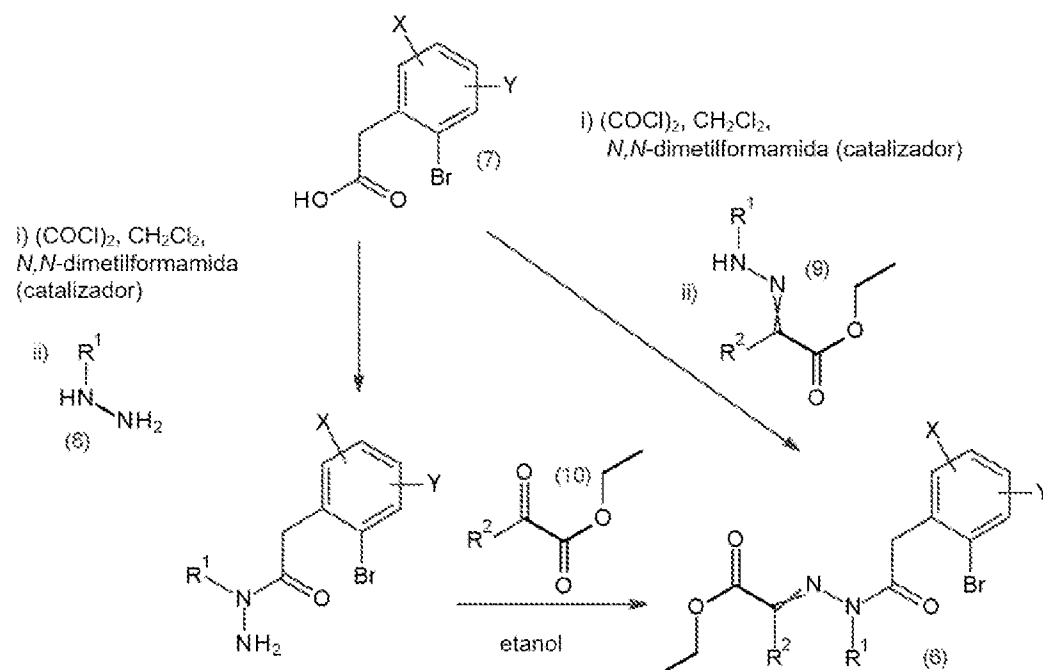
Esquema de reacción 3

Los compuestos (3-i) se pueden preparar por tratamiento de los compuestos (5) con cloruro de isobutirilo en un disolvente adecuado [tal como diclorometano, acetonitrilo o tolueno] en presencia de una base adecuada [tal como trietilamina, diisopropiletilamina o piridina] a una temperatura entre -10 y 60 °C. Opcionalmente, se puede incluir un catalizador [tal como 4-(dimetilamino)piridina].

Los compuestos (5) se pueden preparar a partir de los compuestos (6) tal como se muestra en el **Esquema de reacción 4**, calentando los compuestos (6) con una base (tal como 1,8-diazabicyclo[5.4.0]undec-7-eno, hexametildisilazida de sodio o hexametildisilazida de litio) en un disolvente [tal como acetonitrilo, *N,N*-dimetilformamida o tolueno] a una temperatura entre 50 y 200 °C. Se puede utilizar calentamiento convencional o calentamiento por microondas.

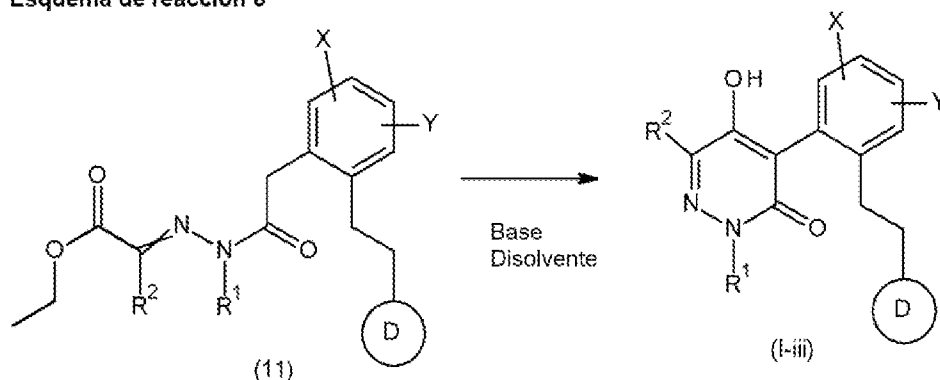
Esquema de reacción 4

Los compuestos (6) se pueden preparar a partir de ácidos fenilacéticos (7) tal como se muestra en el **Esquema de reacción 5**.

Esquema de reacción 5

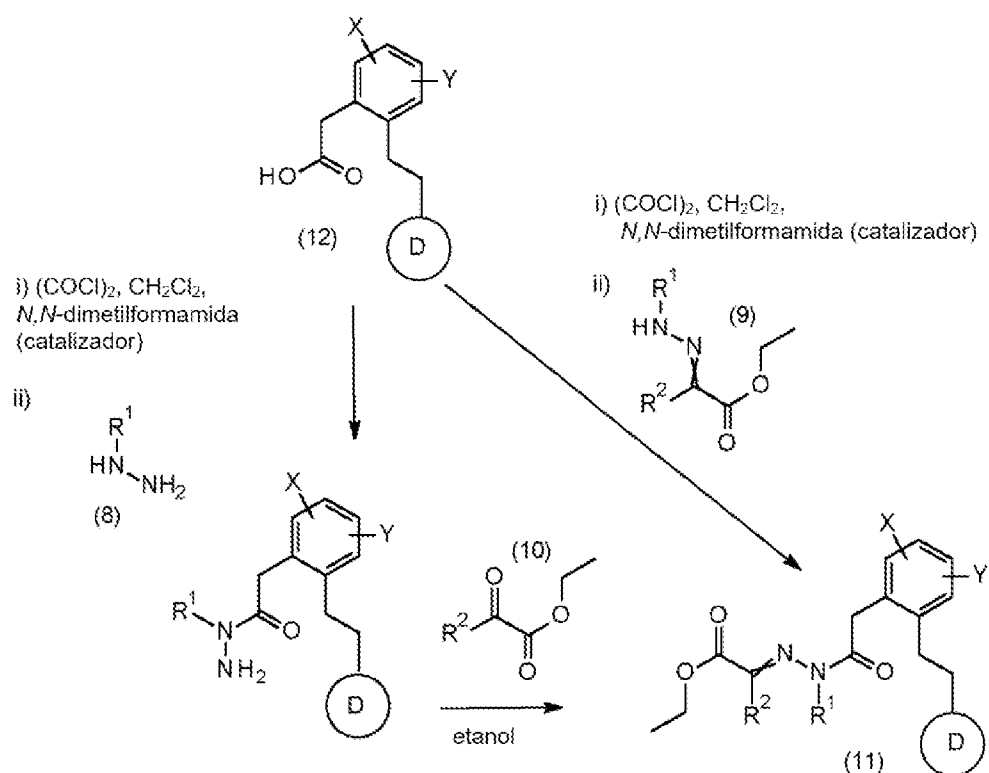
Con respecto al **Esquema de reacción 5**, un ejemplo de una hidracina (8) es metilhidracina, y un ejemplo de cetoésteres (10) es piruvato de etilo. Un ejemplo de una hidrazona (9) es (2E/Z)-2-(metilhidrazono)propanoato de etilo, preparado según los métodos descritos en la solicitud de patente PCT WO2016/008816. Un ejemplo de un ácido fenilacético (7) es el ácido (2-bromo-6-fluorofenil)acético, que se puede sintetizar según el **Esquema de reacción 10**. Un ejemplo adicional de un ácido fenilacético (7) es el ácido (2-bromo-3-cloro-6-fluoro-fenil)acético, que se puede sintetizar según el **Esquema de reacción 11**.

- 10 Ciertos compuestos (I-iii) de la presente invención pueden prepararse a partir de los compuestos (11) como se muestra en el **Esquema de reacción 6** o a partir de los compuestos (I-iv) como se muestra en el **Esquema de reacción 12**. Los compuestos (I-iii) son compuestos de fórmula (I) en donde W es $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$ y G es hidrógeno.

Esquema de reacción 6

Los compuestos (I-iii) se pueden preparar calentando los compuestos (11) con una base (tal como 1,8-diazabicyclo[5.4.0]undec-7-eno, hexametildisilazida de sodio o hexametildisilazida de litio) en un disolvente [tal como acetonitrilo, N,N -dimetilformamida o tolueno] a una temperatura entre 50 y 200 °C. Se puede utilizar calentamiento convencional o calentamiento por microondas.

Los compuestos (11) pueden prepararse a partir de los compuestos (12) como se muestra en el **Esquema de reacción 7** a continuación.

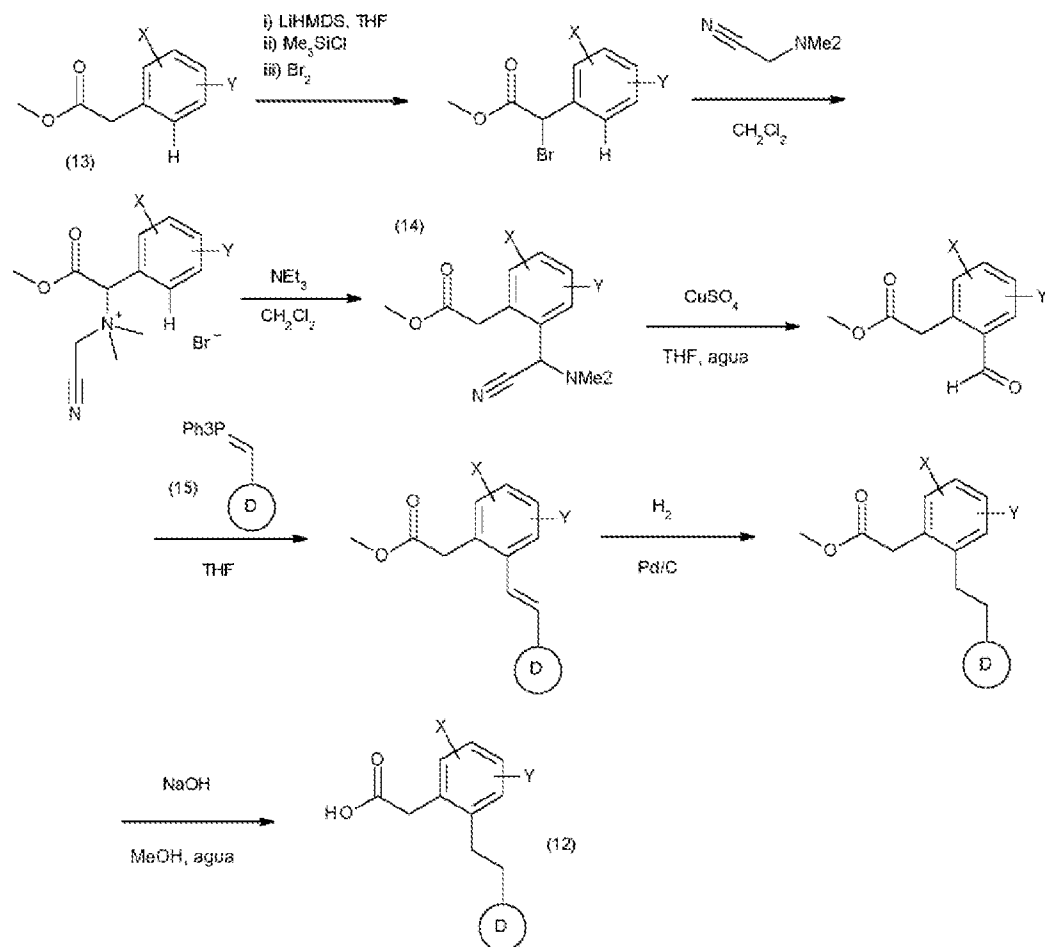
Esquema de reacción 7

Los compuestos (12) se pueden preparar a partir de compuestos (13) como se muestra en el **Esquema de reacción 8**. Muchos compuestos (13) están comercializados [tales como 2-fenilacetato de metilo y 2-(2-fluorofenil)acetato de metilo].

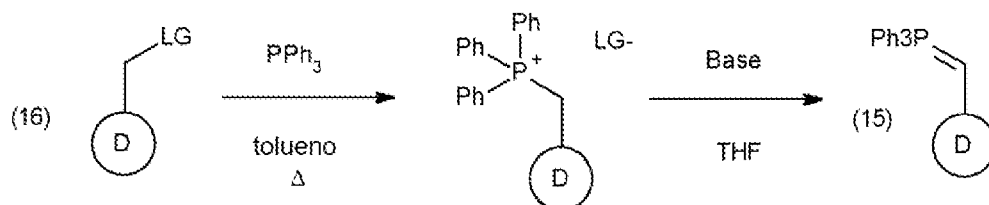
Respecto al **Esquema de reacción 8**, se pueden preparar fosforanos (15) según el

Esquema de reacción 9.

Esquema de reacción 8

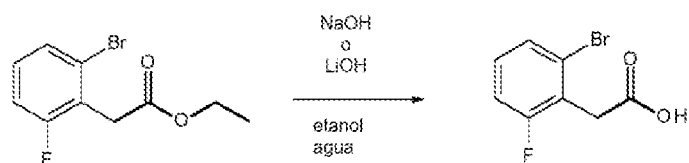


Esquema de reacción 9

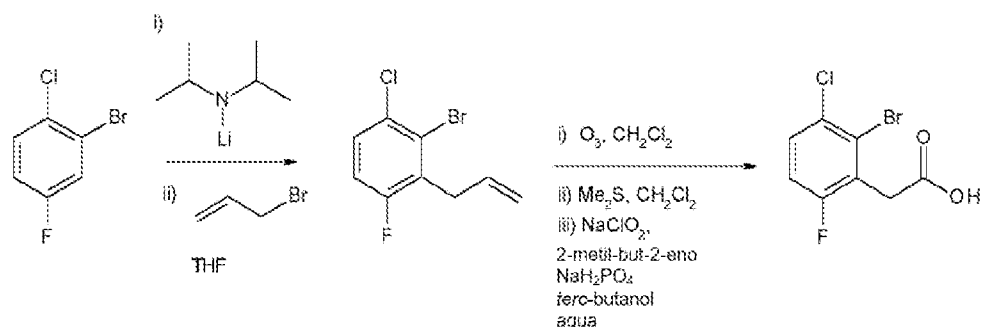


- 5 Con respecto al **Esquema de reacción 9**, son ejemplos de bases adecuadas hidruro de sodio, hexametildisilazida de sodio y *tert*-butoxido de potasio. Los compuestos (16) son electrófilos en donde LG es un grupo saliente [tal como cloruro, bromuro, yoduro, tosilato o mesilato]. Muchos compuestos (16) están disponibles comercialmente [tales como bromuro de 4-clorobencilo o 2-cloro-5-clorometiltiazol].

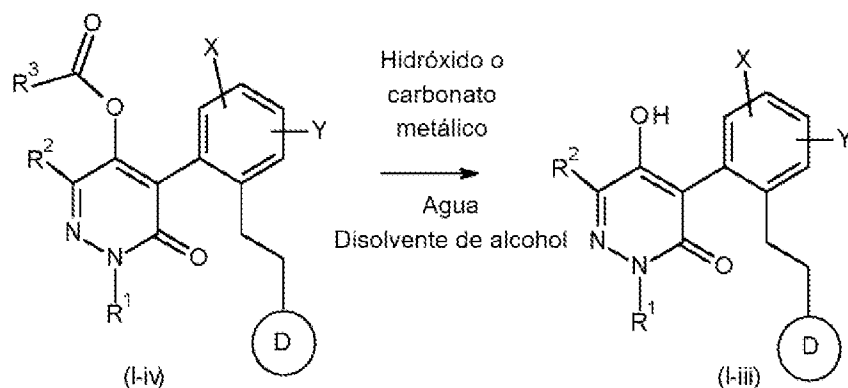
Esquema de reacción 10



Con respecto al **Esquema de reacción 10**, el éster etílico del ácido (2-bromo-6-fluoro-fenil)acético puede prepararse como se describe en Lundgren et al. JACS 2016, 138, 13826-13829.

Esquema de reacción 11

Con respecto al **Esquema de reacción 11**, el 2-bromo-1-cloro-4-fluorobenceno está disponible comercialmente.

Esquema de reacción 12

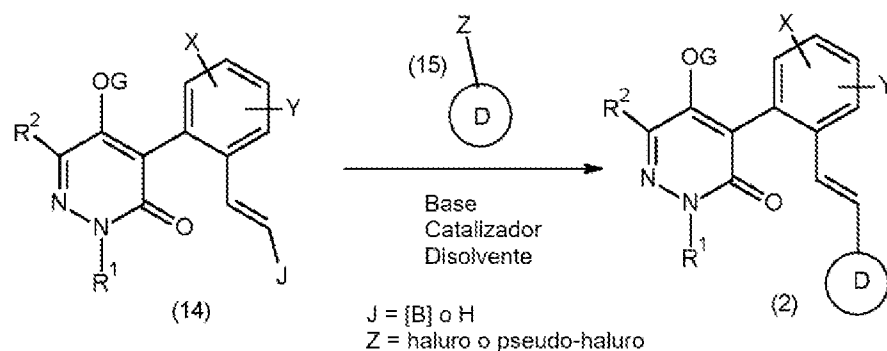
5

Los compuestos (I-iii) pueden prepararse tratando los compuestos (I-iv) con un hidróxido metálico [como hidróxido sódico, hidróxido de litio o hidróxido potásico] en una mezcla de agua y un disolvente adecuado [como metanol, etanol o tetrahidrofurano]; o tratando los compuestos (I-iv) con un carbonato metálico [como carbonato sódico o carbonato potásico] en un disolvente alcohólico [como metanol o etanol] a una temperatura entre 0 °C y 100 °C. Los compuestos (I-iv) son compuestos de fórmula (I) en donde W es $-\text{CH}_2-\text{CH}_2-$ y G es $\text{C}(\text{O})\text{R}^3$.

10

Los compuestos (2) pueden prepararse a partir de los compuestos (14) y compuestos (15) tal como se muestra en el **Esquema de reacción 13**, según el protocolo de Suzuki o el protocolo de Heck descrito a continuación. Cuando se emplea el protocolo de Suzuki, los compuestos (14) son compuestos de organoboro como los ácidos borónicos, los ésteres borónicos o las sales potásicas de trifluoroborato y los compuestos (15) son compuestos de haluro o pseudo-haluro, tales como cloruros, bromuros, yoduros o triflatos. Cuando se emplea el protocolo de Heck, los compuestos (14) son estirenos y los compuestos (15) son compuestos haluro o pseudo-haluro como cloruros, bromuros, yoduros o triflatos.

15

Esquema de reacción 13**Protocolo de Suzuki**

Los compuestos (2) se pueden preparar por tratamiento de los compuestos (14) con los compuestos (15) en presencia de una base adecuada y un catalizador adecuado en un disolvente adecuado a una temperatura entre 10 y 150 °C. Los ejemplos de bases adecuadas incluyen carbonato de potasio, fosfato de potasio, carbonato de sodio, bicarbonato de sodio y fluoruro de potasio. Los ejemplos de catalizadores adecuados incluyen el complejo de 1,1'-bis(difenilfosfino)ferroceno]dicloropaldio (II)-diclorometano [PdCl₂(dppf).DCM], tetraquis(trifenilfosfina)paldio (0) [Pd(PPh₃)₄], y un sistema catalítico formado *in situ* a partir de una mezcla de acetato de paldio (II) y trifenilfosfina. Los ejemplos de disolventes adecuados incluyen agua, 1,4-dioxano, tetrahidrofurano, acetonitrilo y tolueno. Muchos compuestos (15) están disponibles comercialmente o pueden fabricarse por métodos conocidos. Son ejemplos de compuestos (14) con una utilidad especial en el protocolo de Suzuki los ésteres de isobutirilo (14-i) en donde G es isobutirilo.

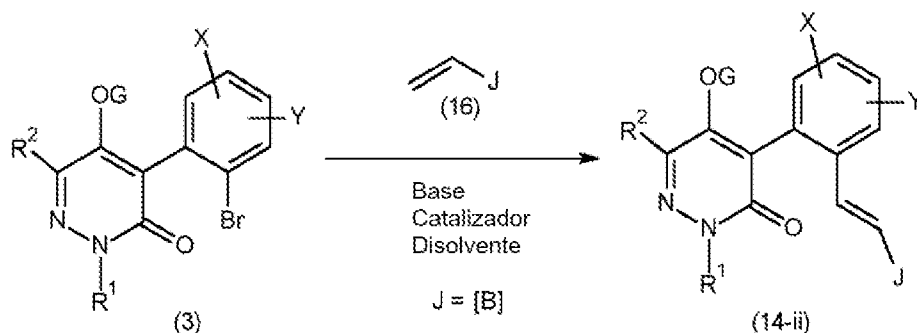
El experto apreciará que es probable que las condiciones del protocolo de Suzuki escindan los grupos éster, de manera que el Esquema de reacción 13 también puede describir una reacción en donde el material de partida (14) contenga un resto éster [tal como cuando G es un grupo acilo], pero el producto (2) no lo tenga [tal como cuando G es hidrógeno].

Protocolo de Heck

Los compuestos (2) se pueden preparar por tratamiento de los compuestos (14) con los compuestos (15) en presencia de una base adecuada y un catalizador adecuado a una temperatura entre 10 y 150 °C. Opcionalmente, se puede incluir un disolvente adicional. Los ejemplos de bases adecuadas incluyen trietilamina, morfolina, *N*-metilmorfolina, diisopropiletilamina y piridina. Los ejemplos de catalizadores adecuados incluyen de tetraquis(trifenilfosfina)paldio (0) [Pd(PPh₃)₄], un sistema catalítico formado *in situ* de una mezcla de acetato de paldio (II) y trifenilfosfina, un sistema catalítico formado *in situ* de una mezcla de tris(dibencilidenacetona)dipaldio (0) y tetrafluoroborato de tri-*tert*-butilfosfonio, y un sistema catalítico formado *in situ* de un precatalizador de paldaciclo tal como cloro[(tri-*tert*-butilfosfina)-2-(2-aminobifenil)]paldio (II). Los ejemplos del disolvente adicional opcional incluyen 1,4-dioxano, tetrahidrofurano, acetonitrilo y tolueno. Muchos compuestos (15) están disponibles comercialmente o pueden fabricarse por métodos conocidos. Son ejemplos de compuestos (14) con una utilidad especial en el protocolo de Heck los ésteres de isobutirilo (14-i) en donde G es isobutirilo.

Los compuestos (14-ii), en donde J es una especie de organoboro, tal como un éster borónico, pueden prepararse a partir de los compuestos (3) y los compuestos (16) como se muestra en el **Esquema de reacción 14**.

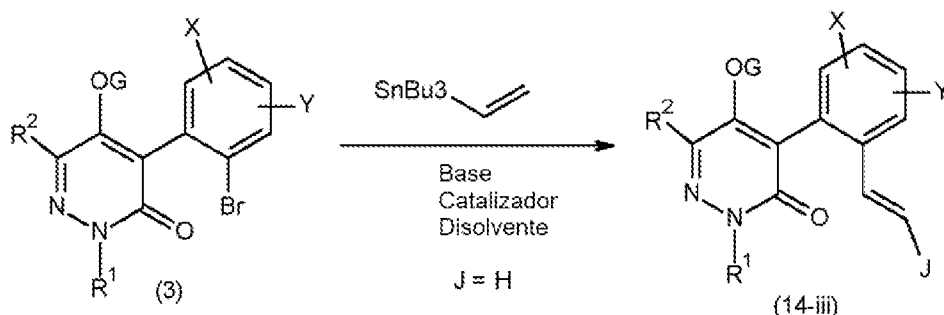
Esquema de reacción 14



Los compuestos (14-ii) pueden prepararse por tratamiento de los compuestos (3) con los compuestos (16) en presencia de una base adecuada y un catalizador adecuado a una temperatura entre 10 y 150 °C. Opcionalmente, se puede incluir un disolvente adicional. Los ejemplos de bases adecuadas incluyen trietilamina, morfolina, *N*-metilmorfolina, diisopropiletilamina y piridina. Ejemplos de catalizadores adecuados son tetraquis(trifenilfosfina)paldio (0) [Pd(PPh₃)₄], un sistema catalítico formado *in situ* de una mezcla de acetato de paldio (II) y trifenilfosfina, y un sistema catalítico formado *in situ* de una mezcla de tris(dibencilidenacetona)dipaldio (0) y tetrafluoroborato de tri-*tert*-butilfosfonio. Los ejemplos del disolvente adicional opcional incluyen 1,4-dioxano, tetrahidrofurano, acetonitrilo y tolueno. Muchos compuestos (16) están disponibles comercialmente, tales como el éster MIDA del ácido vinilborónico o el pinacol éster del ácido vinilborónico o pueden prepararse por métodos conocidos. Son ejemplos de compuestos (3) con una utilidad especial en el protocolo de Heck los ésteres de isobutirilo (3-i) en donde G es isobutirilo.

Los compuestos (14-iii), en donde J es hidrógeno, pueden prepararse a partir de los compuestos (3), como se muestra en el **Esquema de reacción 15**.

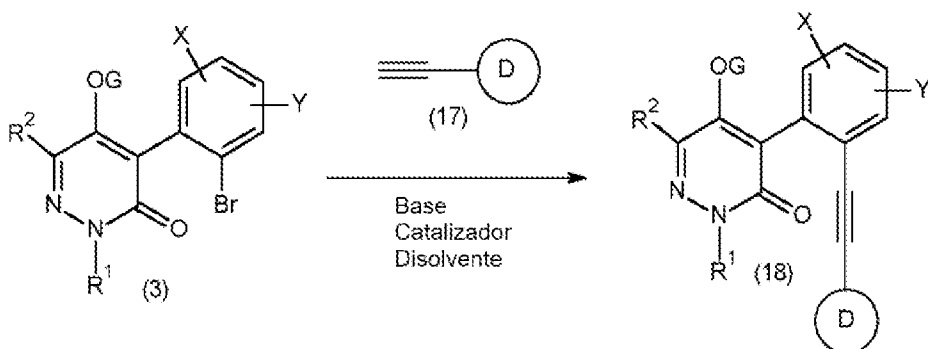
Esquema de reacción 15



Los compuestos (14-iii) pueden prepararse por tratamiento de los compuestos (3) con tributil(vinil)estannano, opcionalmente en presencia de una base adecuada, en presencia de un catalizador adecuado a una temperatura entre 10 y 150 °C en un disolvente adecuado. Los ejemplos de la base opcional incluyen trietilamina, morfolina, *N*-metilmorfolina, diisopropiletilamina y piridina. Los ejemplos de catalizadores adecuados incluyen complejo 1,1'-bis(difenilfosfino)ferroceno]dicloropaldio (II)-diclorometano [PdCl₂(dppf).DCM], tetraquis(trifenilfosfina)paldio (0) [Pd(PPh₃)₄], un sistema catalítico formado *in situ* de una mezcla de acetato de paladio (II) y trifenilfosfina, un sistema catalítico formado *in situ* de una mezcla de tris(dibencilidenacetona)dipaladio (0) y tetrafluoroborato de tri-*tert*-butilfosfonio, y un sistema catalítico formado *in situ* de un precatalizador de paladaciclo tal como cloro[(tri-*tert*-butilfosfina)-2-(2-aminobifenil)]paldio (II). Los ejemplos de disolventes adecuados incluyen 1,4-dioxano, tetrahidrofurano, acetonitrilo y tolueno. Ejemplos de compuestos (3) con utilidad particular son ésteres de isobutirilo (3-i) en donde G es isobutirilo.

Los compuestos (18) pueden prepararse a partir de los compuestos (3) a través de una reacción de Sonogashira como se muestra en el Esquema de reacción 16.

Esquema de reacción 16

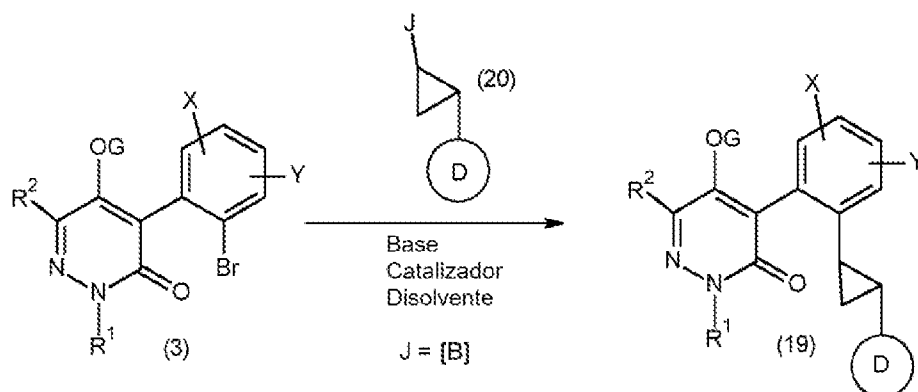


Los compuestos (18) pueden prepararse por tratamiento de los compuestos (3) con los compuestos (17) en presencia de una base adecuada y uno o más catalizadores adecuados a una temperatura entre 10 y 150 °C. Opcionalmente puede añadirse un disolvente adicional. Los ejemplos de bases adecuadas incluyen trietilamina, morfolina, *N*-metilmorfolina, diisopropilamina, diisopropiletilamina y piridina. Los ejemplos de catalizadores adecuados incluyen dicloruro de bis(trifenilfosfina)paldio (II) [Pd(PPh₃)Cl₂], un sistema catalítico formado *in situ* de una mezcla de acetato de paladio (II) y trifenilfosfina, un sistema catalítico formado *in situ* de una mezcla de tris(dibencilidenacetona)dipaladio (0) y tetrafluoroborato de tri-*tert*-butilfosfonio, y un sistema catalítico formado *in situ* de un precatalizador de paladaciclo tal como cloro[(tri-*tert*-butilfosfina)-2-(2-aminobifenil)]paldio (II). Opcionalmente también puede añadirse un catalizador de cobre, tal como yoduro de cobre (I). Ejemplos de disolventes adicionales adecuados son 1,4-dioxano, tetrahidrofurano, acetonitrilo, tolueno y *N,N*-dimetilformamida. Ejemplos de compuestos (3) con utilidad particular son ésteres de isobutirilo (3-i) en donde G es isobutirilo.

El experto apreciará que es probable que las condiciones de la reacción de Sonogashira escindan los grupos éster, de manera que el Esquema de reacción 16 también puede describir una reacción en donde el material de partida (3) contenga un resto éster [tal como cuando G es un grupo acilo], pero el producto (18) no lo tenga [tal como cuando G es hidrógeno].

Los compuestos (19) se pueden preparar a partir de los compuestos (3) y compuestos (20) como se muestra en el Esquema de reacción 17, a través de una reacción de Suzuki, en donde el compuesto (20) es una especie de organoboro adecuada, tal como un ácido bornico, éster boronato o sal de trifluoroborato potásica.

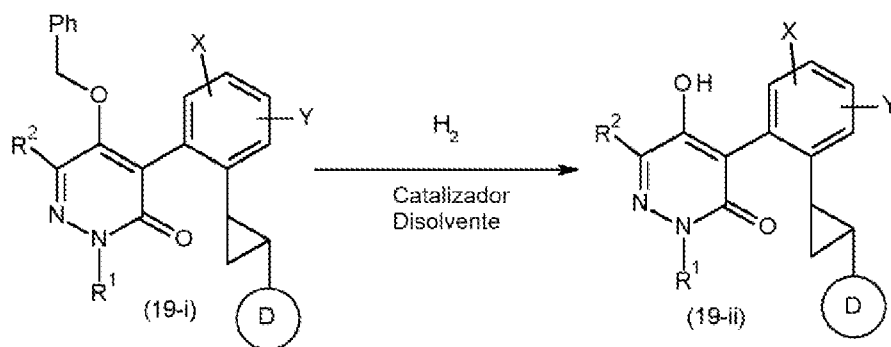
Esquema de reacción 17



Los compuestos (19) se pueden preparar por tratamiento de los compuestos (3) con los compuestos (20) en presencia de una base adecuada y un catalizador adecuado en un disolvente adecuado a una temperatura entre 10 y 150 °C.

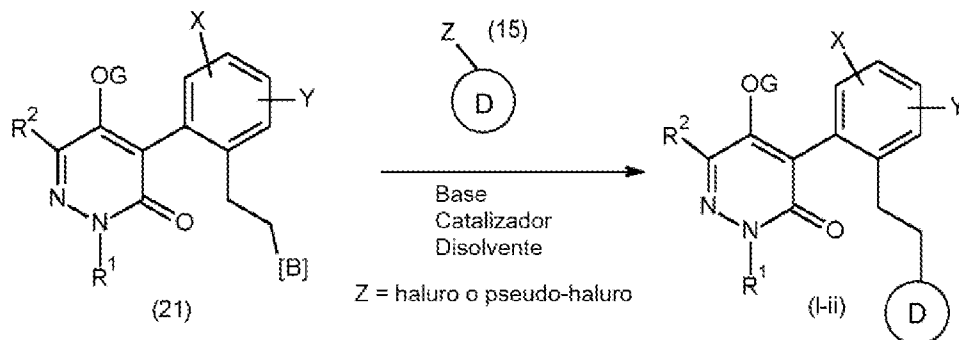
- 5 Los ejemplos de bases adecuadas incluyen carbonato de potasio, fosfato de potasio, carbonato de sodio, bicarbonato de sodio y fluoruro de potasio. Los ejemplos de catalizadores adecuados incluyen complejo 1,1'-bis(difenilfosfino)ferroceno]dicloropaldio (II)-diclorometano [PdCl₂(dppf).DCM], un sistema catalítico formado *in situ* de una mezcla de tris(dibencilidenacetona)dipaladio (0) y tetrafluoroborato de tri-*tert*-butilfosfonio, un sistema catalítico formado *in situ* de una mezcla de tris(dibencilidenacetona)dipaladio (0) y triciclohexilfosfina, un sistema catalítico formado *in situ* de un precatalizador de paladaciclo tal como cloro[(tri-*tert*-butilfosfina)-2-(2'-aminobifenil)]paladio (II), y un sistema catalítico formado *in situ* de un precatalizador de paladaciclo tal como cloro[(triciclohexilfosfina)-2-(2'-aminobifenil)]paladio (II). Los ejemplos de disolventes adecuados incluyen agua, 1,4-dioxano, tetrahidrofurano, acetonitrilo y tolueno. Algunos compuestos (20) están disponibles comercialmente [tal como 4,4,5,5-tetrametil-2-(2-fenil-ciclopropil)-[1,3,2]dioxaborolano] o se pueden preparar por métodos conocidos (véase, por ejemplo, los métodos descritos en Org. Process Res. Dev. 2012, 16, 87-95). Ejemplos de compuestos (3) con utilidad particular en la reacción de Suzuki son los bencil éteres (3-ii) en donde G es bencilo.
- 10
- 15

Esquema de reacción 18



- 20 Los compuestos (19-ii) pueden prepararse mediante hidrogenación catalítica de los compuestos (19-i) con gas hidrógeno en un disolvente adecuado [tal como tetrahidrofurano, metanol, etanol, ácido acético o acetato de etilo] en presencia de un catalizador adecuado [tal como Pd/C, Pd/CaCO₃, Rh/Al₂CO₃ o esponja de níquel] a una temperatura entre -10 y 100 °C.
- 25 Ciertos compuestos (I-ii) de la presente invención pueden prepararse a partir de los compuestos (21) como se muestra en el **Esquema de reacción 19**. Los compuestos (I-ii) son compuestos de fórmula (I) en donde W es -CH₂-CH₂-.

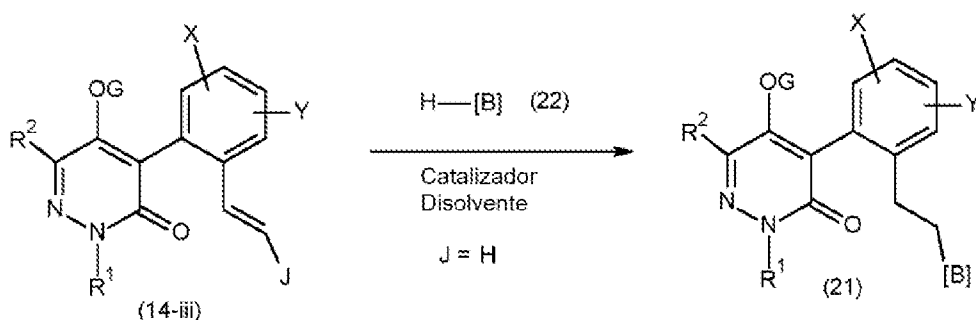
Esquema de reacción 19



Los compuestos (I-ii) pueden prepararse mediante tratamiento de los compuestos (21) en donde [B] puede ser un trialquilborano, ácido alquilborónico, éster alquilborónico o sal de trifluoroborato alquilpotásico, con los compuestos (15) en presencia de una base adecuada y un catalizador adecuado en un disolvente adecuado a una temperatura entre 10 y 150 °C. Ejemplos de bases adecuadas incluyen carbonato potásico, fosfato potásico, carbonato sódico, carbonato de cesio, bicarbonato sódico y fluoruro potásico. Ejemplos de catalizadores adecuados incluyen complejo 1,1'-bis(difenilfosfina)ferroceno]dicloropaldio (II)-diclorometano [PdCl₂(dppf).DCM], [1,3-Bis(2,6-di-3-pentilfenil)imidazol-2-ilideno](3-cloropiridil)dicloropaldio (II) [Pd-PEPPS]TM-IPent], un sistema catalítico formado *in situ* de un precatalizador de paladacio tal como cloro(2-diciclohexilfosfino-2',6'-diisopropoxi-1,1'-bifenil)[2-(2'-amino-1,1'-bifenil)]paldio (II) [RuPhos-Pd-G2], [diciclohexil[2',4',6'-tris(1-metiletil)[1,1'-bifenil]-2-il]fosfina](metanosulfonato-κO)[2'-(metilamino-κN)[1,1'-bifenil]-2-il-κC]paldio [XPhos-Pd-G4] y [(4-(N,N-dimetilamino)fenil)di-terc-butilfosfina](metanosulfonato-κO)[2'-(metilamino-κN)[1,1'-bifenil]-2-il-κC]paldio [APhos-Pd-G4]. Los ejemplos de disolventes adecuados incluyen agua, 1,4-dioxano, tetrahidrofurano, acetonitrilo y tolueno. Muchos compuestos (15) están disponibles comercialmente o pueden fabricarse por métodos conocidos. Son ejemplos de compuestos (21) con una utilidad especial en el protocolo de Suzuki los ésteres de isobutirilo (21-i) en donde G es isobutirilo.

El experto apreciará que las condiciones del protocolo de Suzuki son responsables de la escisión de grupos éster, de modo que el Esquema de Reacción 19 también puede describir una reacción en donde el material de partida (21) contiene un resto éster [de modo que G es un grupo acilo], pero el producto (I-ii) no [de modo que G es hidrógeno].

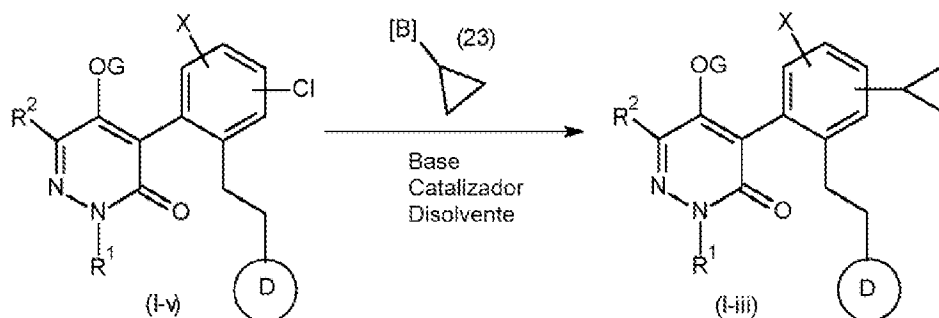
Esquema de reacción 20



Los compuestos (21) pueden prepararse por hidroboración de alquenos (14-iii) usando un reactivo de hidroboración (22) adecuado en un disolvente adecuado con la adición opcional de un catalizador adecuado a una temperatura entre 0 °C y 100 °C. Ejemplos de reactivos de hidroboración incluyen borano, dicloroborano, dibromoborano, 4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolano [pinacolborano], 1,3,2-benzodioxaborol [catecolborano] o 9-borilbicyclo[3.3.1]nonano [9-BBN]. Ejemplos de disolventes adecuados incluyen tetrahidrofurano, 2-metiltetrahidrofurano, 1,4-dioxano, 2-metoxi-2-metil-propano [MTBE] y dietil éter. Ejemplos de catalizadores adecuados incluyen un sistema catalítico formado *in situ* a partir de dicloruro de bis(1,5-ciclooctadieno)diiridio (I) [[Ir(COD)Cl]₂] y 4-difenilfosfanilbutil(difenil)fosfano [DPPB] [J. Am. Chem. Soc., 2004, 126, 9200-9201].

Cuando [B] es un éster alquilborónico, este puede convertirse en el ácido borónico correspondiente por tratamiento con ácido metilborónico [MeB(OH)₂] y ácido trifluoroacético en un disolvente adecuado como diclorometano [DCM] a temperaturas entre 0 y 40 °C [Org. Lett., 2019, 21, 3048-3052]. Cuando [B] es un ácido o éster alquilborónico, este puede convertirse en la sal de trifluoroborato de alquilo potásico correspondiente por tratamiento con hidrogenofluoruro potásico en un disolvente adecuado tal como metanol o acetona a temperaturas entre 0 y 40 °C.

Esquema de reacción 21



Los compuestos (I-iii) donde Y es ciclopropilo pueden prepararse mediante tratamiento de los compuestos (I-v) con los compuestos (23) donde [B] puede ser un trialquilborano, ácido alquilborónico, éster alquilborónico o sal de trifluoroborato alquilpotásico donde los compuestos en presencia de una base adecuada y un catalizador adecuado en un disolvente adecuado a una temperatura entre 10 y 150 °C. Los compuestos (I-v) son compuestos de la fórmula (I) en los que C es -CH₂-CH₂-, G es C(o)R³ e Y es -Cl. Los ejemplos de bases adecuadas incluyen carbonato de potasio, fosfato de potasio, carbonato sódico, carbonato de cesio, bicarbonato sódico y fluoruro de potasio. Ejemplos de catalizadores adecuados incluyen complejo 1,1'-bis(difenilfosfino)ferroceno]dicloropaladio (II)-diclorometano [PdCl₂(dppf).DCM], [1,3-Bis(2,6-di-3-pentilfenil)imidazol-2-ilideno](3-cloropiridil)dicloropaladio (II) [Pd-PEPPSITM-IPent], un sistema catalítico formado *in situ* de un precatalizador de paladaciclo tal como cloro(2-diciclohexilfosfino-2',6'-diisopropoxi-1,1'-bifenil)[2-(2'-amino-1,1'-bifenil)]paladio (II) [RuPhos-Pd-G2], [diciclohexil[2',4',6'-tris(1-metiletil)[1,1'-bifenil]-2-il]fosfina](metanosulfonato-κO)[2'-(metilamino-κN)[1,1'-bifenil]-2-il-κC]paladio [XPhos-Pd-G4] y [(4-(N,N-dimetilamino)fenil)di-terc-butil fosfina](metanosulfonato-κO)[2'-(metilamino-κN)[1,1'-bifenil]-2-il-κC]paladio [APhos-Pd-G4]. Los ejemplos de disolventes adecuados incluyen agua, 1,4-dioxano, tetrahidrofurano, acetonitrilo y tolueno. Son ejemplos de compuestos (I-v) con una utilidad especial en el protocolo de Suzuki los ésteres de isobutirilo (I-v) en donde G es isobutirilo.

El experto apreciará que las condiciones del protocolo de Suzuki son responsables de la escisión de grupos éster, de modo que el Esquema de Reacción 21 puede describir una reacción en donde el material de partida (I-v) contiene un resto éster [de modo que G es un grupo acilo], pero el producto (I-iii) no [de modo que G es hidrógeno].

Los compuestos de fórmula (I) según la invención se pueden usar como herbicidas por sí mismos, pero, en general, se formulan en composiciones herbicidas usando adyuvantes de formulación, tales como vehículos, disolventes y agentes tensioactivos (SFA). Por tanto, la presente invención proporciona además una composición herbicida que comprende un compuesto herbicida según una cualquiera de las reivindicaciones anteriores y un adyuvante de formulación agrícolamente aceptable. La composición puede estar en forma de concentrados que se diluyen antes de su uso, aunque también se pueden preparar composiciones listas para su uso. La dilución final se realiza habitualmente con agua, pero se puede realizar, en lugar de con agua, o además de con la misma, con, por ejemplo, fertilizantes líquidos, micronutrientes, organismos biológicos, aceite o disolventes.

Las composiciones herbicidas comprenden generalmente del 0,1 al 99 % en peso, especialmente del 0,1 al 95 % en peso, de compuestos de fórmula I y del 1 al 99,9 % en peso de un coadyuvante de formulación que incluye preferentemente del 0 al 25 % en peso de una sustancia tensioactiva.

Las composiciones se pueden elegir de un número de tipos de formulación, muchas de las cuales se conocen del Development and Use of FAO Specifications for Plant Protection Products, 5.^a edición, 1999. Estas 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 en aceite (OL), líquidos de volumen ultrabajo (UL), concentrados emulsionables (EC), concentrados dispersables (DC), emulsiones (tanto de aceite en agua (EW) como de agua en aceite (EO)), microemulsiones (ME), concentrados en suspensión (SC), aerosoles, suspensiones de cápsulas (CS) y formulaciones para el tratamiento de semillas. El tipo de formulación elegido en cualquier caso dependerá del objetivo específico previsto 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, carbonato de calcio, tierras de diatomeas, fosfatos de calcio, carbonatos de calcio y magnesio, azufre, cal, harinas, talco y otros vehículos sólidos orgánicos e inorgánicos) y moliendo mecánicamente la mezcla hasta un polvo fino.

Se pueden preparar polvos solubles (SP) mezclando un compuesto de fórmula (I) con una o más sales inorgánicas solubles en agua (tales como bicarbonato sódico, carbonato sódico o sulfato de magnesio) o uno o más sólidos orgánicos solubles en agua (tales como un polisacárido) y, opcionalmente, uno o más agentes humectantes, uno o

más agentes dispersantes o una mezcla de dichos agentes para mejorar la dispersabilidad/solubilidad en agua. A continuación, la mezcla se muele hasta obtener un polvo fino. También se pueden granular composiciones similares para formar gránulos solubles en agua (SG).

Se pueden preparar polvos humectables (WP) mezclando un compuesto de fórmula (I) con uno o más diluyentes o vehículos sólidos, uno o más agentes humectantes y, preferentemente, uno o más agentes dispersantes y, opcionalmente, uno o más agentes de suspensión para facilitar la dispersión en líquidos. A continuación, la mezcla se muele hasta obtener un polvo fino. También se pueden granular composiciones similares para formar gránulos dispersables en agua (WG).

Los gránulos (GR) pueden formarse granulando una mezcla de un compuesto de fórmula (I) y uno o más diluyentes o vehículos sólidos en polvo, o a partir de gránulos en blanco preformados mediante la absorción de un compuesto de fórmula (I) (o una disolución del mismo, en un agente adecuado) en un material granular poroso (tal como piedra pómez, arcillas de atapulgita, tierra de batán, diatomita, tierras de diatomeas o mazorcas de maíz molidas) o mediante la adsorción de un compuesto de fórmula (I) (o una disolución del mismo, en un agente adecuado) sobre un material de núcleo duro (tal como arenas, silicatos, carbonatos minerales, sulfatos o fosfatos) y, si es necesario, secado. Los agentes que se usan habitualmente para facilitar la absorción o la adsorción incluyen disolventes (tales como alcoholes, éteres, cetonas, ésteres y disolventes de petróleo aromáticos y alifáticos) y agentes adhesivos (tales como poli(acetatos de vinilo), poli(alcoholes vinílicos), dextrinas, azúcares y aceites vegetales). También se pueden incluir uno o más aditivos diferentes en los gránulos (por ejemplo, un agente emulsionante, un agente humectante o un agente dispersante).

Se pueden preparar concentrados dispersables (DC) disolviendo un compuesto de fórmula (I) en agua o un disolvente orgánico, tal como una cetona, alcohol o éter glicólico. Estas disoluciones pueden contener un agente tensioactivo (por ejemplo, para mejorar la dilución en agua o evitar la cristalización en un depósito de pulverización).

Se pueden preparar concentrados emulsionables (EC) o emulsiones de aceite en agua (EW) disolviendo un compuesto de fórmula (I) en un disolvente orgánico (que opcionalmente contiene uno o más agentes humectantes, uno o más agentes emulsionantes o una mezcla de dichos agentes). Los disolventes orgánicos adecuados para su uso en EC incluyen hidrocarburos aromáticos (tales como alquilbencenos o alquilnaftalenos, por ejemplo, SOLVESSO 100, SOLVESSO 150 y SOLVESSO 200; SOLVESSO es una marca comercial registrada), cetonas (tales como ciclohexanona o metilciclohexanona) y alcoholes (tales como alcohol bencílico, alcohol furfurílico o butanol), N-alquilpirrolidonas (tales como N-metilpirrolidona o N-octilpirrolidona), dimetilamidas de ácidos grasos (tales como dimetilamida de un ácido graso C₈-C₁₀) e hidrocarburos clorados. Un producto EC puede emulsionarse espontáneamente al añadirlo al agua, para producir una emulsión con estabilidad suficiente para permitir la aplicación por pulverización mediante el equipo apropiado.

La preparación de un EW implica obtener un compuesto de fórmula (I) ya sea como un líquido (si no es líquido a temperatura ambiente, puede fundirse a una temperatura razonable, típicamente por debajo de 70 °C) o en disolución (disolviéndolo en un disolvente apropiado) y luego emulsionando el líquido o la disolución resultante en agua que contiene uno o más SFA, bajo alta cizalladura, para producir una emulsión. Los disolventes adecuados para su uso en EW incluyen aceites vegetales, hidrocarburos clorados (tales como clorobencenos), disolventes aromáticos (tales como alquilbencenos o alquilnaftalenos) y otros disolventes orgánicos adecuados que presenten una solubilidad baja en agua.

Las microemulsiones (ME) se pueden preparar mezclando agua con una mezcla de uno o más disolventes con uno o más SFA, para producir de forma espontánea una formulación líquida isotrópica termodinámicamente estable. Hay un compuesto de fórmula (I) presente inicialmente en el agua o en la mezcla de disolventes/SFA. Disolventes adecuados para su uso en las ME incluyen los descritos anteriormente en el presente documento para su uso en EC o en EW. Una ME puede ser un sistema de aceite en agua o de agua en aceite (se puede determinar qué sistema está presente mediante medidas 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 diluirla en agua, en cuyo caso se puede mantener como una microemulsión o puede formar una emulsión de aceite en agua convencional.

Los concentrados en suspensión (SC) pueden comprender suspensiones acuosas o no acuosas de partículas sólidas insolubles finamente divididas de un compuesto de fórmula (I). Los SC se pueden preparar por molienda con bolas o perlas del 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 agentes humectantes en la composición y se puede incluir un agente de suspensión para reducir la velocidad a la que sedimentan las partículas. Alternativamente, un compuesto de fórmula (I) puede ser molido en seco y añadido al agua, que contiene los agentes descritos anteriormente en el presente documento, para producir el producto final deseado.

Las formulaciones en aerosol comprenden un compuesto de fórmula (I) y un propulsor 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, tal como n-propanol) para proporcionar composiciones para su uso en bombas de pulverización no presurizadas de accionamiento manual.

Se pueden preparar suspensiones de cápsulas (CS) de un modo similar a la preparación de formulaciones EW, pero con una etapa de polimerización adicional de forma que se obtenga una dispersión acuosa de gotitas de aceite, en la que cada gotita de aceite está encapsulada por una envoltura polimérica y contiene un compuesto de fórmula (I) y, opcionalmente, un vehículo o diluyente para el mismo. La envoltura polimérica se puede producir mediante una reacción de policondensación interfacial o mediante un procedimiento de coacervación. Las composiciones pueden proporcionar una 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 lenta y controlada del compuesto.

La composición puede incluir uno o más aditivos para mejorar el rendimiento biológico de la composición, por ejemplo para mejorar la humectación, la retención o la distribución sobre las superficies; la resistencia a la lluvia sobre superficies tratadas; o la captación o movilidad de un compuesto de fórmula (I). Aditivos de este tipo incluyen agentes tensioactivos (SFA), aditivos de pulverización a base de aceites, por ejemplo, determinados aceites minerales o aceites vegetales naturales (tales como aceite de soja y colza), y mezclas de los mismos con otros adyuvantes bio-potenciadores (ingredientes que pueden ayudar o modificar la acción de un compuesto de fórmula (I)).

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

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

Los SFA 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 sulfonatados (por ejemplo, dodecylbencenosulfonato de sodio, dodecylbencenosulfonato 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 de fosfato (productos de la reacción entre uno o más alcoholes grasos y ácido fosfórico (predominantemente mono-ésteres) o pentóxido de fósforo (predominantemente di-ésteres), por ejemplo, la reacción entre alcohol láurico y ácido tetrafosfórico; adicionalmente estos productos puede estar etoxilados), sulfosuccinamatos, parafina o sulfonatos, tauratos y lignosulfonatos de olefina.

Los SFA adecuados del tipo anfótero incluyen betaínas, propionatos y glicinatos.

SFAs de tipo no iónico adecuados incluyen productos de condensación de óxidos de alquileo, tales como óxido de etileno, óxido de propileno, óxido de butileno o mezclas de los mismos, con alcoholes grasos (tales como alcohol oleílico o alcohol cetílico) o con alquilfenoles (tales 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 polietilenglicólicos de ácidos grasos); óxidos de aminas (por ejemplo, óxido de laurildimetilamina); y lecitinas.

Agentes de suspensión adecuados incluyen coloides hidrófilos (tales como polisacáridos, polivinilpirrolidona o carboximetilcelulosa de sodio) y arcillas hinchables (tales como bentonita o atapulgita).

La composición de la presente puede comprender además al menos un pesticida adicional. Por ejemplo, los compuestos de acuerdo con la invención también se pueden utilizar en combinación con otros herbicidas o reguladores del crecimiento de las plantas. En una realización preferida, el plaguicida adicional es un herbicida y/o un protector de herbicidas. Ejemplos de dichas mezclas incluyen (en donde 'I' representa un compuesto de la fórmula (I)): I + acetoclor; I + acifluorfen (incluyendo acifluorfen-sódico); I + aclonifen; I + ametrina; I + amicarbazona; I + aminopiridil; I + aminotriazol; I + atrazina; I + beflubutamid-M; I + benquitriona; I + bensulfuron (incluyendo bensulfuron-metilo); I + bentazona; I + biciclopirona; I + bilanafos; I + bispiribac-sodio; I + bixlozona; I + bromacil; I + bromoxinil; I + butaclor; I + butafenacil; I + carfentrazona (incluyendo carfentrazona-etilo); I + cloransulam (incluyendo cloransulam-metilo); I + clorimuron (incluyendo clorimuron-etilo); I + clorotoluron; I + clorsulfuron; I + cinmetilina; I + clacyfos; I + cletodim; I + clodinafop (incluyendo clodinafop-propargilo); I + clomazona; I + clopiridil; I + ciclopiranil; I + ciclopirimorato; I + ciclosofurfamuron; I + cyhalofop (incluyendo cyhalofop-butilo); I + 2,4-D (incluyendo la sal de colina y el éster 2-etilhexílico del mismo); I + 2,4-DB; I + desmedifam; I + dicamba (incluyendo las sales de aluminio, aminopropilo, bis-aminopropilmetilo, colina, dicloroprop, diglicolamina, dimetilamina, dimetilamonio, potasio y sodio del mismo); I + diclosulam; I + diflufenican; I + diflufenzopyr; I + dimethaclor; I + dimetenamid-P; I + dibromuro de diquat; I + diuron; I + epirifenacil; I + etalfuralin; I + etofumesato; I + fenoxaprop (incluyendo fenoxaprop-P-etilo); I + fenoxasulfona; I + fenquintona; I + fentrazamida; I + flazasulfuron; I + florasulam; I + florpiauxifen (incluyendo florpiauxifen-bencilo); I + fluazifop (incluyendo fluazifop-P-butilo); I + flucarbazona (incluyendo flucarbazona-sodio); I + flufenacet; I + flumetsulam; I + flumioxazin; I + fluometuron; I + flupyr-sulfuron (incluyendo flupyr-sulfuron-metil-sodio); I + fluroxipyr (incluyendo fluroxipyr-meptilo); I + fomesafen; I + foramsulfuron; I + glufosinato (incluida la sal de amonio de este); I + glifosato (incluidas las sales de diamonio, isopropilamonio y sales de potasio de los mismos); I + halauxifen (incluyendo

5 halauxifen-metilo); I + haloxifop (incluyendo haloxifop-metilo); I + hexazinona; I + hidantocidina; I + imazamox; I + imazapic; I + imazapir; I + imazetapir; I + indaziflam; I + yodosulfuron (incluyendo yodosulfuron-metil-sodio); I + iofensulfuron (incluyendo iofensulfuron-sodio); I + ioxinil; I + isoproturon; I + isoxaflutol; I + lancotriona; I + MCPA; I + MCPB; I + mecoprop-P; I + mesosulfuron (incluyendo mesosulfuron-metilo); I + mesotriona; I + metamitron; I + metazaclor; I + metiozolina; I + metolaclor; I + metosulam; I + metribuzina; I + metsulfuron; I + napropamida; I + nicosulfuron; I + norflurazona; I + oxadiazona; I + oxasulfurona; I + oxifluorfen; I + dicloruro de paraquat; I + pendimetalina; I + penoxsulam; I + fenmedifam; I + picloram; I + pinoxaden; I + pretilaclor; I + primisulfuron-metilo; I + prometrina; I + propanilo; I + propaquizafop; I + propirisulfuron; I + propizamida; I + prosulfocarb; I + prosulfurona; I + piraclonil; I + piraflufen (incluyendo piraflufen-etilo); I + pirasulfotol; I + piridato; I + piriftalid; I + pirimisulfan; I + piroxasulfona; I + piroxsulam; I + quinclorac; I + quinmerac; I + quizalofop (incluyendo quizalofop-P-etilo y quizalofop-P-tefurilo); I + rimsulfuron; I + saflufenacil; I + setoxidim; I + simazina; I + S-metaloclor; I + sulfentrazona; I + sulfosulfuron; I + tebutiuron; I + tefuriltriona; I + tembotriona; I + terbutilazina; I + terbutrina; I + tetflupirrolimet; I + tiencarbazona; I + tifensulfuron; I + tiafenacilo; I + tolpiralato; I + topamezona; I + tralkoxidim; I + triafamona; I + trialato; I + triasulfuron; I + tribenuron (incluyendo tribenuron-metilo); I + triclopir; I + trifloxisulfuron (incluyendo trifloxisulfuron-sodio); I + trifludimoxazina; I + trifluralina; I + triflusulfuron; I + éster etílico del ácido 3-(2-cloro-4-fluoro-5-(3-metil-2,6-dioxo-4-trifluorometil-3,6-dihidropirimidin-1(2H)-il)fenil)-5-metil-4,5-dihidroisoxazol-5-carboxílico; I + 4-hidroxi-1-metoxi-5-metil-3-[4-(trifluorometil)-2-piridil]imidazolidin-2-ona; I + 4-hidroxi-1,5-dimetil-3-[4-(trifluorometil)-2-piridil]imidazolidin-2-ona; I + 5-etoxi-4-hidroxi-1-metil-3-[4-(trifluorometil)-2-piridil]imidazolidin-2-ona; I + 4-hidroxi-1-metil-3-[4-(trifluorometil)-2-piridil]imidazolidin-2-ona; I + 4-hidroxi-1,5-dimetil-3-[1-metil-5-(trifluorometil)pirazol-3-il]imidazolidin-2-ona; I + (4R)-1-(5-terc-butilisoxazol-3-il)-4-etoxi-5-hidroxi-3-metil-imidazolidin-2-ona; I + 3-[2-(3,4-dimetoxifenil)-6-metil-3-oxo-piridazina-4-carbonil]biciclo[3.2.1]octano-2,4-diona; I + 2-[2-(3,4-dimetoxifenil)-6-metil-3-oxo-piridazin-4-carbonil]-5-metil-ciclohexano-1,3-diona; I + 2-[2-(3,4-dimetoxifenil)-6-metil-3-oxo-piridazin-4-carbonil]ciclohexano-1,3-diona; I + 2-[2-(3,4-dimetoxifenil)-6-metil-3-oxo-piridazin-4-carbonil]-5,5-dimetil-ciclohexano-1,3-diona; I + 6-[2-(3,4-dimetoxifenil)-6-metil-3-oxo-piridazin-4-carbonil]-2,2,4,4-tetrametil-ciclohexano-1,3,5-triona; I + 2-[2-(3,4-dimetoxifenil)-6-metil-3-oxo-piridazin-4-carbonil]-5-etil-ciclohexano-1,3-diona; I + 2-[2-(3,4-dimetoxifenil)-6-metil-3-oxo-piridazin-4-carbonil]-4,4,6,6-tetrametil-ciclohexano-1,3-diona; I + 2-[6-ciclopropil-2-(3,4-dimetoxifenil)-3-oxo-piridazin-4-carbonil]biciclo[3.2.1]octano-2,4-diona; I + 2-[6-ciclopropil-2-(3,4-dimetoxifenil)-3-oxo-piridazin-4-carbonil]-5,5-dimetil-ciclohexano-1,3-diona; I + 6-[6-ciclopropil-2-(3,4-dimetoxifenil)-3-oxo-piridazin-4-carbonil]-2,2,4,4-tetrametil-ciclohexano-1,3,5-triona; I + 2-[6-ciclopropil-2-(3,4-dimetoxifenil)-3-oxo-piridazin-4-carbonil]ciclohexano-1,3-diona; I + 4-[2-(3,4-dimetoxifenil)-6-metil-3-oxo-piridazin-4-carbonil]-2,2,6,6-tetrametil-tetrahidropiran-3,5-diona; I + 4-[6-ciclopropil-2-(3,4-dimetoxifenil)-3-oxo-piridazin-4-carbonil]-2,2,6,6-tetrametil-tetrahidropiran-3,5-diona; I + 4-amino-3-cloro-5-fluoro-6-(7-fluoro-1H-indol-6-il)piridin-2-carboxílico (incluyendo ésteres agroquímicamente aceptables de los mismos, por ejemplo, 4-amino-3-cloro-5-fluoro-6-(7-fluoro-1H-indol-6-il)piridin-2-carboxilato de metilo, 4-amino-3-cloro-5-fluoro-6-(7-fluoro-1H-indol-6-il)piridin-2-carboxilato de prop-2-inilo y 4-amino-3-cloro-5-fluoro-6-(7-fluoro-1H-indol-6-il)piridin-2-carboxilato de cianometilo); I + 3-etilsulfanil-N-(1,3,4-oxadiazol-2-il)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxamida; I + 3-(isopropilsulfonilmetil)-N-(5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-il)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxamida; I + 3-(isopropilsulfonilmetil)-N-(5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-il)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxamida; I + 3-(etilsulfonilmetil)-N-(5-metil-1,3,4-oxadiazol-2-il)-5-(trifluorometil)-[1,2,4]triazolo[4,3-a]piridin-8-carboxamida; I + 2-[[3-[[3-cloro-5-fluoro-6-[3-metil-2,6-dioxo-4-(trifluorometil)pirimidin-1-il]-2-piridil]oxi]acetato de etilo; I + 6-cloro-4-(2,7-dimetil-1-naftil)-5-hidroxi-2-metil-piridazin-3-ona; I + 1-[2-cloro-6-(5-cloropirimidin-2-il)oxi-fenil]-4,4,4-trifluoro-butan-1-ona y I + 5-[2-cloro-6-(5-cloropirimidin-2-il)oxi-fenil]-3-(difluorometil)isoxazol.

45 Los componentes de la mezcla que acompañan el compuesto de fórmula (I) también pueden estar en forma de ésteres o sales, como se menciona, por ejemplo, en The Pesticide Manual, decimocuarta edición, British Crop Protection Council, 2006.

50 El compuesto de fórmula (I) también se puede utilizar en mezclas con otros compuestos agroquímicos, tales como fungicidas, nematocidas o insecticidas, ejemplos de los cuales se dan en The Pesticide Manual.

La relación de mezcla del compuesto de fórmula (I) con respecto al participante en la mezcla es preferiblemente de 1: 100 a 1000:1.

55 Las mezclas se pueden usar ventajosamente en las formulaciones mencionadas anteriormente (en cuyo caso "principio activo" se refiere a la mezcla respectiva de compuesto de fórmula (I) con el asociado de mezcla).

60 Los compuestos de fórmula (I) de la presente invención también se pueden combinar con protectores de herbicidas. Combinaciones preferidas (en donde "I" representa un compuesto de fórmula (I)) incluyen I + benoxacor, I + cloquintocet (incluyendo cloquintocet-mexilo), I + cipsosulfamida, I + diclormid, I + fenclorazol (incluyendo fenclorazol-etilo), I + fenclorim, I + fluxofenim, I + furilazol, I + isoxadifen (incluyendo isoxadifen-etilo), I + mefenpir (incluyendo mefenpir-dietilo), I + metcamifen y I + oxabetrinil.

65 Son particularmente preferidas mezclas de un compuesto de fórmula (I) con cipsosulfamida, isoxadifen (incluyendo isoxadifen-etilo), cloquintocet (incluyendo cloquintocet-mexilo) y/o N-(2-metoxibenzoil)-4-[(metil-aminocarbonil)amino]bencenosulfonamida.

Los protectores del compuesto de fórmula (I) también pueden estar en forma de ésteres o sales, tal como se menciona, por ejemplo, en The Pesticide Manual, 14.^a edición (BCPC), 2006. La referencia a cloquintocet-mexilo también se aplica a una sal de litio, sodio, potasio, calcio, magnesio, aluminio, hierro, amonio, amonio cuaternario, sulfonio o fosfonio del mismo, como se desvela en el documento de patente WO 02/34048, y la referencia a fenclorazol-etilo también se aplica a fenclorazol, etc.

Preferiblemente, la relación de mezcla entre el compuesto de fórmula (I) y el protector es desde 100:1 hasta 1:10, especialmente desde 20:1 hasta 1:1.

El compuesto de fórmula (I) también se puede utilizar en mezclas con otros compuestos agroquímicos, tales como fungicidas, nematocidas o insecticidas, ejemplos de los cuales se dan en The Pesticide Manual.

La relación de mezcla del compuesto de fórmula (I) con respecto al participante en la mezcla es preferiblemente de 1:100 a 1000:1.

Las mezclas se pueden usar ventajosamente en las formulaciones mencionadas anteriormente (en cuyo caso "principio activo" se refiere a la mezcla respectiva de compuesto de fórmula (I) con el asociado de mezcla).

La presente invención proporciona todavía además un método de control selectivo de malezas en un emplazamiento que comprende plantas de cultivo y malezas, en donde el método comprende la aplicación al emplazamiento de una cantidad de control de malezas de una composición según la presente invención. El término 'controlar' significa destruir, reducir o retrasar el crecimiento o prevenir o reducir la germinación. En general, las plantas que se van a controlar son plantas no deseadas (malezas). 'Emplazamiento' significa la zona en la que las plantas crecen o crecerán.

Las tasas de aplicación de compuestos de fórmula (I) pueden variar dentro de amplios límites y dependen de la naturaleza del suelo, el método de aplicación (antes o después de la emergencia; recubrimiento de las semillas; aplicación en el surco de la semilla; aplicación sin labranza, etc.), la planta de cultivo, la(s) maleza(s) a controlar, las condiciones climáticas prevalecientes y otros factores regidos por el método de aplicación, el momento de la aplicación y el cultivo objetivo. Los compuestos de fórmula I según la invención se aplican, en general, a una tasa de desde 10 hasta 2000 g/ha, especialmente desde 50 hasta 1000 g/ha.

La aplicación se realiza generalmente pulverizando la composición, normalmente mediante un pulverizador montado en un tractor para áreas grandes, pero también se pueden usar otros métodos tales como espolvoreo (para polvos), goteo o empapado.

Las plantas útiles en las cuales puede utilizarse la composición según la invención incluyen cultivos tales como cereales, por ejemplo, cebada y trigo, algodón, colza oleaginosa, girasol, maíz, arroz, soja, remolacha azucarera, caña de azúcar y pasto.

Las plantas de cultivo también pueden incluir árboles, tales como árboles frutales, palmeras, cocoteros u otros árboles de frutos secos. También se incluyen vides tales como uvas, arbustos frutales, plantas frutales y hortalizas.

También se entenderá que las plantas de cultivo incluyen las plantas de cultivo que se han hecho tolerantes a herbicidas o clases de herbicidas (por ejemplo, inhibidores de ALS, GS, EPSPS, PPO, ACCasa y HPPD) mediante métodos convencionales de reproducción o mediante ingeniería genética. Un ejemplo de un cultivo que se ha vuelto tolerante a las imidazolinonas, por ejemplo imazamox, mediante procedimientos convencionales de cultivo es la colza de verano (canola) Clearfield®. Ejemplos de cultivos que se han vuelto tolerantes a herbicidas mediante procedimientos de ingeniería genética incluyen, por ejemplo, variedades de maíz resistentes al glifosato y al glufosinato disponibles comercialmente con los nombres comerciales RoundupReady® y Liberty Link®. En un aspecto particularmente preferido, la planta de cultivo ha sido manipulada para expresar en exceso homogenisato solanesiltransferasa como se enseña en, por ejemplo, el documento de patente WO2010/029311.

También debe entenderse como cultivos aquellos que se han vuelto resistentes a insectos dañinos mediante métodos de ingeniería genética, por ejemplo, maíz Bt (resistente al barrenador europeo del maíz), algodón Bt (resistente al picudo del algodón) y también patatas Bt (resistente al escarabajo de Colorado). Ejemplos de maíz Bt son los híbridos de maíz Bt 176 de NK® (Syngenta Seeds). La toxina Bt es una proteína formada naturalmente por bacterias *Bacillus thuringiensis* del suelo. Ejemplos de toxinas, o plantas transgénicas capaces de sintetizar dichas toxinas se describen en los documentos EP-A-451 878, EP-A-374 753, WO 93/07278, WO 95/34656, WO 03/052073 y EP-A-427 529. Ejemplos de plantas transgénicas que comprenden uno o más genes que codifican una resistencia a los insecticidas y expresan una o más toxinas son KnockOut® (maíz), Yield Gard® (maíz), NuCOTIN33B® (algodón), Bollgard® (algodón), NewLeaf® (patatas), NatureGard® y Protectra®. Los cultivos de plantas o el material de semillas de los mismos pueden ser resistentes a los herbicidas y, al mismo tiempo, resistentes a la alimentación de insectos (eventos transgénicos "apilados"). Por ejemplo, la semilla puede tener la capacidad de expresar una proteína Cry3 insecticida y al mismo tiempo ser tolerante a glifosato.

También debe entenderse que los cultivos incluyen aquellos que se obtienen mediante procedimientos convencionales de cultivo o ingeniería genética y que contienen los denominados rasgos productivos (por ejemplo, estabilidad mejorada en almacenamiento, mayor valor nutritivo y sabor mejorado).

- 5 Otras plantas útiles incluyen césped, por ejemplo, en campos de golf, céspedes, parques y bordes de carreteras, o cultivadas comercialmente para césped, y plantas ornamentales tales como flores o arbustos.

10 Las composiciones pueden usarse para controlar plantas no deseadas (en conjunto, 'malezas'). Las malezas a controlar incluyen tanto especies monocotiledóneas, por ejemplo Las malezas también pueden incluir plantas que pueden considerarse plantas de cultivo pero que crecen fuera del área de cultivo ('escapes'), o que crecen de la semilla caída de una siembra previa de un cultivo diferente ('voluntarios'). Dichos voluntarios o escapes pueden ser tolerantes a otros herbicidas determinados.

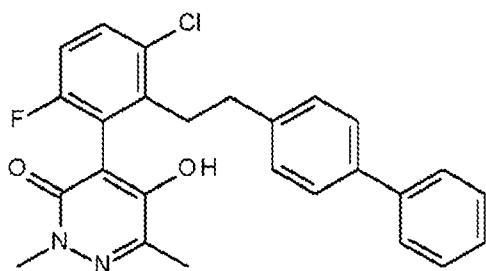
- 15 Diversos aspectos y realizaciones de la presente invención se ilustrarán ahora en mayor detalle a modo de ejemplo. Se apreciará que pueden realizarse modificaciones de detalles sin apartarse del alcance de la invención.

Abreviaturas típicas usadas en el presente documento incluyen:

- 20 a = ancho Dba
 'Bu = terc-butilo
 d = doblete
 25 dba = dibencilidenacetona
 DCM = diclorometano
 DMSO = sulfóxido de dimetilo
 30 DPPA = azida de difenilfosforilo
 EtzO = dietil éter
 35 EtOAc = acetato de etilo
 h = hora
 m = multiplete
 40 Me = metilo
 MeOH = metanol
 45 Ph = fenilo
 'Pr = isopropilo
 Ta = temperatura ambiente
 50 s = singlete
 t = triplete
 55 THF = tetrahidrofurano

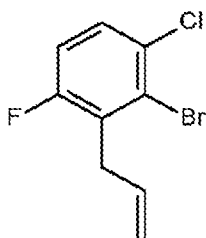
EJEMPLOS DE PREPARACIÓN

- 60 **Ejemplo 1 Preparación de 4-[3-cloro-6-fluoro-2-[2-(4-fenilfenil)etil]fenil]-5-hidroxi-2,6-dimetil-piridazin-3-ona (A-1.027)**



1.1 3-Alil-2-bromo-1-cloro-4-fluoro-benceno

- 5 Se enfrió una disolución de diisopropilamida de litio (2 M en tetrahidrofurano, 3,6 ml, 7,2 mmoles) hasta -78 °C en nitrógeno. Se añadió gota a gota una disolución de 2-bromo-1-cloro-4-fluorobenceno (1,0 g, 4,8 mmoles) en tetrahidrofurano a -78 °C. La mezcla se agitó durante 45 minutos a la misma temperatura antes de tratarla con bromuro de alilo (0,3 ml, 5,7 mmoles). La reacción se prolongó a -78 °C durante 2 h y después se permitió que se calentara hasta temperatura ambiente. La reacción se inactivó con NH₄Cl sat. (ac) y se extrajo con acetato de etilo. Se separaron las fracciones orgánicas y se guardaron, a continuación se lavaron con salmuera. Las fracciones orgánicas se secaron con sulfato de sodio y se concentraron a presión reducida obteniéndose 3-alil-2-bromo-1-cloro-4-fluorobenceno (1,2 g, 100 %) como un aceite.



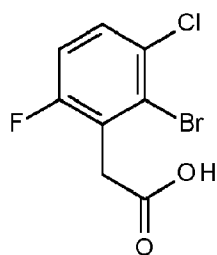
- 15 ¹H RMN (400 MHz, CDCl₃) δ_H: 7,34-7,30 (m, 1H), 7,01-6,96 (m, 1H), 5,94-5,83 (m, 1H), 5,10-5,00 (m, 2H), 3,64-3,58 (m, 2H).

1.2 Ácido 2-(2-bromo-3-cloro-6-fluoro-fenil)acético

- 20 Una disolución de 3-alil-2-bromo-1-cloro-4-fluorobenceno (15,0 g, 60,1 mmoles) en diclorometano (200 ml) en un matraz de 2 bocas se enfrió hasta -78 °C. Una boca lateral se conectó a una trampa que contenía una disolución acuosa de KI. Se burbujeó ozono a través de la disolución hasta que se consumió por completo el material de partida (5 horas). Se burbujeó aire a través de la disolución durante 10 minutos para eliminar el exceso de ozono. Se añadió sulfuro de dimetilo (44 ml, 601 mmoles) y se permitió que la mezcla se calentara hasta temperatura ambiente. La reacción continuó durante 16 h a temperatura ambiente.

- 30 La mezcla se lavó con salmuera (2 × 100 ml) y se guardó la fase orgánica. Los extractos orgánicos se secaron sobre Na₂SO₄, se filtraron y se concentraron a presión reducida dando 2-(2-bromo-3-cloro-6-fluoro-fenil)acetaldehído (15,3 g) en bruto que se usó para la siguiente etapa sin purificación adicional.

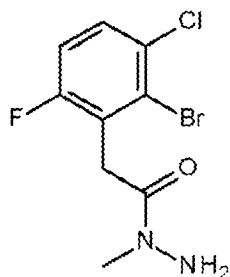
- 35 Se disolvió 2-(2-bromo-3-cloro-6-fluorofenil)acetaldehído en bruto (15,3 g, 60,8 mmoles) en una mezcla de terc-butanol (92 ml) y agua (46 ml), y a continuación se enfrió hasta 0 °C. Se añadieron 2-metilbut-2-eno (64,5 ml, 608 mmoles), dihidrogenofosfato de sodio (34,6 g, 243 mmoles) y clorito de sodio (16,5 g, 163 mmoles). La mezcla se agitó durante 2 h, a continuación se diluyó con salmuera (150 ml) y ácido clorhídrico 2 M (150 ml). La mezcla se extrajo con acetato de etilo (3 × 100 ml). Los extractos orgánicos combinados se lavaron con una disolución acuosa saturada de metabisulfito sódico (100 ml), después se secó sobre Na₂SO₄, se filtró y se concentró a presión reducida proporcionando un sólido de color amarillo pálido. El sólido en bruto se disolvió en una mezcla de agua (100 ml) y NaOH 2,0 M (30 ml). La disolución acuosa se lavó con acetato de etilo (100 ml) y se desecharon las fracciones orgánicas. La fase acuosa se acidificó mediante la adición de ácido clorhídrico concentrado (20 ml) lo que dio como resultado la formación de una suspensión blanca. La mezcla se extrajo con acetato de etilo (3 × 200 ml). Los extractos orgánicos combinados se lavaron con salmuera, se secaron sobre Na₂SO₄, se filtraron y se evaporaron proporcionando ácido 2-(2-bromo-3-cloro-6-fluoro-fenil)acético (8,0 g, 49 %) en forma de un sólido blanco.



^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ_{H} : 12,79 (a.s, 1H), 7,67-7,59 (m, 1H), 7,39-7,31 (m, 1H), 3,82 (s, 2H).

5 1.3 2-(2-Bromo-3-cloro-6-fluoro-fenil)-*N*-metil-acetohidrazida

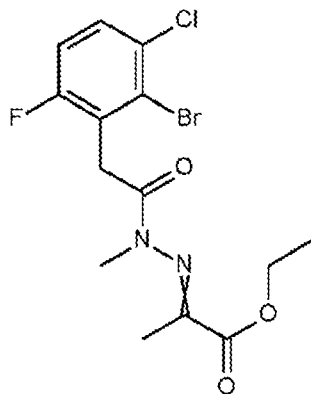
A una disolución con agitación de ácido 2-(2-bromo-3-cloro-6-fluoro-fenil)acético (2,0 g, 7,5 mmoles) en diclorometano (20 ml) a 0 °C se añadió clorhidrato de *N*-(3-dimetilaminopropil)-*N'*-etilcarbodiimida [EDC.HCl] (1,4 g, 9,0 mmoles), seguido de la adición gota a gota de metilhidrazina (0,4 ml, 7,5 mmoles). La temperatura de la mezcla de reacción se mantuvo a 0 °C durante 3 h. A continuación, la reacción se enfrió rápidamente con agua y se extrajo con diclorometano. Los extractos orgánicos se separaron, se lavaron con salmuera y se secaron sobre Na_2SO_4 . La concentración a presión reducida proporcionó 2-(2-bromo-3-cloro-6-fluorofenil)-*N*-metilacetohidrazida en bruto (1,8 g, 81 %) que se utilizó en la siguiente etapa sin una purificación adicional.



^1H RMN (400 MHz, DMSO- d_6) δ_{H} : 7,59 (dd, $J=8,9$ y $5,4$, 1H), 7,30 (t, $J=8,9$, 1H), 4,91 (s, 2H), 4,10 (s a, 2H), 3,02 (s, 3H).

20 1.4 Éster etílico del ácido 2-[[2-(2-bromo-3-cloro-6-fluorofenil)acetil]metilhidrazono}propiónico

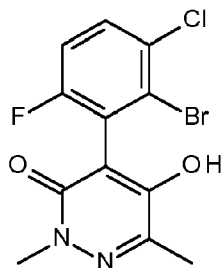
A una disolución con agitación de 2-(2-bromo-3-cloro-6-fluorofenil)-*N*-metilacetohidrazida (1,8 g, 6,09 mmoles) en etanol (5 ml) se añadió gota a gota piruvato de etilo (0,7 ml, 6,7 mmoles). La reacción se calentó a 80 °C durante 4 h. A continuación, se permitió que la mezcla de reacción se enfriara hasta temperatura ambiente y se evaporó a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice (un gradiente de acetato de etilo/hexano como eluyente) obteniéndose el compuesto deseado, éster etílico del ácido 2-[[2-(2-bromo-3-cloro-6-fluoro-fenil)acetil]metilhidrazono}propiónico (1,8 g, 75 %) como un sólido blanquecino.



^1H RMN (400 MHz, CDCl_3) δ_{H} : 7,40-7,35 (m, 1H), 7,04-6,98 (m, 1H), 4,32 (c, $J=7,1$, 2H), 4,24 (s, 2H), 3,41 (s, 3H), 2,32 (s, 3H), 1,36 (t, $J=7,1$, 3H).

35 1.5 4-(2-Bromo-3-cloro-6-fluoro-fenil)-5-hidroxi-2,6-dimetil-piridazin-3-ona

Se disolvió el éster etílico del ácido 2-[[2-(2-bromo-3-cloro-6-fluorofenil)acetil]metilhidrazono}propiónico (500 mg, 1,27 mmoles) en acetonitrilo (2,5 ml) y se trató con 1,8-diazabicyclo[5.4.0]undec-7-eno [DBU] (0,47 ml, 3,2 mmoles). La mezcla se calentó a 125 °C utilizando irradiación de microondas durante 1 h. A continuación, la mezcla de reacción se evaporó a presión reducida. El residuo se disolvió en agua y se acidificó hasta pH 1 con ácido clorhídrico 2 N. La mezcla se extrajo con DCM, la fase orgánica se separó y se lavó con salmuera. La disolución orgánica se secó sobre Na₂SO₄ y se concentró a presión reducida dando el producto en bruto. El producto en bruto se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice (un gradiente de acetato de etilo/hexano como eluyente) obteniéndose 4-(2-bromo-3-cloro-6-fluorofenil)-5-hidroxi-2,6-dimetilpiridazin-3-ona (340 mg, 77,1 %) como un sólido blanquecino.

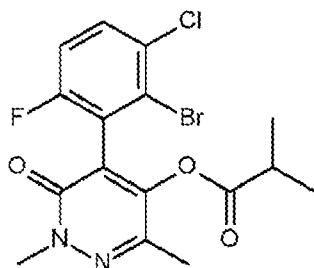


¹H RMN (400 MHz, DMSO-d₆) δ_H: 11,01 (s, 1H), 7,77-7,73 (m, 1H), 7,39 (t, J=8,7, 1H), 3,58 (s, 3H), 2,24 (s, 3H).

1.6 2-Metilpropanoato de [5-(2-bromo-3-cloro-6-fluoro-fenil)-1,3-dimetil-6-oxo-piridazin-4-ilo]

A una disolución con agitación de 4-(2-bromo-3-cloro-6-fluorofenil)-5-hidroxi-2,6-dimetilpiridazin-3-ona (1,4 g, 4,02 mmoles) en diclorometano (32 ml) a la que se añadieron trietilamina (1,1 ml, 8,06 mmoles), 4-(dimetilamino)piridina [DMAP] (49 mg, 0,40 mmoles) y cloruro de isobutililo (0,6 ml, 4,83 mmoles).

Una vez que se consideró que había finalizado, la reacción se diluyó con diclorometano y agua. La capa orgánica se separó, se secó sobre Na₂SO₄, y concentró a presión reducida dando producto en bruto. El producto en bruto se purificó mediante cromatografía en columna de gel de sílice (un gradiente de acetato de etilo/hexano como eluyente) obteniéndose 2-metilpropanoato de [5-(2-bromo-3-cloro-6-fluorofenil)-1,3-dimetil-6-oxopiridazin-4-ilo] (1,47 g, 87 %).

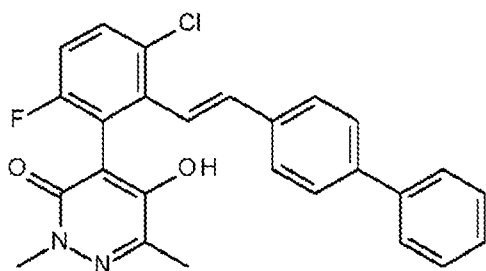


¹H RMN (400 MHz, CDCl₃) δ_H: 7,51-7,47 (m, 1H), 7,10-7,05 (m, 1H), 3,82 (s, 3H), 2,60-2,55 (m, 1H), 2,25 (s, 3H), 1,02-0,98 (m, 6H).

1.7 4-[3-cloro-6-fluoro-2-[(E)-2-(4-fenilfenil)vinil]fenil]-5-hidroxi-2,6-dimetilpiridazin-3-ona (A-2.027)

Se combinaron 2-metilpropanoato de [5-(2-bromo-3-cloro-6-fluoro-fenil)-1,3-dimetil-6-oxo-piridazin-4-ilo] (0,54 g, 1,3 mmoles), K₂CO₃ (0,55 g, 3,9 mmoles), ácido *trans*-2-(4-fenilfenil)vinilborónico (0,44 g, 2,00 mmoles), PdCl₂(dppf).DCM (53 mg, 0,065 mmoles), 1,4-dioxano (13 ml) y H₂O (3,3 ml) en un vial de microondas de 20 ml, a continuación se calentó a 140 °C durante 30 min bajo irradiación microondas.

La mezcla de reacción se concentró a vacío para retirar el 1,4-dioxano, a continuación se repartió entre HCl 2 N (ac) y DCM. La fase orgánica se separó y la fase acuosa se extrajo más porciones de DCM (x2). Los extractos orgánicos combinados se concentraron a vacío dando un residuo en bruto que se purificó por cromatografía en columna sobre gel de sílice (eluyente un gradiente de acetato de etilo/hexano) dando 4-[3-cloro-6-fluoro-2-[(E)-2-(4-fenilfenil)vinil]fenil]-5-hidroxi-2,6-dimetil-piridazin-3-ona (343 mg, 53 %, A-2.027) como una espuma amarilla.

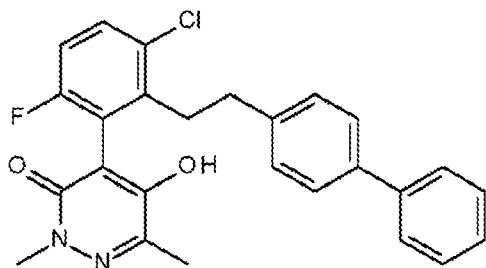


¹H RMN (400 MHz, cloroformo) δ = 7,59 - 7,33 (m, 10H), 7,07 (t, J = 8,6 Hz, 1H), 7,01 (d, J = 16,4 Hz, 1H), 6,70 (d, J = 16,5 Hz, 1H), 5,63 (s, 1H), 3,73 (s, 3H), 2,28 (s, 3H)

1.8 4-(3-Cloro-6-fluoro-2-fenetil-fenil)-5-hidroxi-2,6-dimetil-piridazin-3-ona (A-1.027)

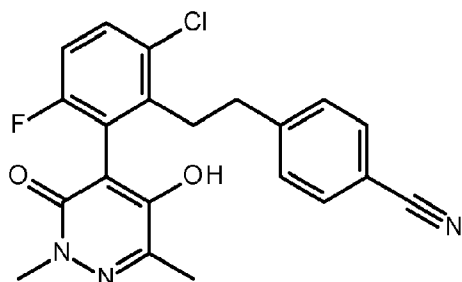
A un matraz redondo de 10 ml se añadió 5 % de Pd/C (73 mg, 0,034 mmoles) seguido por una disolución de 4-[3-cloro-6-fluoro-2-[(E)-2-(4-fenilfenil)vinil]fenil]-5-hidroxi-2,6-dimetilpiridazin-3-ona (308 mg, 0,69 mmoles) en 10:1 (v/v) de DCM/MeOH (4 ml). A continuación se añadió B₂(OH)₄ (325 mg, 3,45 mmoles) y la mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante la noche.

A continuación, la mezcla de reacción se filtró a través de Celite®, eluyendo con 10:1 (v/v) de DCM/MeOH. El filtrado se cargó seco sobre sílice y se purificó por cromatografía en columna sobre gel de sílice (eluyente un gradiente de acetato de etilo / hexano) dando 4-[3-cloro-6-fluoro-2-[2-(4-fenilfenil)etil]fenil]-5-hidroxi-2,6-dimetil-piridazin-3-ona (299 mg, rendimiento del 97 %, **A-1027**) como un aceite amarillo que solidificó dejándolo estar.



¹H RMN (400 MHz, cloroformo) δ = 7,57 - 7,52 (m, 2H), 7,50 - 7,40 (m, 5H), 7,37 - 7,30 (m, 1H), 7,07 (d, J = 8,2 Hz, 2H), 7,02 (t, J = 8,6 Hz, 1H), 5,47 (s, 1H), 3,75 (s, 3H), 2,88 - 2,80 (m, 3H), 2,27 (s, 3H)

Ejemplo 2 Preparación de 4-[2-[6-cloro-3-fluoro-2-(5-hidroxi-2,6-dimetil-3-oxopiridazin-4-il)fenil]etil]benzonitrilo (A-1.036)

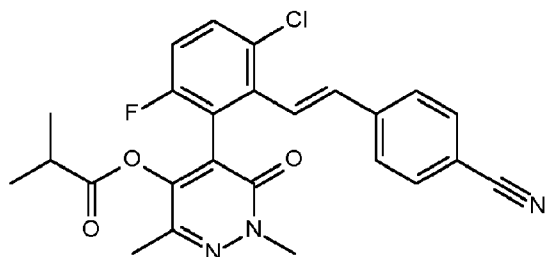


2.1 2-Metilpropanoato de [5-[3-cloro-2-[(E)-2-(4-cianofenil)vinil]-6-fluoro-fenil]-1,3-dimetil-6-oxopiridazin-4-ilo] (4.036)

Se combinaron 2-metilpropanoato de [5-(2-bromo-3-cloro-6-fluoro-fenil)-1,3-dimetil-6-oxo-piridazin-4-ilo] (1,10 g, 2,63 mmoles) [preparado como se describe en el Ejemplo 1] y cloro[(tri-terc-butilfosfina)-2-(2-aminobifenil)]paladio (II) (68 mg, 0,13 mmoles) en tolueno desgasificado (12 ml). A continuación se añadieron 4-vinilbenzonitrilo (408 mg, 3,16 mmoles) y base de Hunig (0,92 ml, 5,27 mmoles) y la mezcla de reacción se calentó hasta 95 °C durante 2,5 h.

La mezcla de reacción se dejó enfriar hasta temperatura ambiente, a continuación se diluyó con diclorometano y se filtró a través de Celite, lavando con diclorometano adicional. El filtrado se concentró a vacío, a continuación se purificó por cromatografía en columna sobre gel de sílice (eluyente un gradiente de acetato de etilo / hexano) dando 2-

metilpropanoato de [5-[3-cloro-2-[(E)-2-(4-cianofenil)vinil]-6-fluoro-fenil]-1,3-dimetil-6-oxo-piridazin-4-ilo] (781 mg, rendimiento del 64 %, **A-4.036**) como un sólido blanco



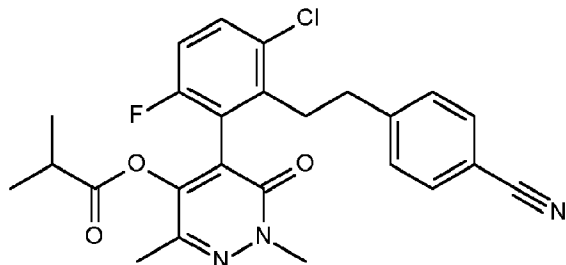
¹H RMN (400MHz, cloroformo) δ = 7,62 - 7,55 (m, 2H), 7,45 (dd, J=5,0, 8,5 Hz, 1H), 7,45 - 7,40 (m, 1H), 7,13 (d, J=16,5 Hz, 1H), 7,05 (t, J=8,5 Hz, 1H), 6,68 (d, J=16,5 Hz, 1H), 3,69 (s, 3H), 2,65 (spt, J=7,0 Hz, 1H), 2,23 (s, 3H), 1,11 (d, J=7,0 Hz, 3H), 1,07 (d, J=7,0 Hz, 3H).

2.2 2-Metilpropanoato de [5-[3-cloro-2-[2-(4-cianofenil)etil]-6-fluoro-fenil]-1,3-dimetil-6-oxopiridazin-4-ilo] (**A-3.036**)

Se sometió 2-metilpropanoato de [5-[3-cloro-2-[(E)-2-(4-cianofenil)vinil]-6-fluoro-fenil]-1,3-dimetil-6-oxo-piridazin-4-ilo] (900 mg, 1,93 mmoles) a hidrogenación catalítica en EtOAc (20 ml) sobre 5 % de catalizador de Pd/C (50 % húmedo) (0,82 g) a 4 bares de H₂.

Después de 1,5 h, la CL/EM mostró reacción completa. La mezcla de reacción se filtró a través de una capa de Celite®, lavando con acetato de etilo. El filtrado se concentró a vacío proporcionando un residuo en bruto.

El residuo se adsorbió sobre sílice y se purificó por cromatografía en columna sobre gel de sílice (eluyente un gradiente de acetato de etilo / hexano) dando 2-metilpropanoato de [5-[3-cloro-2-[2-(4-cianofenil)etil]-6-fluorofenil]-1,3-dimetil-6-oxo-piridazin-4-ilo] (800 mg, rendimiento del 81 %, **A-3.036**) como un sólido blanco.



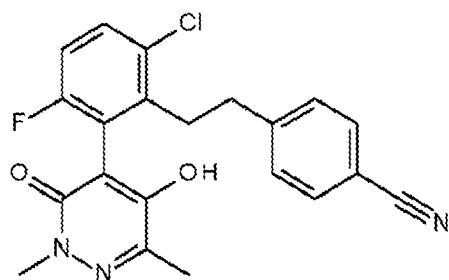
¹H RMN (400 MHz, cloroformo) δ = 7,56 - 7,51 (m, 2H), 7,42 (dd, J = 5,2, 8,9 Hz, 1H), 7,26 - 7,21 (m, 2H), 7,00 (t, J = 8,9 Hz, 1H), 3,84 (s, 3H), 3,02 - 2,92 (m, 1H), 2,91 - 2,80 (m, 2H), 2,75 - 2,65 (m, 1H), 2,54 (spt, J = 7,0 Hz, 1H), 2,25 (s, 3H), 0,98 (d, J = 7,0 Hz, 3H), 0,95 (d, J = 7,0 Hz, 3H).

2.3 4-[2-[6-Cloro-3-fluoro-2-(5-hidroxi-2,6-dimetil-3-oxo-piridazin-4-il)fenil]etil]benzonitrilo (**A-1.036**)

Se disolvió 2-metilpropanoato de [[5-[3-cloro-2-[2-(4-cianofenil)etil]-6-fluoro-fenil]-1,3-dimetil-6-oxo-piridazin-4-ilo] (400 mg, 0,855 mmoles) en etanol (6 ml). La mezcla se trató con una disolución de hidróxido de litio (108 mg, 2,56 mmoles) en agua (2 ml). La reacción se agitó a temperatura ambiente durante 2 h.

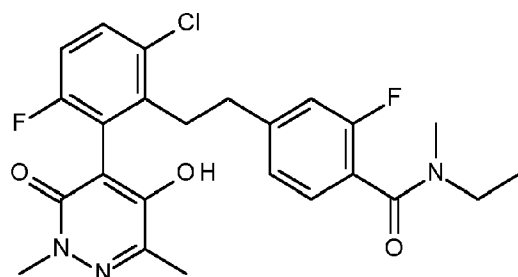
La mezcla de reacción se concentró a vacío para retirar etanol. La restante disolución acuosa se diluyó con agua (15 ml), a continuación se acidificó hasta ~pH 3 con HCl 2 M y se extrajo con DCM (3 x 10 ml). Los extractos orgánicos combinados se secaron sobre MgSO₄, se filtraron y se concentraron a vacío proporcionando el producto en bruto.

El producto en bruto se purificó por cromatografía en columna sobre gel de sílice (eluyente un gradiente de acetato de etilo/hexano) dando 4-[2-[6-cloro-3-fluoro-2-(5-hidroxi-2,6-dimetil-3-oxo-piridazin-4-il)fenil]etil]benzonitrilo (83 mg, rendimiento del 91 %, **A-1.036**) como un sólido blanco.



¹H RMN (400 MHz, CDCl₃) δ ppm 7,46 - 7,51 (m, 2 H) 7,26 - 7,31 (m, 1 H) 7,08 (d, J=8,19 Hz, 2 H) 6,86 (t, J=8,50 Hz, 1 H) 3,63 (s, 3 H) 2,61 - 2,77 (m, 4 H) 2,24 (s, 3 H).

Ejemplo 4 Preparación de 4-[2-[6-cloro-3-fluoro-2-(5-hidroxi-2,6-dimetil-3-oxopiridazin-4-il)fenil]etil]-N-etil-2-fluoro-N-metil-benzamida (A-1.028)

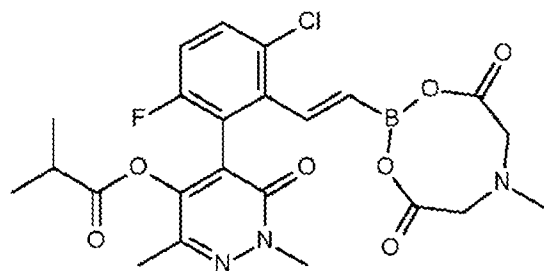


4.1 2-Metilpropanoato de [5-[3-cloro-6-fluoro-2-[(E)-2-(6-metil-4,8-dioxo-1,3,6,2-dioxazaborocan-2-il)vinil]fenil]-1,3-dimetil-6-oxo-piridazin-4-ilo]

Se cargaron 2-metil-propanoato de [5-(2-bromo-3-cloro-6-fluoro-fenil)-1,3-dimetil-6-oxo-piridazin-4-ilo] (5,00 g, 11,97 mmoles, 1,0 equiv.), 6-metil-2-vinil-1,3,6,2-dioxazaborocano-4,8-diona (2,63 g, 14,36 mmoles, 1,2 equiv.) y cloro[(tri-terc-butilfosfina)-2-(2-aminobifenil)]paladio (II) (307 mg, 0,60 mmoles, 0,05 equiv.) en un matraz de fondo redondo de 250 ml equipado con un condensador, una barra agitadora y un burbujeador de nitrógeno. Se añadió THF (100 ml) seguido de N,N-diisopropiletilamina (4,2 ml, 23,94 mmoles, 2,0 equiv.) frente a un flujo de nitrógeno y la mezcla se calentó a reflujo durante 3 h.

La mezcla de reacción se dejó enfriar a temperatura ambiente, después se diluyó en DCM y se filtró a través de Celite®, lavando con porciones adicionales de DCM. Después, el eluyente se concentró a sequedad.

El producto en bruto se purificó mediante cromatografía en columna ultrarrápida proporcionando 2-metilpropanoato de [5-[3-cloro-6-fluoro-2-[(E)-2-(6-metil-4,8-dioxo-1,3,6,2-dioxazaborocan-2-il)vinil]fenil]-1,3-dimetil-6-oxo-piridazin-4-ilo] (5,91 g, 11,4 mmoles, rendimiento del 95 %) en forma de un sólido de color blanquecino.



¹H RMN (400 MHz, DMSO-d₆) δ = 7,63 (dd, J = 5,1,8,9 Hz, 1H), 7,31 (t, J = 8,9 Hz, 1H), 6,65 (d, J = 18,3 Hz, 1H), 5,68 (d, J = 18,3 Hz, 1H), 4,24 (dd, J = 11,9, 17,2 Hz, 2H), 3,95 - 3,83 (m, 2H), 3,70 (s, 3H), 2,66 (spt, J = 7,0 Hz, 1H), 2,16 (s, 3H), 0,90 (d, J = 7,0 Hz, 3H), 0,89 (d, J = 7,0 Hz, 3H)

4.2 2-Metilpropanoato de [5-[3-cloro-2-[2-[4-[etil(metil)carbamoil]-3-fluoro-fenil]etil]-6-fluorofenil]-1,3-dimetil-6-oxo-piridazin-4-ilo] (A-3.028)

Se añadieron 2-metilpropanoato de [5-[3-cloro-6-fluoro-2-[(E)-2-(6-metil-4,8-dioxo-1,3,6,2-dioxazaborocan-2-il)vinil]fenil]-1,3-dimetil-6-oxo-piridazin-4-ilo] (500 mg, 0,96 mmoles), K₃PO₄ (886 mg, 3,85 mmoles) y complejo de 1,1-bis(difenilfosfino)ferroceno]dicloropaladio (II)-diclorometano [PdCl₂(dppf).DCM] (39 mg, 0,05 mmoles) a un vial de

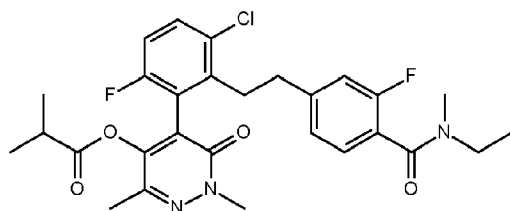
microondas de 20 ml. Se añadieron THF (10 ml), 4-bromo-N-etil-2-fluoro-N-metil-benzamida (500 mg, 1,92 mmoles) y agua (0,35 ml), a continuación la mezcla de reacción se calentó hasta 100 °C durante 2 horas bajo irradiación de microondas.

La mezcla de reacción se concentró a vacío para retirar el THF, a continuación se diluyó con agua (20 ml) y DCM (20 ml). La fase orgánica se separó, y la fase acuosa se extrajo con DCM (3 × 5 ml). Los extractos orgánicos combinados se secaron y se concentraron a vacío dando un residuo en bruto que se purificó por cromatografía en columna sobre gel de sílice, eluyendo con un gradiente de ciclohexano/acetato de etilo, dando 2-metilpropanoato de [5-[3-cloro-2-[(E)-2-[4-[etil(metil)carbamoil]-3-fluoro-fenil]vinil]-6-fluoro-fenil]-1,3-dimetil-6-oxo-piridazin-4-ilo] (397 mg, rendimiento del 76 %, **A-4.028**) como un sólido blanquecino.

Se sometió 2-metilpropanoato de [5-[3-cloro-2-[(E)-2-[4-[etil(metil)carbamoil]-3-fluoro-fenil]vinil]-6-fluoro-fenil]-1,3-dimetil-6-oxo-piridazin-4-ilo] (300 mg, 0,55 mmoles) a hidrogenación catalítica en EtOAc (6 ml) sobre 5 % de catalizador de Pd/C (50 % húmedo) (0,12 g) a 3 bares de H₂.

Después de 5,5 h, la CL/EM mostró reacción completa. La mezcla de reacción se filtró a través de una capa de Celite®, lavando con acetato de etilo / metanol. El filtrado se concentró a vacío proporcionando un residuo en bruto.

El residuo se adsorbió sobre sílice y se purificó por cromatografía en columna sobre gel de sílice (eluyente un gradiente de acetato de etilo / hexano) dando 2-metilpropanoato de [5-[3-cloro-2-[2-[4-[etil(metil)carbamoil]-3-fluoro-fenil]etil]-6-fluoro-fenil]-1,3-dimetil-6-oxo-piridazin-4-ilo] (285 mg, rendimiento del 95 %, **A-3.028**) como una goma incolora.



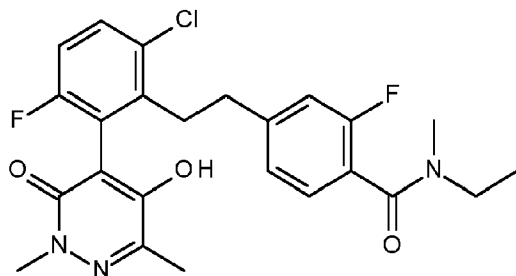
[RMN de mezcla de rotámeros] ¹H RMN (400 MHz, cloroformo) δ = 7,42 (dd, J = 5,1, 8,9 Hz, 1H), [7,25 (t, J = 7,2 Hz, 0,5H), 7,21 (t, J = 7,5 Hz, 0,5H)], 6,99 (t, J = 8,9 Hz, 1H), 6,96 (dd, J = 1,2, 7,5 Hz, 1H), [6,89 (dd, J = 1,2, 6,9 Hz, 1H), 6,86 (dd, J = 1,2, 6,9 Hz, 1H)], 3,85 (s, 3H), [3,59 (c, J = 7,4 Hz, 1H), 3,24 (c, J = 7,4 Hz, 1H)], [3,08 (s, 1,5H), 2,90 (s a, 1,5H)], 2,88 - 2,78 (m, 3H), 2,75 - 2,64 (m, 1H), 2,55 (spt, J = 7,0 Hz, 1H), 2,26 (s, 3H), [1,23 (t, J = 7,2 Hz, 1,5H), 1,10 (t, J = 7,2 Hz, 1,5H)], 0,98 (d, J = 7,0 Hz, 3H), 0,96 (d, J = 7,1 Hz, 3H)

4.3 4-[2-[6-Cloro-3-fluoro-2-(5-hidroxi-2,6-dimetil-3-oxo-piridazin-4-il)fenil]etil]-N-etil-2-fluoro-N-metil-benzamida (**A-1.028**)

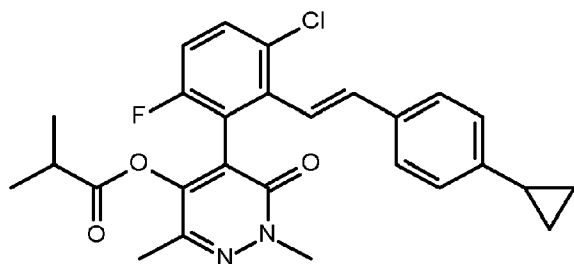
Se disolvió 2-metilpropanoato de [5-[3-cloro-2-[2-[4-[etil(metil)carbamoil]-3-fluoro-fenil]etil]-6-fluoro-fenil]-1,3-dimetil-6-oxo-piridazin-4-ilo] (300 mg, 0,55 mmoles) en etanol (3 ml). La mezcla se trató con una disolución de hidróxido de litio (69 mg, 1,65 mmoles) en agua (3 ml). La reacción se agitó a temperatura ambiente durante 2 h.

La mezcla de reacción se concentró a vacío para retirar el etanol. La restante disolución acuosa se diluyó con agua (15 ml), a continuación se acidificó hasta ~pH 3 con HCl 2 M y se extrajo con DCM (3 × 10 ml). Los extractos orgánicos combinados se secaron y se concentraron a vacío proporcionando el producto en bruto.

El producto en bruto se purificó por cromatografía en columna sobre gel de sílice (eluyente un gradiente de DCM / metanol) dando 4-[2-[6-cloro-3-fluoro-2-(5-hidroxi-2,6-dimetil-3-oxo-piridazin-4-il)fenil]etil]-N-etil-2-fluoro-N-metil-benzamida (224 mg, rendimiento del 86 %, **A-1.028**) como un sólido blanco.

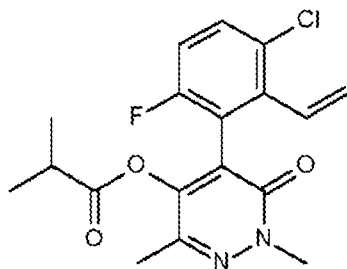


[RMN de mezcla de rotámeros] ¹H RMN (400 MHz, DMSO-d₆) δ = 10,86 (s a, 1H), 7,55 - 7,49 (m, 1H), 7,25 - 7,19 (m, 2H), 6,95 - 6,89 (m, 2H), 3,61 (s, 3H), 3,46 (c, J = 7,1 Hz, 1H), 3,12 (c, J = 7,1 Hz, 1H), 2,95 (s, 1,5H), 2,78 (s, 1,5H), 2,78 - 2,63 (m, 4H), 2,26 (s, 3H), 1,11 (t, J = 7,1 Hz, 1,5H), 1,00 (t, J = 7,1 Hz, 1,5H).

Ejemplo 5 Preparación de 2-metilpropanoato de [5-[3-cloro-2-[(E)-2-(4-ciclopropilfenil)vinil]-6-fluorofenil]-1,3-dimetil-6-oxo-piridazin-4-ilo](A-4.038)**5.1 2-Metilpropanoato de [5-(3-cloro-6-fluoro-2-vinil-fenil)-1,3-dimetil-6-oxo-piridazin-4-ilo]**

Se disolvieron 2-metilpropanoato de [5-(2-bromo-3-cloro-6-fluoro-fenil)-1,3-dimetil-6-oxo-piridazin-4-ilo] (4,177 g, 10,00 mmoles, 1,0 eq) y tributil(vinil)estannano (4,384 ml, 15,00 mmoles, 1,50 eq) en tolueno (60,00 ml), a continuación se añadió complejo 1,1-bis(difenilfosfino)ferroceno]dicloropaladio (II)-diclorometano [PdCl₂(dppf).DCM] (408 mg, 0,50 mmoles, 0,05 eq). La mezcla de reacción se calentó a reflujo durante la noche.

La mezcla de reacción se dejó enfriar a temperatura ambiente, después se concentró a vacío. El producto en bruto se purificó entonces por cromatografía ultrarrápida en columna proporcionando 2-metilpropanoato de [5-(3-cloro-6-fluoro-2-vinil-fenil)-1,3-dimetil-6-oxo-piridazin-4-ilo] como un sólido blanquecino (3,02 g, rendimiento del 83 %).



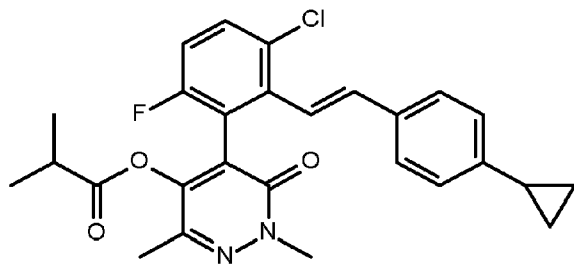
¹H RMN (400MHz, CDCl₃) δ = 7,40 (dd, J=5,1, 8,7 Hz, 1H), 6,99 (t, J=8,7 Hz, 1H), 6,65 (dd, J=11,6, 17,6 Hz, 1H), 5,37 - 5,30 (m, 2H), 3,79 (s, 3H), 2,59 (spt, J=7,0 Hz, 1H), 2,23 (s, 3H), 1,04 (d, J=7,0 Hz, 4H), 1,03 (d, J=7,0 Hz, 1H)

5.2 2-Metilpropanoato de [5-[3-cloro-2-[(E)-2-(4-ciclopropilfenil)vinil]-6-fluoro-fenil]-1,3-dimetil-6-oxo-piridazin-4-ilo](A-4.038)

Una mezcla con agitación de 2-metilpropanoato de [5-(3-cloro-6-fluoro-2-vinil-fenil)-1,3-dimetil-6-oxo-piridazin-4-ilo] (300 mg, 1,0 eq), cloro[(tri-terc-butilfosfina)-2-(2-aminobifenil)]paladio (II) (21 mg, 0,05 eq), 1-bromo-4-ciclopropilbenceno (243 mg, 1,5 eq) y N,N-diisopropiletilamina (0,29 ml, 2,0 eq) en tolueno (5 ml) bajo nitrógeno se calentó a reflujo durante 3 h.

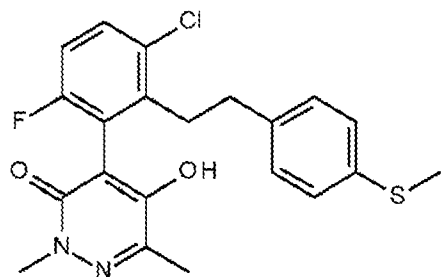
La mezcla de reacción se dejó enfriar a temperatura ambiente, después se diluyó con DCM y se filtró a través de una almohadilla de Celite, eluyendo con porciones adicionales de DCM. El filtrado se concentró a vacío dando el producto en bruto.

El producto en bruto se purificó por cromatografía ultrarrápida en columna dando 2-metilpropanoato de [5-[3-cloro-2-[(E)-2-(4-ciclopropilfenil)vinil]-6-fluoro-fenil]-1,3-dimetil-6-oxo-piridazin-4-ilo] (285 mg, rendimiento del 72 %) como una goma de color amarillo pálido.



¹H RMN (400 MHz, CDCl₃) δ = 7,41 (dd, J = 5,1, 8,9 Hz, 1H), 7,26 - 7,22 (m, 2H), 7,02 - 6,98 (m, 2H), 6,99 (t, J = 8,9 Hz, 1H), 6,93 (d, J = 16,5 Hz, 1H), 6,59 (d, J = 16,5 Hz, 1H), 3,71 (s, 3H), 2,62 (spt, J = 7,0 Hz, 1H), 2,19 (s, 3H), 1,87 (tt, J = 5,0, 8,4 Hz, 1H), 1,07 (d, J = 7,0 Hz, 3H), 1,06 (d, J = 7,0 Hz, 1H), 0,99 - 0,93 (m, J = 2,0, 8,4 Hz, 2H), 0,73 - 0,64 (m, 2H).

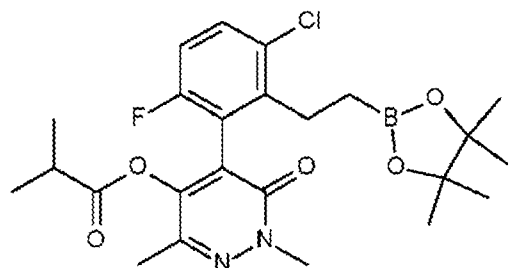
Ejemplo 6 Preparación de 4-[3-cloro-6-fluoro-2-[2-(4-metilsulfanilfenil)etil]-fenil]-5-hidroxi-2,6-dimetil-piridazin-3-ona (A-1.039)



6.1 2-Metilpropanoato de [5-[3-cloro-6-fluoro-2-[2-(4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolan-2-il)etil]fenil]-1,3-dimetil-6-oxo-piridazin-4-ilo]

Un matraz de fondo redondo secado al horno se cargó a continuación con Ir(COD)Cl₂ (299 mg, 0,45 mmoles) y 4-difenilfosfanilbutil(difenil)fosfano (0,380 mg, 0,89 mmoles). El matraz se evacuó y se rellenó con nitrógeno (3×), después se añadió THF (75 ml) y la reacción se agitó a temperatura ambiente durante 30 min. Una disolución de 2-metilpropanoato de [5-(3-cloro-6-fluoro-2-vinil-fenil)-1,3-dimetil-6-oxo-piridazin-4-ilo] [preparada como se describe en el Ejemplo 4] (6,7 g, 17,8 mmoles) en THF se añadió gota a gota y la mezcla se agitó durante 10 min, seguido de la adición gota a gota de 4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolano (3,02 ml, 20,8 mmoles). La reacción se agitó a 60 °C durante la noche.

Después de 24 h, la reacción se dejó enfriar a temperatura ambiente, después se concentró a vacío. El producto en bruto se purificó por cromatografía en columna sobre gel de sílice, eluyendo con un gradiente de ciclohexano/acetato de etilo, dando 2-metilpropanoato de [5-[3-cloro-6-fluoro-2-[2-(4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolan-2-il)etil]fenil]-1,3-dimetil-6-oxo-piridazin-4-ilo] (4,50 g, rendimiento del 51 %) como sólido amarillo.

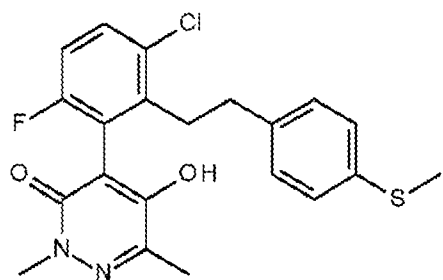


¹H RMN (500 MHz, cloroformo) δ = 7,35 (dd, J = 5,2, 8,9 Hz, 1H), 6,90 (t, J = 8,6 Hz, 1H), 3,81 (s, 3H), 2,59 (t, J = 8,5 Hz, 2H), 2,53 (spt, J = 7,0 Hz, 1H), 2,24 (s, 3H), 1,32 - 1,16 (m, 12H), 1,08 - 1,00 (m, 2H), 0,98 (d, J = 7,0 Hz, 3H), 0,94 (d, J = 7,0 Hz, 3H).

6.2 4-[3-Cloro-6-fluoro-2-[2-(4-metilsulfanilfenil)etil]fenil]-5-hidroxi-2,6-dimetil-piridazin-3-ona (A-1.039)

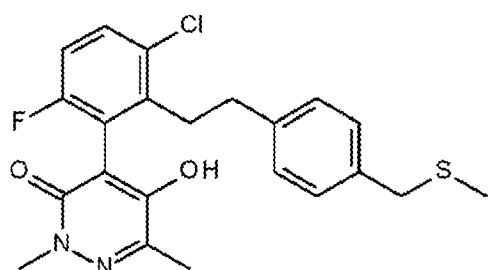
Se combinaron 2-metilpropanoato de [5-[3-cloro-6-fluoro-2-[2-(4,4,5,5-tetrametil-1,3,2-dioxaborolan-2-il)etil]fenil]-1,3-dimetil-6-oxo-piridazin-4-ilo] (100 mg, 0,20 mmoles), 1-bromo-4-metilsulfanil-benceno (62 mg, 0,30 mmoles), cloro(2-diciclohexilfosfino-2',6'-diisopropoxi-1,1'-bifenil)[2-(2'-amino-1,1'-bifenil)]paladio (II) (24 mg, 0,03 mmoles), K₂CO₃ (84 mg, 0,61 mmoles), 1,4-dioxano (2 ml) y agua (0,2 ml) en un vial de microondas de 5 ml. A continuación, la mezcla de reacción se calentó a 140 °C durante 90 min con irradiación con microondas.

La mezcla de reacción se dejó enfriar hasta temperatura ambiente, a continuación se diluyó con agua (10 ml), se acidificó hasta ~pH 3 con HCl 2 M y se extrajo con DCM (4×). Los extractos orgánicos combinados se concentraron a vacío dando el producto en bruto se purificó en HPLC de fase inversa de masa dirigida proporcionando 4-[3-cloro-6-fluoro-2-[2-(4-metilsulfanilfenil)etil]fenil]-5-hidroxi-2,6-dimetil-piridazin-3-ona como un sólido blanco (22 mg, rendimiento del 22 %, A-1.039).



¹H RMN (400 MHz, cloroformo δ = 7,46 - 7,39 (m, 3H), 7,12 (d, J = 8,0 Hz, 2H), 6,98 (t, J = 8,6 Hz, 1H), 6,90 (d, J = 8,0 Hz, 2H), 3,73 (s, 3H), 2,84 - 2,64 (m, 4H), 2,45 (s, 3H), 2,29 (s, 3H).

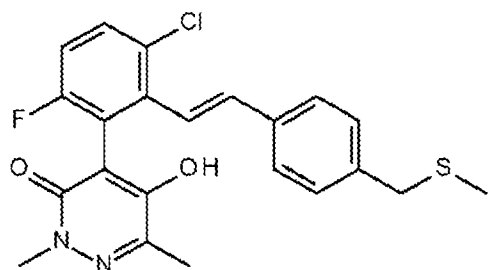
Ejemplo 7 Preparación de 4-[3-cloro-6-fluoro-2-[(E)-2-[4-(metilsulfanilmetil)fenil]etil]fenil]-5-hidroxi-2,6-dimetilpiridazin-3-ona (A-1.388)



7.1 4-[3-Cloro-6-fluoro-2-[(E)-2-[4-(metilsulfanilmetil)fenil]vinil]fenil]-5-hidroxi-2,6-dimetil-piridazin-3-ona

Se añadieron 2-metilpropanoato de [5-[3-cloro-6-fluoro-2-[(E)-2-(6-metil-4,8-dioxo-1,3,6,2-dioxazaborocan-2-il)vinil]fenil]-1,3-dimetil-6-oxo-piridazin-4-ilo] (500 mg, 0,96 mmoles), 1-bromo-4-(metilsulfanilmetil)benceno (324 mg, 1,44 mmoles) complejo 1,1-bis(difenilfosfino)ferroceno]dicloropaldio (II)-diclorometano [PdCl₂(dppf).DCM] (41 mg, 0,05 mmoles) y CARBONATO POTÁSICO (417 mg, 2,89 mmoles) a un vial de microondas de 10-20 ml en una atmósfera de nitrógeno. Se añadieron acetonitrilo desgasificado (11,5 ml) y agua (2,9 ml) y la mezcla se calentó a 150 °C durante 20 min con irradiación con microondas.

La mezcla de reacción se concentró a sequedad. El residuo se trató con agua (20 ml) y la fase acuosa se acidificó a pH 3 mediante la adición de HCl 2 M que condujo a la formación de un precipitado. Se añadió DCM (20 ml) para absorber el precipitado. Se añadió salmuera (20 ml) y las fases se separaron. La fase acuosa se extrajo con dos porciones adicionales de DCM, a continuación los extractos orgánicos combinados se secaron y se concentraron directamente sobre sílice. El material en bruto se purificó por cromatografía ultrarrápida automatizada sobre gel de sílice, eluyendo con un gradiente de ciclohexano/acetato de etilo dando 4-[3-cloro-6-fluoro-2-[(E)-2-[4-(metilsulfanilmetil)fenil]vinil]fenil]-5-hidroxi-2,6-dimetil-piridazin-3-ona (341 mg, rendimiento del 82 %) como un sólido blanquecino.



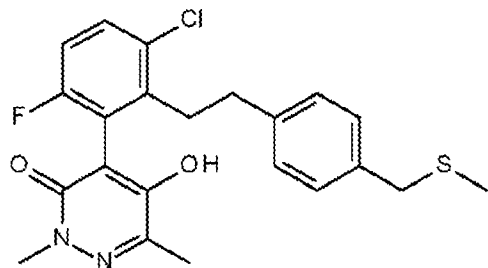
¹H RMN (500 MHz, DMSO- d_6) δ = 10,78 (s a, 1H), 7,60 (dd, J = 5,2, 8,7 Hz, 1H), 7,30 - 7,24 (m, 5H), 6,93 (d, J = 16,5 Hz, 1H), 6,56 (d, J = 16,5 Hz, 1H), 3,67 (s, 2H), 3,54 (s, 3H), 2,19 (s, 3H), 1,94 (s, 3H)

7.2 4-[3-cloro-6-fluoro-2-[(E)-2-[4-(metilsulfanilmetil)fenil]etil]fenil]-5-hidroxi-2,6-dimetil-piridazin-3-ona (A-1.388)

A una disolución de 4-[3-cloro-6-fluoro-2-[(E)-2-[4-(metilsulfanilmetil)fenil]vinil]fenil]-5-hidroxi-2,6-dimetil-piridazin-3-ona (335 mg, 0,78 mmoles) en tetrahidrofurano (12 ml) bajo una atmósfera de nitrógeno, se añadió N,N-diisopropiletilamina (1,08 ml, 6,20 mmoles). La mezcla agitada de reacción se calentó a 70 °C y se añadió 2,4,6-triisopropilbencenosulfonilhidrazida (2,06 g, 6,21 mmoles) en porciones durante 6 h, después la mezcla se calentó a reflujo durante 16 h. Se añadió N,N-diisopropiletilamina adicional (0,68 ml, 3,89 mmoles) a la mezcla de reacción,

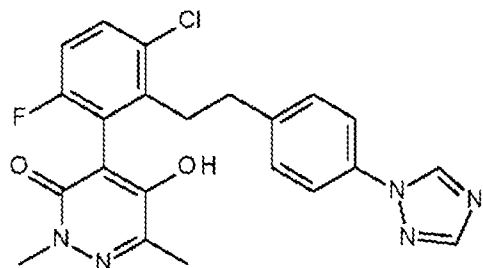
seguido de 2,4,6-triisopropilbencenosulfonilhidrazida (1,29 g, 3,89 mmoles) y la mezcla se calentó a reflujo durante 6 h adicionales.

- 5 La mezcla de reacción se dejó enfriar a temperatura ambiente, después se concentró directamente sobre sílice. El material en bruto se purificó parcialmente por cromatografía automatizada ultrarrápida sobre gel de sílice eluyendo con un gradiente de ciclohexano/acetato de etilo. El material obtenido se purificó adicionalmente por HPLC de fase inversa de masa dirigida proporcionando 4-[3-cloro-6-fluoro-2-[2-[4-(metilsulfanilmetil)fenil]etil]fenil]-5-hidroxi-2,6-dimetil-piridazin-3-ona como un sólido blanco (208 mg, rendimiento del 62 %, **A-1.388**).



¹H RMN (400 MHz, d6-DMSO), δ = 10,83 (s, 1H), 7,56-7,53 (m, 1H), 7,23-7,16 (m, 3H), 6,96-6,94 (d, 2H), 3,62 (s, 2H), 3,60 (s, 3H), 2,68-2,54 (m, 4H), 2,26 (s, 3H), 1,92 (s, 3H)

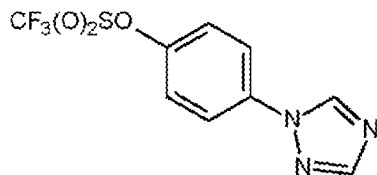
- 15 **Ejemplo 8 4-[3-cloro-6-fluoro-2-[2-[4-(1,2,4-triazol-1-il)fenil]etil]fenil]-5-hidroxi-2,6-dimetil-piridazin-3-ona (A-1.385)**



20 8.1 Trifluorometanosulfonato de [4-(1,2,4-triazol-1-il)fenilo]

- Se disolvió 4-(1,2,4-triazol-1-il)fenol (1,22 g, 7,57 mmoles) en diclorometano (10 ml) bajo nitrógeno y se enfrió hasta ~0 °C. Se añadió gota a gota una disolución de piridina (1,22 ml, 15,1 mmoles) en diclorometano (5 ml) durante ~2 minutos. La mezcla se agitó 5 minutos, a continuación se añadió gota a gota una disolución de anhídrido trifluorometanosulfónico (1,53 ml, 9,08 mmoles) en diclorometano (5 ml) durante ~2 minutos. Se retiró la refrigeración y se dejó que la mezcla de reacción se calentara hasta temperatura ambiente, a continuación se agitó a temperatura ambiente durante 16 h.

- La reacción se enfrió rápidamente mediante adición de HCl 2 M ac. (20 ml), a continuación se separó la fase orgánica. La fase acuosa se extrajo adicionalmente con diclorometano (2 × 20 ml). Los extractos orgánicos combinados se lavaron con agua (20 ml), se secaron, a continuación se concentraron a presión reducida dando un sólido de color crema. El material en bruto se purificó por cromatografía ultrarrápida automatizada sobre sílice eluyendo con un gradiente de ciclohexano/acetato de etilo dando trifluorometanosulfonato de [4-(1,2,4-triazol-1-il)fenilo] como un sólido blanco (2,02 g, rendimiento del 91 %).



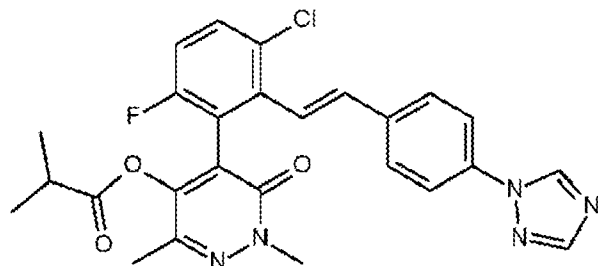
¹H RMN (400 MHz, cloroformo) δ = 8,59 (s, 1H), 8,14 (s, 1H), 7,86 - 7,78 (m, 2H), 7,50 - 7,41 (m, 2H).

- 40 **8.2 2-Metilpropanoato de [5-[3-cloro-6-fluoro-2-[(E)-2-[4-(1,2,4-triazol-1-il)fenil]vinil]fenil]-1,3-dimetil-6-oxo-piridazin-4-ilo]**

Se añadieron 2-metilpropanoato de [5-[3-cloro-6-fluoro-2-[(E)-2-(6-metil-4,8-dioxo-1,3,6,2-dioxazaborocan-2-il)vinil]fenil]-1,3-dimetil-6-oxo-piridazin-4-ilo] (500 mg, 0,96 mmoles), complejo de 1,1-bis(difenilfosfino)ferroceno]dicloropaldio (II)-diclorometano [PdCl₂(dppf).DCM] (39 mg, 0,048 mmoles), trifluorometanosulfonato de [4-(1,2,4-triazol-1-il)fenilo] (367 mg, 1,25 mmoles) y fosfato de potasio (834 mg, 3,85 mmoles) a un vial de microondas de 10-20 ml.

Se añadieron tetrahidrofurano (10 ml) y agua (0,5 ml), a continuación la mezcla de reacción se desgasificó agitando a vacío, luego se rellenó con nitrógeno (3x). La mezcla de reacción se calentó en el microondas a 120 °C durante 60 min bajo irradiación con microondas.

La mezcla de reacción se filtró a través de un lecho de Celite®, lavando a través con EtOAc y EtOH. El filtrado se concentró a presión reducida dando una goma marrón (840 mg). El material en bruto se purificó por cromatografía automatizada ultrarrápida sobre gel de sílice eluyendo con un gradiente de ciclohexano/acetato de etilo dando una goma de color amarillo pálido (389 mg). El material purificado se disolvió en acetonitrilo (10 ml) y se trató con resina secuestradora metálica SiliCycle SiliaMetS® Thiol (SH) (365 mg) a temperatura ambiente. La suspensión se agitó a temperatura ambiente durante 3 h, después se filtró para retirar la resina, lavando con acetonitrilo adicional. El filtrado se concentró a vacío proporcionando 2-metilpropanoato de [5-[3-cloro-6-fluoro-2-[(E)-2-[4-(1,2,4-triazol-1-il)fenil]vinil]fenil]-1,3-dimetil-6-oxo-piridazin-4-ilo] como una goma incolora (361 mg, rendimiento del 73 %).

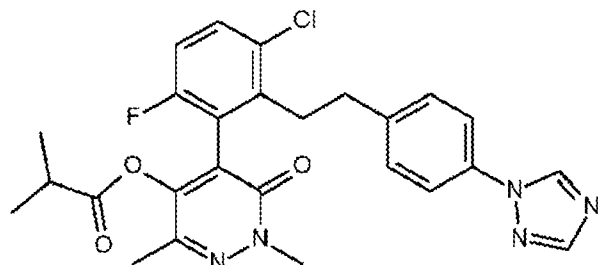


¹H RMN (400 MHz, cloroformo) δ ppm 8,55 (s, 1H), 8,11 (s, 1H), 7,60 - 7,66 (m, 2H), 7,42 - 7,53 (m, 3H), 7,01 - 7,10 (m, 2H), 6,69 (d, J=16,5 Hz, 1H), 3,70 (s, 3H), 2,66 (spt, J=7,0 Hz, 1H), 2,23 (s, 3H), 1,11 (d, J = 7,0 Hz, 1H), 1,08 (d, J = 7,1 Hz, 1H)

8.3 2-Metilpropanoato de [5-[3-cloro-6-fluoro-2-[2-[4-(1,2,4-triazol-1-il)fenil]etil]fenil]-1,3-dimetil-6-oxo-piridazin-4-ilo] (A-3.385)

Se sometió 2-metilpropanoato de [5-[3-cloro-6-fluoro-2-[(E)-2-[4-(1,2,4-triazol-1-il)fenil]vinil]fenil]-1,3-dimetil-6-oxo-piridazin-4-ilo] (365 mg, 0,72 mmol) a hidrogenación catalítica en EtOAc (10 ml) sobre catalizador de Pd al 5 %/C (50 % húmedo) (0,15 g) a 3 bares de H₂ durante 24 h.

La mezcla de reacción se filtró a través de una capa de Celite®, lavando con acetato de etilo. El filtrado se concentró a vacío proporcionando un residuo en bruto (350 mg) que se adsorbió sobre sílice y se purificó por cromatografía ultrarrápida automatizada sobre gel de sílice, eluyendo con un gradiente de ciclohexano/acetato de etilo. Se obtuvo 2-metilpropanoato de [5-[3-cloro-6-fluoro-2-[2-[4-(1,2,4-triazol-1-il)fenil]etil]fenil]-1,3-dimetil-6-oxo-piridazin-4-ilo] (A-3.385) como una goma incolora (321 mg, rendimiento del 88 %).



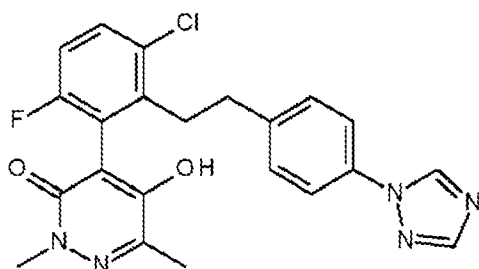
¹H RMN (400 MHz, cloroformo) δ = 8,51 (s, 1H), 8,09 (s, 1H), 7,55 (d, J = 8,2 Hz, 2H), 7,43 (dd, J = 5,2, 8,7 Hz, 1H), 7,27 (d, J = 8,2 Hz, 2H), 7,00 (t, J = 8,7 Hz, 1H), 3,84 (s, 3H), 2,97 - 2,80 (m, 3H), 2,79 - 2,67 (m, 1H), 2,55 (spt, J = 7,0 Hz, 1H), 2,25 (s, 3H), 0,98 (d, J = 7,0 Hz, 3H), 0,96 (d, J = 7,0 Hz, 1H)

8.4 4-[3-cloro-6-fluoro-2-[2-[4-(1,2,4-triazol-1-il)fenil]etil]fenil]-5-hidroxi-2,6-dimetil-piridazin-3-ona (A-1.385)

Se agitó 2-metilpropanoato de [5-[3-cloro-6-fluoro-2-[2-[4-(1,2,4-triazol-1-il)fenil]etil]fenil]-1,3-dimetil-6-oxo-piridazin-4-ilo] (320 mg, 0,63 mmoles) en etanol (5 ml) a temperatura ambiente.

Se añadió gota a gota una disolución de hidróxido de litio monohidratado (81 mg, 1,88 mmoles) en agua (2 ml) y la reacción se agitó a temperatura ambiente durante 1 h.

Se retiró a presión reducida el disolvente etanol, después el residuo se diluyó con agua (20 ml). La fase acuosa se acidificó a ~pH 3-4 mediante la adición de HCl 2 M (ac.), después se extrajo con EtOAc (3 × 10 ml). Los extractos orgánicos combinados se concentraron a presión reducida dando un sólido blanco (292 mg). El residuo en bruto se purificó por cromatografía ultrarrápida automatizada sobre sílice, eluyendo con un gradiente de ciclohexano/acetato de etilo y acetato de etilo/etanol proporcionando 4-[3-cloro-6-fluoro-2-[2-(4-(1,2,4-triazol-1-il)fenil)etil]fenil]-5-hidroxi-2,6-dimetil-piridazin-3-ona (**A-1.365**) como un sólido blanco (260 mg, rendimiento del 94 %).



¹H RMN (400MHz, metanol), δ ppm 9,03 (s, 1H), 8,14 (s, 1H), 7,65 - 7,70 (m, 2H), 7,51 (dd, J=5,2, 8,7 Hz, 1H), 7,20 (m, 2H), 7,11 (t, J=8,7 Hz, 1H), 3,72 (s, 3H), 2,72 - 2,89 (m, 4H), 2,32 (s, 3H)

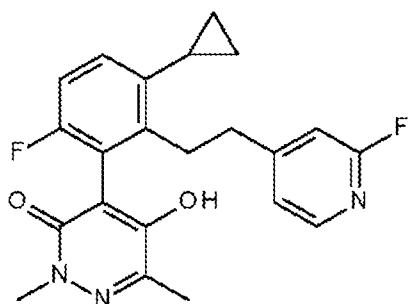
Ejemplo 9 4-[3-ciclopropil-6-fluoro-2-[2-(2-fluoro-4-piridil)etil]fenil]-5-hidroxi-2,6-dimetil-piridazin-3-ona (**C-1.013**)

Se cargaron 2-metilpropanoato de [5-[3-cloro-6-fluoro-2-[2-(2-fluoro-4-piridil)etil]fenil]-1,3-dimetil-6-oxo-piridazin-4-ilo] (250 mg, 0,54 mmoles), trifosfato de potasio monohidratado (374 mg, 1,62 mmoles) y RuPhos Pd G2 (42 mg, 0,05 mmoles) en un vial de microondas 2-5 ml equipado con una barra agitadora. El recipiente de reacción se evacuó y relleno con nitrógeno (3×). Se añadió 1,4-dioxano (4 ml), seguido de ácido ciclopropilborónico (139 mg, 1,62 mmoles) y agua (1 ml) (ambos disolventes desgasificados). La mezcla entonces se calentó hasta 120 °C durante 1 h con irradiación con microondas.

La reacción se enfrió hasta temperatura ambiente, antes se añadieron ciclopropilborónico (139 mg, 1,62 mmoles) y RuPhos Pd G2 (42 mg, 0,05 mmoles) adicionales y la reacción se calentó hasta 120 °C durante 2,5 horas adicionales:

La mezcla de reacción se concentró a vacío para retirar el dioxano. El residuo se diluyó con agua (20 ml) y DCM (20 ml) y las capas se separaron. La fase acuosa se extrajo con porciones adicionales de DCM (3 X 5 ml), a continuación los extractos orgánicos combinados se secaron y se concentraron dando un sólido oscuro (331 mg).

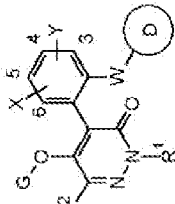
El residuo en bruto se purificó por HPLC de fase inversa de masa dirigida proporcionando 4-[3-ciclopropil-6-fluoro-2-[2-(2-fluoro-4-piridil)etil]fenil]-5-hidroxi-2,6-dimetil-piridazin-3-ona (**C-1.013**) como un sólido blanco.



¹H RMN (400 MHz, metanol) δ = 8,01 (d, J = 5,1 Hz, 1H), 7,13 (dd, J = 5,6, 8,3 Hz, 1H), 7,02 - 6,93 (m, 2H), 6,72 (s, 1H), 3,72 (s, 3H), 3,02 - 2,75 (m, 4H), 2,32 (s, 3H), 1,97 - 1,87 (m, 1H), 1,02 - 0,89 (m, 2H), 0,74 - 0,61 (m, 2H)

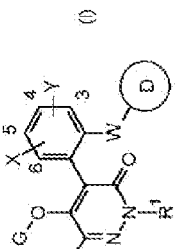
Los compuestos A-1.023, A-1.024, A-1.025, A-1.026, A-1.027, A-1.028, A-1.029, A-1.030, A-1.031, A-1.032, A-1.033, A-1.034, A-1.035, A-1.036, A-1.037, A-1.038, A-1.039, A-1.040, A-1.041, A-1.042, A-1.043, A-1.044, A-2.027, A-2.030, A-2.037, A-3.028, A-3.029, A-3.030, A-3.035, A-3.036, A-3.038, A-4.029, A-4.030, A-4.035, A-4.036, A-1.373, A-1.374, A-1.375, A-1.376, A-1.377, A-1.378, A-1.379, A-1.380, A-1.381, A-1.382, A-1.383, A-1.384, A-1.386, A-1.387, A-1.389, A-1.390, A-1.391 y A-1.392 se prepararon usando los métodos generales que se describen arriba. La Tabla 4 siguiente muestra la estructura de estos compuestos y datos de caracterización de RMN.

Tabla 4 Ejemplos de preparación de compuestos de la fórmula (I). El sistema de numeración utilizado para describir las posiciones de X e Y se muestra únicamente a efectos de claridad.

 (I)						
Compuesto	R ¹	R ²	G	X	Y	W
A-1.023	-	-	H	6- F	3- Cl	-CH ₂ - CH ₂ -
Detalles de RMN						
¹ H RMN (400 MHz, metanol) δ = 8,22 (s, 1H), 7,63 - 7,56 (m, 2H), 7,51 (dd, J = 5,2, 8,9 Hz, 1H), 7,45 (s, 1H), 7,14 - 7,07 (m, 3H), 3,72 (s, 3H), 2,86 - 2,68 (m, 4H), 2,32 (s, 3H).						
A-1.024	-	-	H	6- F	3- Cl	-CH ₂ - CH ₂ -
¹ H RMN (400 MHz, metanol) δ = 7,50 (dd, J = 5,3, 8,6 Hz, 1H), 7,38 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,09 (t, J = 8,6 Hz, 1H), 6,94 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 3,72 (s, 3H), 2,74 (s, 4H), 2,33 (s, 3H), 2,09 (s, 3H)						
A-1.025	-	-	H	6- F	3- Cl	-CH ₂ - CH ₂ -
¹ H RMN (500 MHz, DMSO-d6) δ = 10,86 (s, 1H), 7,62 (d, J = 8,3 Hz, 2H), 7,53 (dd, J = 5,2, 8,8 Hz, 1H), 7,29 (d, J = 8,3 Hz, 2H), 7,22 (t, J = 8,8 Hz, 1H), 3,61 (s, 3H), 2,83 - 2,64 (m, 4H), 2,57 (s, 6H), 2,26 (s, 3H)						
A-1.026	-	-	H	6- F	3- Cl	-CH ₂ - CH ₂ -
¹ H RMN (400 MHz, DMSO-d6) δ = 10,86 (s, 1H), 7,57 (dd, J = 5,1, 8,9 Hz, 1H), 7,28 (d, J = 8,3 Hz, 2H), 7,22 (t, J = 8,9 Hz, 1H), 6,93 (d, J = 8,3 Hz, 2H), 3,62 (s, 3H), 2,70 - 2,53 (m, 4H), 2,27 (s, 3H), 1,24 (s, 9H)						
A-1.027	-	-	H	6- F	3- Cl	-CH ₂ - CH ₂ -
¹ H RMN (400 MHz, cloroformo) δ = 7,57 - 7,52 (m, 2H), 7,50 - 7,40 (m, 5H), 7,37 - 7,30 (m, 1H), 7,07 (d, J = 8,2 Hz, 2H), 7,02 (t, J = 8,6 Hz, 1H), 5,47 (s, 1H), 3,75 (s, 3H), 2,86 - 2,80 (m, 3H), 2,27 (s, 3H)						
A-1.028	-	-	H	6- F	3- Cl	-CH ₂ - CH ₂ -
¹ H RMN (400 MHz, DMSO-d6) δ = 10,86 (s, 1H), 7,55 - 7,49 (m, 1H), 7,25 - 7,19 (m, 2H), 6,95 - 6,89 (m, 2H), 3,61 (s, 3H), 3,46 (c, J = 7,1 Hz, 1H), 3,12 (c, J = 7,1 Hz, 1H), 2,95 (s, 1,5H), 2,78 (s, 1,5H), 2,78 - 2,63 (m, 4H), 2,26 (s, 3H), 1,11 (t, J = 7,1 Hz, 1,5H), 1,00 (t, J = 7,1 Hz, 1,5H)						
A-1.029	-	-	H	6- F	3- Cl	-CH ₂ - CH ₂ -
¹ H RMN (400 MHz, cloroformo) δ = 7,51 - 7,44 (m, 2H), 7,33 - 7,24 (m, 3H + CHCl3 pico), 6,95 (t, J = 8,6 Hz, 1H), 3,69 (s, 3H), 2,95 - 2,79 (m, 4H), 2,30 (s, 3H)						
A-1.030	-	-	H	6- F	3- Cl	-CH ₂ - CH ₂ -
¹ H RMN (400 MHz, cloroformo) δ = 7,46 (td, J = 1,4, 7,6 Hz, 1H), 7,37 (dd, J = 5,2, 8,9 Hz, 1H), 7,35 - 7,28 (m, 2H), 7,26 - 7,23 (m, 1H), 6,95 (t, J = 8,6 Hz, 1H), 3,69 (s, 3H), 2,92 - 2,63 (m, 4H), 2,28 (s, 3H)						
A-1.031	-	-	H	6- F	3- Cl	-CH ₂ - CH ₂ -
¹ H RMN (400 MHz, cloroformo) δ ppm 2,09 (s, 3H) 2,27 (s, 3H) 2,50 - 2,83 (m, 4H) 3,70 (s, 3H) 6,52 (d, J = 7,83 Hz, 1H) 6,59 - 6,73 (m, 2H) 6,93 (t, J = 8,56 Hz, 1H) 7,38 (dd, J = 8,86, 5,20 Hz, 1H)						
A-1.032	-	-	H	6- F	3- Cl	-CH ₂ - CH ₂ -
¹ H RMN (400 MHz, DMSO-d6) δ = 10,86 (s, 1H), 7,81 (aparente, d, J = 8,3 Hz, 2H), 7,56 (dd, J = 5,2, 8,6 Hz, 1H), 7,29 (aparente, d, J = 8,3 Hz, 2H), 7,23 (t, J = 8,6 Hz, 1H), 3,61 (s, 3H), 3,17 (s, 3H), 2,86 - 2,63 (m, 4H), 2,26 (s, 3H)						
A-1.033	-	-	H	6- F	3- Cl	-CH ₂ - CH ₂ -
¹ H RMN (400 MHz, cloroformo) δ ppm 2,27 (s, 3H) 2,62 - 2,77 (m, 3H) 2,80 - 2,87 (m, 1H) 2,90 (s, 6H) 3,72 (s, 3H) 6,59 - 6,65 (m, 2H) 6,96 (d, J = 8,68 Hz, 2H) 6,96 (t, J = 8,56 Hz, 1H) 7,42 (dd, J = 8,80, 5,14 Hz, 1H)						
A-1.034	-	-	H	6- F	3- Cl	-CH ₂ - CH ₂ -
¹ H RMN (400 MHz, cloroformo) δ ppm 2,28 (s, 3H) 2,80 (s, 7H) 3,73 (s, 3H) 6,49 (d, J = 8,44 Hz, 2H) 6,81 (d, J = 8,44 Hz, 2H) 6,97 (t, J = 8,56 Hz, 1H) 7,42 (dd, J = 8,80, 5,14 Hz, 1H)						
A-1.035	-	-	H	6- F	3- Cl	-CH ₂ - CH ₂ -
¹ H RMN (400 MHz, cloroformo) δ = 7,28 (dd, J = 5,2, 8,9 Hz, 1H), 6,82 (s, 5H), 3,62 (s, 3H), 2,73 - 2,50 (m, 4H), 2,23 (s, 3H)						
A-1.036	-	-	H	6- F	3- Cl	-CH ₂ - CH ₂ -
¹ H RMN (400 MHz, CDCl3) δ ppm 7,46-7,51 (m, 2H) 7,26-7,31 (m, 1H) 7,08 (d, J = 8,19 Hz, 2H) 6,86 (t, J = 8,50 Hz, 1H) 3,63 (s, 3H) 2,61 - 2,77 (m, 4H) 2,24 (s, 3H)						

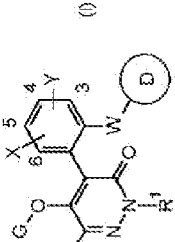
(1)

Compuesto	R ¹	R ²	G	X	Y	W	D	Detalles de RMN
A-1.037	-	Me	-H	6- F	3- Cl	-CH ₂ - CH ₂ -	4-hidroxifenil-	¹ H RMN (400MHz, DMSO-d ₆) δ = 10,82 (s a, 1H), 9,17 (s, 1H), 7,54 (dd, J=5,2, 8,9 Hz, 1H), 7,20 (t, J=8,9 Hz, 1H), 6,82 - 6,75 (m, 2H), 6,65 - 6,60 (m, 2H), 3,61 (s, 3H), 2,89 - 2,43 (m, 4H), 2,26 (s, 3H)
A-1.038	-	Me	-H	6- F	3- Cl	-CH ₂ - CH ₂ -	4-ciclopropilfenil-	¹ H RMN (400MHz, cloroformo) δ = 7,37 (dd, J=5,2, 8,8 Hz, 1H), 6,96 - 6,88 (m, 2H), 6,91 (t, J=8,8 Hz, 1H), 6,88 - 6,83 (m, 2H), 3,67 (s, 3H), 2,82 - 2,62 (m, 4H), 2,25 (s, 3H), 1,84 (tt, J=5,0, 8,5 Hz, 1H), 0,95 - 0,88 (m, 2H), 0,68 - 0,60 (m, 2H)
A-1.039	-	Me	-H	6- F	3- Cl	-CH ₂ - CH ₂ -	4-(metilsulfonil)fenil-	¹ H RMN (400 MHz, cloroformo) δ = 7,46 - 7,39 (m, 3H), 7,12 (d, J = 8,0 Hz, 2H), 6,98 (t, J = 8,6 Hz, 1H), 6,90 (d, J = 8,0 Hz, 2H), 3,73 (s, 3H), 2,84 - 2,64 (m, 4H), 2,45 (s, 3H), 2,29 (s, 3H)
A-1.040	-	Me	-H	6- F	3- Cl	-CH ₂ - CH ₂ -	4-carboxifenil-	¹ H RMN (400 MHz, metanol) δ = 7,88 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,51 (dd, J = 5,2, 8,9 Hz, 1H), 7,11 (d, J = 8,0 Hz, 1H), 7,11 (t, J = 8,5 Hz, 1H), 3,74 - 3,70 (m, 3H), 2,88 - 2,70 (m, 3H), 2,34 - 2,26 (m, 3H)
A-1.041	-	Me	-H	6- F	3- Cl	-CH ₂ - CH ₂ -	4-metoxicarbonifenil-	¹ H RMN (400 MHz, cloroformo) δ = 7,88 (d, J = 8,3 Hz, 2H), 7,40 (dd, J = 5,2, 8,9 Hz, 1H), 7,05 (d, J = 8,3 Hz, 2H), 6,96 (t, J = 8,9 Hz, 1H), 3,89 (s, 3H), 3,72 (s, 3H), 2,85 - 2,72 (m, 4H), 2,28 (s, 3H)
A-1.042	-	Me	-H	6- F	3- Cl	-CH ₂ - CH ₂ -	4-(terc-butoxicarbonilamino)- 3-fluoro-fenil-	¹ H RMN (400 MHz, metanol) δ = 7,66 - 7,55 (m, 1H), 7,48 (a dd, J = 5,3, 8,7 Hz, 1H), 7,08 (t, J = 8,7 Hz, 1H), 6,78 - 6,71 (m, 2H), 3,72 (s, 3H), 2,82 - 2,60 (m, 4H), 2,32 (s, 3H), 1,50 (s, 9H)
A-1.043	-	Me	-H	6- F	3- Cl	-CH ₂ - CH ₂ -	2-(metilsulfonil)-4-piridil-	¹ H RMN (500 MHz, cloroformo) δ ppm 2,30 (s, 3H), 2,52 (s, 3H), 2,69 - 2,80 (m, 1H), 2,85 - 2,94 (m, 1H), 2,96 - 3,09 (m, 2H), 3,69 (s, 3H), 6,85 (d, J=5,54 Hz, 1H), 6,89 - 6,97 (m, 2H), 7,35 (dd, J=8,77, 4,99 Hz, 1H), 8,18 (d, J=5,79 Hz, 1H)
A-1.044	-	Me	-H	6- F	3- Cl	-CH ₂ - CH ₂ -	2-acetamido-4-piridil-	¹ H RMN (400 MHz, cloroformo) δ ppm 8,00 (d, J=5,26 Hz, 1H), 7,64 (s a, 1H), 7,37 (s a, 1H), 7,00 (a d, J=1,10 Hz, 1H), 6,78 (dd, J=5,26, 1,34 Hz, 1H), 3,73 (s, 3H), 2,97 (a d, J=9,66 Hz, 1H), 2,73 - 2,88 (m, 3H), 2,27 (s, 4H), 2,16 (s, 3H)
A-2.027	-	Me	-H	6- F	3- Cl	(E)- CH=CH-	4-bifenil-	¹ H RMN (400 MHz, cloroformo) δ = 7,59 - 7,33 (m, 10H), 7,07 (t, J = 8,6 Hz, 1H), 7,01 (d, J = 16,4 Hz, 1H), 6,70 (d, J = 16,5 Hz, 1H), 5,63 (s, 1H), 3,73 (s, 3H), 2,28 (s, 3H)
A-2.030	-	Me	-H	6- F	3- Cl	(E)- CH=CH-	3-clanofenil-	¹ H RMN (400 MHz, cloroformo) δ = 7,56 - 7,47 (m, 3H), 7,44 - 7,38 (m, 2H), 7,04-6,83 (m, 2H), 6,53 (d, J = 16,5 Hz, 1H), 3,64 (s, 3H), 2,25 (s, 3H)
A-2.037	-	Me	-H	6- F	3- Cl	(E)- CH=CH-	4-hidroxifenil-	¹ H RMN (400MHz, DMSO-d ₆) δ = 10,75 (s a, 1H), 9,67 (s, 1H), 7,58 (dd, J=5,3, 8,8 Hz, 1H), 7,23 (t, J=8,8 Hz, 1H), 7,19 - 7,13 (m, 2H), 6,75 - 6,72 (m, 2H), 6,73 (d, J=16,5 Hz, 1H), 6,48 (d, J=16,5 Hz, 1H), 3,55 (s, 3H), 2,19 (s, 3H)
A-3.028	-	Me	-	6- F	3- Cl	-CH ₂ - CH ₂ -	4-[etil(metilcarbamoil)-3-fluoro-fenil-	¹ H RMN (400 MHz, cloroformo) δ = 7,42 (dd, J = 5,1, 8,9 Hz, 1H), [7,25 (t, J = 7,2 Hz, 0,5H), 7,21 (t, J = 7,5 Hz, 0,5H)], 6,99 (t, J = 8,9 Hz, 1H), 6,96 (dd, J = 1,2, 7,5 Hz, 1H), [6,89 (dd, J = 1,2, 6,9 Hz, 1H), 6,86 (dd, J = 1,2, 6,9 Hz, 1H)], 3,85 (s, 3H), [3,59 (c, J = 7,4 Hz, 1H), 3,24 (c, J = 7,4 Hz, 1H)], [3,08 (s, 1,5H), 2,90 (s a, 1,5H)], 2,88 - 2,78 (m, 3H), 2,75 - 2,64 (m, 1H), 2,55 (spt, J = 7,0 Hz, 1H), 2,28 (s, 3H), 1,23 (t, J = 7,2 Hz, 1,5H), 1,10 (t, J = 7,2 Hz, 1,5H)], 0,98 (d, J = 7,0 Hz, 3H), 0,96 (d, J = 7,1 Hz, 3H)

						
Compuesto	R ¹	R ²	R ³	X	Y	W
Detalles de RMN						
A-3.029	-	Me	(C=O)Pr	6-3-	6-3-	-CH ₂ - F Cl CH ₂ -
¹ H RMN (400 MHz, cloroformo) δ = 7,56 (dd, J = 1,1, 7,7 Hz, 1H), 7,51 - 7,46 (m, 1H), 7,43 (dd, J = 5,1, 8,8 Hz, 1H), 7,32 (d, J = 7,7 Hz, 1H), 7,30 - 7,26 (m, 1H + CHCl ₃ pico), 7,01 (t, J = 8,6 Hz, 1H), 3,85 (s, 3H), 3,15 - 3,05 (m, 1H), 3,04 - 2,80 (m, 3H), 2,55 (spt, J = 7,0 Hz, 1H), 2,27 (s, 3H), 0,97 (dd, J = 1,1, 7,0 Hz, 6H).						
A-3.030	-	Me	(C=O)Pr	6-3-	6-3-	-CH ₂ - F Cl CH ₂ -
¹ H RMN (400 MHz, cloroformo) δ = 7,50 - 7,46 (m, 1H), 7,46 - 7,37 (m, 3H), 7,37 - 7,31 (m, 1H), 7,00 (t, J = 8,6 Hz, 1H), 3,86 (s, 3H), 3,00 - 2,76 (m, 3H), 2,73 - 2,63 (m, 1H), 2,55 (quin, J = 7,0 Hz, 1H), 2,26 (s, 3H), 0,97 (dd, J = 7,0, 13,5 Hz, 6H).						
A-3.035	-	Me	(C=O)Pr	6-3-	6-3-	-CH ₂ - F Cl CH ₂ -
¹ H RMN (400 MHz, cloroformo) δ = 7,40 (dd, J = 5,1, 8,8 Hz, 1H), 7,03 - 6,99 (m, 2H), 6,97 (t, J = 8,8 Hz, 1H), 6,90 - 6,83 (m, 2H), 3,84 (s, 3H), 2,85 - 2,68 (m, 4H), 2,55 (spt, J = 7,0 Hz, 1H), 2,25 (s, 3H), 1,32 (s, 9H), 0,97 (d, J = 7,0 Hz, 3H), 0,97 (d, J = 7,0 Hz, 3H).						
A-3.036	-	Me	(C=O)Pr	6-3-	6-3-	-CH ₂ - F Cl CH ₂ -
¹ H RMN (400 MHz, cloroformo) δ = 7,56 - 7,51 (m, 2H), 7,42 (dd, J = 5,2, 8,9 Hz, 1H), 7,26 - 7,21 (m, 2H), 7,00 (t, J = 8,9 Hz, 1H), 3,84 (s, 3H), 3,02 - 2,92 (m, 1H), 2,91 - 2,80 (m, 2H), 2,75-2,65 (m, 1H), 2,54 (spt, J = 7,0 Hz, 1H), 2,25 (s, 3H), 0,98 (d, J = 7,0 Hz, 3H), 0,95 (d, J = 7,0 Hz, 3H).						
A-3.038	-	Me	(C=O)Pr	6-3-	6-3-	-CH ₂ - F Cl CH ₂ -
¹ H RMN (400 MHz, cloroformo) δ = 7,41 (dd, J = 5,2, 8,8 Hz, 1H), 7,04 - 7,00 (m, 2H), 6,98 - 6,94 (m, 2H), 6,97 (t, J = 8,8 Hz, 1H), 3,83 (s, 3H), 2,84 - 2,67 (m, 4H), 2,53 (spt, J = 7,0 Hz, 1H), 2,24 (s, 3H), 1,85 (t, J = 5,1, 8,4 Hz, 1H), 0,96 (d, J = 7,0 Hz, 3H), 0,96 (d, J = 7,0 Hz, 3H), 0,94 - 0,88 (m, J = 1,9, 8,5 Hz, 2H), 0,68 - 0,61 (m, 2H).						
A-4.029	-	Me	(C=O)Pr	6-3-	6-3-	(E) - CH=CH-
¹ H RMN (400 MHz, cloroformo) δ = 7,70 (d, J = 8,1 Hz, 1H), 7,61 - 7,53 (m, 2H), 7,46 (dd, J = 5,1, 8,9 Hz, 1H), 7,34 (d, J = 1,0, 7,6 Hz, 1H), 7,24 (d, J = 16,5 Hz, 1H), 7,10 - 6,97 (m, 2H), 3,76 (s, 3H), 2,65 (spt, J = 7,0 Hz, 1H), 2,26 (s, 3H), 1,08 (dd, J = 3,0, 7,0 Hz, 6H).						
A-4.030	-	Me	(C=O)Pr	6-3-	6-3-	(E) - CH=CH-
¹ H RMN (400 MHz, cloroformo) δ = 7,63 - 7,55 (m, 2H), 7,55 - 7,50 (m, 1H), 7,48 - 7,38 (m, 2H), 7,12 - 7,00 (m, 2H), 6,86 (d, J = 16,5 Hz, 1H), 3,70 (s, 3H), 2,65 (spt, J = 7,0 Hz, 1H), 2,24 (s, 3H), 1,08 (dd, J = 7,0, 12,5 Hz, 6H).						
A-4.035	-	Me	(C=O)Pr	6-3-	6-3-	(E) - CH=CH-
¹ H RMN (400 MHz, cloroformo) δ = 7,41 (dd, J = 5,0, 8,6 Hz, 1H), 7,26 - 7,23 (m, 2H), 6,89 (t, J = 8,6 Hz, 1H), 6,94 - 6,90 (m, 1H), 6,91 (d, J = 16,5 Hz, 1H), 6,80 (d, J = 16,5 Hz, 1H), 3,71 (s, 3H), 2,63 (spt, J = 7,0 Hz, 1H), 2,22 (s, 3H), 1,35 (s, 9H), 1,08 (d, J = 7,0 Hz, 3H), 1,08 (d, J = 7,0 Hz, 1H).						
A-4.036	-	Me	(C=O)Pr	6-3-	6-3-	(E) - CH=CH-
¹ H RMN (400 MHz, cloroformo) δ = 7,62 - 7,55 (m, 2H), 7,45 (dd, J = 5,0, 8,5 Hz, 1H), 7,45 - 7,40 (m, 1H), 7,13 (d, J = 16,5 Hz, 1H), 7,06 (t, J = 8,5 Hz, 1H), 6,68 (d, J = 16,5 Hz, 1H), 3,69 (s, 3H), 2,66 (spt, J = 7,0 Hz, 1H), 2,23 (s, 3H), 1,11 (d, J = 7,0 Hz, 3H), 1,07 (d, J = 7,0 Hz, 3H).						
A-1.373	-	Me	H	6-3-	6-3-	-CH ₂ - F Cl CH ₂ -
¹ H RMN (400 MHz, metanol) δ ppm 7,62 (d, J = 8,3 Hz, 2H), 7,57 (d, J = 2,3 Hz, 1H), 7,48 - 7,54 (m, 1H), 7,07 - 7,17 (m, 1H), 7,03 (d, J = 8,3 Hz, 1H), 6,66 (d, J = 2,3 Hz, 1H), 3,91 (s, 3H), 3,73 (s, 3H), 2,63 - 2,85 (m, 4H), 2,32 (s, 3H).						
A-1.374	-	Me	H	6-3-	6-3-	-CH ₂ - F Cl CH ₂ -
¹ H RMN (400 MHz, DMSO-d ₆) δ ppm 7,58 - 7,53 (m, 3H), 7,28 (d, J = 8,2 Hz, 2H), 7,23 (t, J = 8,7 Hz, 1H), 3,61 (s, 3H), 2,87 - 2,68 (m, 4H), 2,53 (s, 3H), 2,27 (s, 3H).						

(1)

Compuesto	R ¹	R ²	X	Y	W	D	Detalles de RMN
A-1.375	-	-H	6-F	3-Cl	-CH ₂ -	4-morfolinofenil-	¹ H RMN (400 MHz, DMSO-d ₆) δ ppm 7.55 (dd, J = 5.2, 8.8 Hz, 1H), 7.21 (t, J = 8.8 Hz, 1H), 6.89 - 6.80 (m, 4H), 3.73 - 3.69 (m, 4H), 3.61 (s, 3H), 3.05 - 3.00 (m, 4H), 2.69 - 2.49 (m, 4H), 2.26 (s, 3H)
A-1.376	-	-H	6-F	3-Cl	-CH ₂ -	4-(3-metilpirazol-1-il)fenil-	¹ H RMN (400 MHz, DMSO-d ₆) δ = 10.84 (s, 1H), 8.30 (d, J = 2.3 Hz, 1H), 7.65 (d, J = 8.5 Hz, 2H), 7.55 (dd, J = 5.3, 8.7 Hz, 1H), 7.22 (t, J = 8.7 Hz, 1H), 7.07 (d, J = 8.5 Hz, 2H), 6.30 (d, J = 2.3 Hz, 1H), 3.61 (s, 3H), 2.76 - 2.61 (m, 4H), 2.25 (s, 3H), 2.25 (s, 3H)
A-1.377	-	-H	6-F	3-Cl	-CH ₂ -	4-(3,5-dimetilpirazol-1-il)fenil-	¹ H RMN (400 MHz, DMSO-d ₆) δ = 10.84 (s, 1H), 7.56 (dd, J = 5.3, 8.7 Hz, 1H), 7.35 (d, J = 8.3 Hz, 2H), 7.22 (t, J = 8.7 Hz, 1H), 7.12 (d, J = 8.3 Hz, 2H), 6.04 (s, 1H), 3.62 (s, 3H), 2.81 - 2.66 (m, 4H), 2.27 (s, 3H), 2.25 (s, 3H), 2.16 (s, 3H)
A-1.378	-	-H	6-F	3-Cl	-CH ₂ -	4-pirazol-1-ilfenil-	¹ H RMN (400 MHz, DMSO-d ₆) δ = 10.85 (s, 1H), 8.44 (s, 1H), 7.77 - 7.65 (m, 3H), 7.56 (dd, J = 5.3, 8.7 Hz, 1H), 7.22 (t, J = 8.7 Hz, 1H), 7.11 (d, J = 8.2 Hz, 2H), 6.52 (s, 1H), 3.61 (s, 3H), 2.78 - 2.61 (m, 4H), 2.28 (s, 3H)
A-1.379	-	-H	6-F	3-Cl	-CH ₂ -	4-pirrol-1-ilfenil-	¹ H RMN (400 MHz, DMSO-d ₆) δ = 10.85 (s, 1H), 7.56 (dd, J = 5.2, 8.7 Hz, 1H), 7.45 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 7.31 (t, J = 2.1 Hz, 2H), 7.22 (t, J = 8.7 Hz, 1H), 7.07 (d, J = 8.4 Hz, 2H), 6.24 (t, J = 2.1 Hz, 2H), 3.62 (s, 3H), 2.76 - 2.60 (m, 4H), 2.27 (s, 3H)
A-1.380	-	-H	6-F	3-Cl	-CH ₂ -	4-(5-metiltetrahidrofuran-2-il)fenil-	¹ H RMN (400 MHz, cloroformo) δ = 7.42 - 7.38 (m, 1H), 7.20 - 7.14 (m, 2H), 6.96 - 6.87 (m, 3H), 4.79 - 4.71 (m, 1H), 4.16-4.05 (m, 1H), 2.84 - 2.62 (m, 4H), 2.27 (s, 3H), 2.29 - 2.16 (m, 1H), 2.13 - 2.02 (m, 1H), 1.92 - 1.71 (m, 1H), 1.68 - 1.49 (m, 1H), 1.33 (d, J = 6.1 Hz, 3H)
A-1.381	-	-H	6-F	3-Cl	-CH ₂ -	4-(5-metil-2-furil)fenil-	¹ H RMN (400 MHz, cloroformo) δ ppm 7.44 - 7.48 (m, 2H), 7.42 (dd, J=5.2, 8.8 Hz, 1H), 6.93 - 7.00 (m, 3H), 6.47 (d, J=3.2 Hz, 1H), 6.00 - 6.05 (m, 1H), 3.72 (s, 3H), 2.68 - 2.89 (m, 4H), 2.35 (s, 3H), 2.25 (s, 3H)
A-1.382	-	-H	6-F	3-Cl	-CH ₂ -	4-oxazol-2-ilfenil-	¹ H RMN (400 MHz, cloroformo) δ ppm 7.75 (d, J=8.2 Hz, 2H), 7.57 (s, 1H), 7.20 (dd, J=5.1, 8.8 Hz, 1H), 7.01 (d, J=8.2 Hz, 2H), 6.84 - 6.91 (m, 2H), 3.77 (s, 3H), 2.74 (td, J=5.2, 12.5 Hz, 1H), 2.58 (td, J=4.9, 12.5 Hz, 1H), 2.32 - 2.42 (m, 4H), 2.11 (td, J=4.9, 12.4 Hz, 1H)
A-1.383	-	-H	6-F	3-Cl	-CH ₂ -	4-(2-metilazol-4-il)fenil-	¹ H RMN (400 MHz, metanol) δ ppm 7.73 (d, J=8.1 Hz, 2H), 7.55 (s, 1H), 7.51 (dd, J=5.2, 8.7 Hz, 1H), 7.11 (t, J=8.7 Hz, 1H), 7.06 (d, J=8.1 Hz, 2H), 3.73 (s, 3H), 2.65 - 2.86 (m, 7H), 2.33 (s, 3H)
A-1.384	-	-H	6-F	3-Cl	-CH ₂ -	4-(2-fenil)fenil-	¹ H RMN (400 MHz, metanol) δ ppm 7.54 - 7.46 (m, 3H), 7.32 (d, J = 3.8 Hz, 2H), 7.10 (t, J = 8.7 Hz, 1H), 7.06 (dd, J = 3.8, 5.1 Hz, 1H), 7.02 (d, J = 8.2 Hz, 2H), 3.72 (s, 3H), 2.84 - 2.64 (m, 4H), 2.32 (s, 3H)
A-1.386	-	-H	6-F	3-Cl	-CH ₂ -	1-fenil-4-pirazolil-	¹ H RMN (400 MHz, DMSO-d ₆) δ ppm 8.20 (s, 1H), 7.78 - 7.74 (m, 2H), 7.56 (dd, J = 5.2, 8.7 Hz, 1H), 7.49 - 7.43 (m, 2H), 7.40 (s, 1H), 7.29 - 7.25 (m, 1H), 7.22 (t, J = 8.7 Hz, 1H), 3.59 (s, 3H), 2.81 - 2.69 (m, 2H), 2.67 - 2.52 (m, 2H), 2.24 (s, 3H)
A-1.387	-	-H	6-F	3-Cl	-CH ₂ -	1-ciclopropil-4-pirazolil-	¹ H RMN (400 MHz, DMSO-d ₆) δ = 10.77 (s, 1H), 7.54 (dd, J = 5.2, 8.9 Hz, 1H), 7.43 (s, 1H), 7.20 (t, J = 8.7 Hz, 1H), 7.04 (s, 1H), 3.59 (s, 3H), 3.63 - 3.65 (m, 1H), 2.70 - 2.56 (m, 2H), 2.49 - 2.35 (m, 2H), 2.25 (s, 3H), 0.98 - 0.91 (m, 2H), 0.91 - 0.84 (m, 2H)

 (1)						
Compuesto	R ¹	R ²	G	X	Y	W
A-1.389	-	Me	-H	6- F	3- Cl	-CH ₂ - CH ₂ -
A-1.390	-	Me	-H	6- F	3- Cl	-CH ₂ - CH ₂ -
A-1.391	-	Me	-H	6- F	3- Cl	-CH ₂ - CH ₂ -
A-1.392	-	Me	-H	6- F	3- Cl	-CH ₂ - CH ₂ -
Detalles de RMN						
¹ H RMN (400 MHz, d ₆ -DMSO), δ ppm 10,82 (s a, 1H), 7,58 - 7,52 (m, 1H), 7,23 - 7,18 (m, 3H), 6,95 - 6,93 (d, 2H), 3,69 (s, 2H), 3,60 (s, 3H), 2,76-2,49(m, 5H), 2,26 (s, 3H), 1,17 (d, 6H)						
¹ H RMN (500 MHz, cloroformo) δ ppm 7,68 (d, J = 8,2 Hz, 2H), 7,38 (dd, J = 5,1, 8,7 Hz, 1H), 7,17 - 7,11 (m, J = 8,2 Hz, 2H), 6,96 (t, J = 8,7 Hz, 1H), 3,72 (s, 3H), 2,84 - 2,71 (m, 4H), 2,63 (s, 3H), 2,30 (s, 3H)						
¹ H RMN (500 MHz, cloroformo) δ ppm 7,76 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,48 (dd, J = 5,2, 8,7 Hz, 2H), 7,15 (d, J = 8,4 Hz, 2H), 7,05 (t, J = 8,7 Hz, 1H), 3,76 (s, 3H), 2,94 - 2,72 (m, 4H), 2,32 (s, 3H)						
¹ H RMN (400 MHz, DMSO-d ₆) δ ppm 10,83 (s, 1H), 7,87 (s a, 1H), 7,76 (d, J = 8,2 Hz, 2H), 7,55 (dd, J = 5,3, 8,7 Hz, 1H), 7,26 (s a, 1H), 7,22 (t, J = 8,7 Hz, 1H), 7,07 (d, J = 8,2 Hz, 2H), 3,61 (s, 3H), 2,75 - 2,63 (m, 4H), 2,26 (s, 3H)						

B1 Eficacia posemergencia- Prueba 1

Semillas de una diversidad de especies de ensayo se siembran en tierra estándar en macetas: - *Solanum nigrum* (SOLNI), *Amaranthus retroflexus* (AMARE), *Setaria faberi* (SETFA), *Echinochloa crus-galli* (ECHCG), *Ipomoea hederacea* (IPOHE), *Lolium perenne* (LOLPE). Después de 8 días de cultivo (posemergencia) en condiciones controladas en un invernadero (a 24/16 °C, día/noche; 14 horas de luz; 65 % de humedad), las plantas se pulverizan con una disolución acuosa de pulverización derivada de la formulación del principio activo técnico en disolución de acetona/agua (50:50) que contiene Tween 20 al 0,5 % (monolaurato de polioxietilensorbitán, CAS RN 9005-64-5). Los compuestos se aplican a 1000 g/ha. Las plantas de prueba se cultivaron después en un invernadero en condiciones controladas en un invernadero (a 24/16 °C, día/noche; 14 horas de luz; 65 % de humedad) y se regaron dos veces al día. Después de 13 días, la prueba se evalúa para determinar el porcentaje de daño causado a la planta. Las actividades biológicas se evalúan en una escala de cinco puntos (5 = 80-100 %; 4 = 60-79 %; 3=40-59 %; 2=20-39 %; 1=0-19 %). Un valor en blanco en la tabla es indicativo de que el compuesto no se probó en esa especie.

Tabla 5 Control de especies de malezas por compuestos de fórmula (I) después de la aplicación posemergencia

Compuesto	AMARE	SOLNI	SETFA	LOLPE	ECHCG	IPOHE
A-1.036	5	5	5	5	5	5

B2 Eficacia posemergencia- Prueba 2

Semillas de una diversidad de especies de ensayo se siembran en tierra estándar en macetas: - *Solanum nigrum* (SOLNI), *Amaranthus retroflexus* (AMARE), *Setaria faberi* (SETFA), *Echinochloa crus-galli* (ECHCG), *Ipomoea hederacea* (IPOHE), *Lolium perenne* (LOLPE). Después de 8 días de cultivo (posemergencia) en condiciones controladas en un invernadero (a 24/16 °C, día/noche; 14 horas de luz; 65 % de humedad), las plantas se pulverizan con una disolución acuosa de pulverización derivada de la formulación del principio activo técnico en disolución de acetona/agua (50:50) que contiene Tween 20 al 0,5 % (monolaurato de polioxietilensorbitán, CAS RN 9005-64-5). Los compuestos se aplican a 250 g/ha. Las plantas de prueba se cultivaron después en un invernadero en condiciones controladas en un invernadero (a 24/16 °C, día/noche; 14 horas de luz; 65 % de humedad) y se regaron dos veces al día. Después de 13 días, la prueba se evalúa para determinar el porcentaje de daño causado a la planta. Las actividades biológicas se evalúan en una escala de cinco puntos (5 = 80-100 %; 4 = 60-79 %; 3=40-59 %; 2=20-39 %; 1=0-19 %). Un valor en blanco en la tabla es indicativo de que el compuesto no se probó en esa especie.

Tabla 6 Control de especies de malezas por compuestos de fórmula (I) después de la aplicación posemergencia

Compuesto	AMARE	SOLNI	SETFA	LOLPE	ECHCG	IPOHE
A-1.024	5	5	5	5	4	5
A-1.025	5	5	5	5	5	5
A-1.026	4	4	2	1	0	0
A-1.027	5	4	5	5	5	4
A-1.028	5	5	5	5	5	5
A-1.029	4	5	4	4	2	5
A-1.030	4	5	4	5	4	5
A-1.031	5	5	4	4	4	4
A-1.032	5	5	5	5	5	5
A-1.033	5	5	5	5	4	5
A-1.034	5	5	5	5	1	5
A-1.035	4	5	4	4	4	4
A-1.036	5	5	5	5	5	5
A-1.037	1	5	5	1	3	5
A-1.038	5	5	5	5	5	5
A-1.039	5	5	5	5	5	5
A-1.040	3	3	0	0	0	0

Compuesto	AMARE	SOLNI	SETFA	LOLPE	ECHCG	IPOHE
A-1.041	5	5	4	1	1	2
A-1.042	5	5	5	5	5	3
A-1.044	5	5	5	4	3	0
A-2.030	3	4	0	1	0	4
A-2.037	1	2	1	1	2	2
A-3.028	4	5	4	5	5	5
A-3.029	4	5	2	2	1	5
A-3.030	5	5	5	4	2	5
A-3.035	5	5	5	5	4	5
A-3.036	5	5	4	4	4	5
A-3.038	5	5	5	5	2	5
A-4.029	4	4	0	1	1	4
A-4.030	2	3	0	1	1	3
A-4.035	1	3	0	0	0	3
A-4.036	2	5	1	3	3	4
A-4.038	1	5	0	1	1	2
A-1.383	5	5	5	5	5	5
A-1.384	5	5	5	4	3	5
A-1.385	5	5	5	5	5	5

B3 Eficacia posemergencia- Prueba 3

Las semillas de una variedad de especies de prueba se siembran en suelo estándar en macetas:- *Amaranthus retroflexus* (AMARE), *Setaria faberi* (SETFA), *Echinochloa crus-galli* (ECHCG), *Ipomoea hederacea* (IPOHE), *Zea Mays* (ZEAMX), *Abutilon theophrasti* (ABUTH). Después de 8 días de cultivo (posemergencia) en condiciones controladas en un invernadero (a 24/16 °C, día/noche; 14 horas de luz; 65 % de humedad), las plantas se pulverizan con una disolución acuosa de pulverización derivada de la formulación del principio activo técnico en disolución de acetona/agua (50:50) que contiene Tween 20 al 0,5 % (monolaurato de polioxietilensorbitán, CAS RN 9005-64-5). Los compuestos se aplican a 250 g/ha. Las plantas de prueba se cultivaron después en un invernadero en condiciones controladas en un invernadero (a 24/16 °C, día/noche; 14 horas de luz; 65 % de humedad) y se regaron dos veces al día. Después de 13 días, la prueba se evalúa para determinar el porcentaje de daño causado a la planta. Las actividades biológicas se evalúan en una escala de cinco puntos (5 = 80-100 %; 4 = 60-79 %; 3=40-59 %; 2=20-39 %; 1=0-19 %). Un valor en blanco en la tabla es indicativo de que el compuesto no se probó en esa especie.

Tabla 7 Control de especies de malezas por compuestos de fórmula (I) después de la aplicación posemergencia

Compuesto	AMARE	ZEAMX	SETFA	ABUTH	ECHCG	IPOHE
A-1.380	4	2	3	3	1	3
A-1.381	4	1	2	3	0	4
A-1.382	4	5	4	4	4	5
A-3.386	4	5	4	4	5	4
C-1.013	5	4	4	4	5	4
A-1.386	4	4	4	3	4	4
A-1.387	4	4	4	4	4	4
A-1.388	5	4	4	5	4	4
A-1.389	4	5	5	4	5	5
A-1.390	5	1	5	4		4
A-1.391	4	1	4	2		3

Compuesto	AMARE	ZEAMX	SETFA	ABUTH	ECHCG	IPOHE
A-1.392	5	2	5	4		3

B4 Eficacia preemergencia - Prueba 1

Se sembraron semillas de una variedad de especies de prueba en suelo estándar en macetas: *Solanum nigrum* (SOLNI), *Amaranthus retroflexus* (AMARE), *Setaria faberi* (SETFA), *Echinochloa crus-galli* (ECHCG), *Ipomoea hederacea* (IPOHE), *Lolium perenne* (LOLPE). Después de un día de cultivo (preemergencia) en condiciones controladas en un invernadero (a 24/16 °C, día/noche; 14 horas de luz; 65 % de humedad), las plantas se pulverizaron con una disolución de pulverización acuosa derivada de la formulación del principio activo técnico en disolución acetona/agua (50:50) que contiene 0,5 % de Tween 20 (monolaurato de polioxietilensorbitano, CAS RN 9005-64-5). Los compuestos se aplican a 1000 g/ha. Las plantas de prueba se cultivaron después en un invernadero en condiciones controladas (a 24/16 °C, día/noche; 14 horas de luz; 65 % de humedad) y se regaron dos veces al día. Después de 13 días, la prueba se evalúa para determinar el porcentaje de daño causado a la planta. Las actividades biológicas se evalúan en una escala de cinco puntos (5 = 80-100 %; 4 = 60-79 %; 3=40-59 %; 2=20-39 %; 1=0-19 %). Un valor en blanco en la tabla es indicativo de que el compuesto no se probó en esa especie.

Tabla 8 Control de especies de malas hierbas mediante compuestos de fórmula (I) después de aplicación tras la germinación

Compuesto	AMARE	SOLNI	SETFA	LOLPE	ECHCG	IPOHE
A-1.036	5	5	5	5	5	5

B5 Eficacia preemergencia - Prueba 2

Se sembraron semillas de una variedad de especies de prueba en suelo estándar en macetas: *Solanum nigrum* (SOLNI), *Amaranthus retroflexus* (AMARE), *Setaria faberi* (SETFA), *Echinochloa crus-galli* (ECHCG), *Ipomoea hederacea* (IPOHE), *Lolium perenne* (LOLPE). Después de un día de cultivo (preemergencia) en condiciones controladas en un invernadero (a 24/16 °C, día/noche; 14 horas de luz; 65 % de humedad), las plantas se pulverizaron con una disolución de pulverización acuosa derivada de la formulación del principio activo técnico en disolución acetona/agua (50:50) que contiene 0,5 % de Tween 20 (monolaurato de polioxietilensorbitano, CAS RN 9005-64-5). Los compuestos se aplican a 250 g/ha. Las plantas de prueba se cultivaron después en un invernadero en condiciones controladas (a 24/16 °C, día/noche; 14 horas de luz; 65 % de humedad) y se regaron dos veces al día. Después de 13 días, la prueba se evalúa para determinar el porcentaje de daño causado a la planta. Las actividades biológicas se evalúan en una escala de cinco puntos (5 = 80-100 %; 4 = 60-79 %; 3=40-59 %; 2=20-39 %; 1=0-19 %). Un valor en blanco en la tabla es indicativo de que el compuesto no se probó en esa especie.

Tabla 9 Control de especies de malas hierbas mediante compuestos de fórmula (I) después de aplicación tras la germinación

Compuesto	AMARE	SOLNI	SETFA	LOLPE	ECHCG	IPOHE
A-1.024	5	5	5	4	2	0
A-1.025	5	5	5	4	5	1
A-1.026	0	0	0	0	0	0
A-1.027	5	4	3	2	1	4
A-1.028	5	5	5	5	4	5
A-1.029	3	5	1	2	5	1
A-1.030	5	5	5	4	5	0
A-1.031	3	2	1	1	2	1
A-1.032	5	5	5	5	5	2
A-1.033	1	1	2	1	0	1
A-1.034	0	2	0	0	0	0
A-1.035	4	3	3	3	1	1
A-1.036	5	5	5	5	5	5
A-1.037	1	2	0	0	2	0

Compuesto	AMARE	SOLNI	SETFA	LOLPE	ECHCG	IPOHE
A-1.038	5	5	0	5	5	2
A-1.039	5	5	5	4	5	3
A-1.040	0	0	0	0	0	0
A-1.041	4	0	0	0	0	0
A-1.042	5	5	5	1	2	2
A-1.044	5	5	5	2	3	1
A-2.030	0	0	0	0	0	0
A-2.037	0	0	1	1	0	1
A-3.028	5	5	5	5	5	5
A-3.029	4	5	2	2	3	3
A-3.030	5	5	5	4	4	3
A-3.035	4	5	5	5	4	5
A-3.036	5	5	5	5	5	5
A-3.038	5	5	1	5	2	5
A-4.029	2	4	0	0	0	0
A-4.030	3	4	1	2	1	1
A-4.035	0	0	0	1	1	1
A-4.036	2	5	0	1	1	3
A-4.038	2	1	0	0	0	0
A-1.383	5	5	4	3	4	5
A-1.384	2	1	0	0	0	2
A-1.385	5	5	5	5	5	5

B6 Eficacia preemergencia - Prueba 3

- 5 Se sembraron semillas de una variedad de especies de prueba en suelo estándar en macetas: : *Amaranthus retroflexus* (AMARE), *Setaria faberi* (SETFA), *Echinochloa crus-galli* (ECHCG), *Ipomoea hederacea* (IPOHE), *Zea Mays* (ZEAMX), *Abutilon theophrasti* (ABUTH). Después de un día de cultivo (preemergencia) en condiciones controladas en un invernadero (a 24/16 °C, día/noche; 14 horas de luz; 65 % de humedad), las plantas se pulverizaron con una disolución de pulverización acuosa derivada de la formulación del principio activo técnico en disolución acetona/agua (50:50) que contiene 0,5 % de Tween 20 (monolaurato de polioxietilensorbitano, CAS RN 9005-64-5). Los compuestos se aplican a 250 g/ha. Las plantas de prueba se cultivaron después en un invernadero en condiciones controladas (a 24/16 °C, día/noche; 14 horas de luz; 65 % de humedad) y se regaron dos veces al día. Después de 13 días, la prueba se evalúa para determinar el porcentaje de daño causado a la planta. Las actividades biológicas se evalúan en una escala de cinco puntos (5 = 80-100 %; 4 = 60-79 %; 3=40-59 %; 2=20-39 %; 1=0-19 %). Un valor en blanco en la tabla es indicativo de que el compuesto no se probó en esa especie.

15 **Tabla 10 Control de especies de malas hierbas mediante compuestos de fórmula (I) después de aplicación tras la germinación**

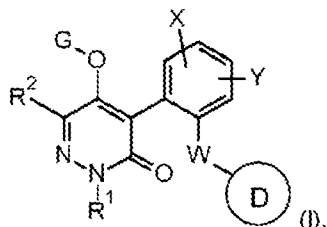
Compuesto	AMARE	ZEAMX	SETFA	ABUTH	ECHCG	IPOHE
A-1.380	5	2	1	4	0	4
A-1.381	3	1	0	1	0	3
A-1.382	5	4	5	4	5	5
A-3.386	5	5	5	5	5	5
C-1.013	5	4	5	5	5	5
A-1.386	2	2	5	2	5	4
A-1.387	5	4	5	4	5	5
A-1.388	5	4	5	5	5	5

ES 2 997 250 T3

Compuesto	AMARE	ZEAMX	SETFA	ABUTH	ECHCG	IPOHE
A-1.389	5	4	5	3	5	5
A-1.390	5	1	5	5		5
A-1.391	5	0	5	2		2
A-1.392	5	2	5	5	5	5

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de la fórmula (I)



o una sal o N-óxido del mismo, en donde

R¹ se selecciona del grupo que consiste en alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₃-C₆, alcoxi C₁-C₂-alquilo C₁-C₂, alqueno C₂-C₄, haloalquilo C₁-C₄, ciano-alquilo C₁-C₄, haloalqueno C₂-C₄, alquino C₂-C₄ y haloalquino C₂-C₄;

R² se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₃-alquil C₁-C₃-, alcoxi C₁-C₆, alcoxi C₁-C₃-alquilo C₁-C₃-, alcoxi C₁-C₃-alcoxi C₁-C₃-alquil C₁-C₃-, cicloalquilo C₃-C₆, alqueno C₂-C₆, haloalqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, hidroxialquil C₁-C₆-, alquil C₁-C₆-carbonilo, -S(O)_m-alquilo C₁-C₆, amino, alquil C₁-C₆-amino, dialquil C₁-C₆-amino, -C(alquil C₁-C₃)=N-O-alquilo C₁-C₃ y haloalquino C₂-C₆;

G es hidrógeno o C(O)R³;

R³ se selecciona del grupo que consiste en alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, alquil C₁-C₆-S-, alcoxi C₁-C₆-, -NR⁴R⁵ y fenilo opcionalmente sustituido con uno o más R⁶;

cada R⁴ y R⁵ se selecciona independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆ y cicloalquilo C₃-C₆, o R⁴ y R⁵ juntos pueden formar un anillo de morfolino; y

cada R^{4a} y R^{5a} se selecciona independientemente del grupo que consiste en alcoxi C₁-C₆ y cicloalquilo C₃-C₆, o R^{4a} y R^{5a} juntos pueden formar un anillo morfolino; y

R⁶ se selecciona del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃ y haloalcoxi C₁-C₃;

X e Y son cada uno independientemente hidrógeno, alquilo C₁-C₃, ciclopropilo, alcoxi C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃ o halógeno;

D es un anillo heteroarilo monocíclico sustituido que contiene 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados independientemente de oxígeno, nitrógeno y azufre, sustituido en al menos un átomo de carbono del anillo con R⁸ y/o en al menos un átomo de nitrógeno del anillo con R⁹;

al menos un R⁸ se selecciona del grupo que consiste en haloalquil C₁-C₆-carbonil-, cicloalquil C₃-C₆-carbonil-, -S(O)_m-haloalquilo C₁-C₆-, -S(O)_m-cicloalquilo C₃-C₆-, -O-S(O)₂-alquilo C₁-C₃-, -alquil C₁-C₃-S(O)_m-alquilo C₁-C₆-, -alquil C₁-C₃-S(O)_m-haloalquilo C₁-C₆-, -alquil C₁-C₃-S(O)_m-cicloalquilo C₃-C₆-, cianoalquil C₁-C₆-, -NR^{4a}R^{5a}-, -C(S)NR⁴R⁵-, -S(O)₂NHC(O)-alquilo C₁-C₃-, -S(O)₂NR⁴R⁵-, -C(O)OH, -C(O)O-alquilo C₁-C₆-, -C(O)NHS-(O)₂-alquilo C₁-C₆-, -C(O)NR⁴R⁵-, -NR⁴C(O)NR⁴R⁵-, alquil C₁-C₆-carbonil(alquil C₁-C₆)amino-, haloalquil C₁-C₆-carbonilamino-, haloalquil C₁-C₆-carbonil(alquil C₁-C₆)amino-, alquil C₁-C₆-sulfonilamino-, alquil C₁-C₆-sulfonil(alquil C₁-C₆)amino-, haloalquil C₁-C₆-sulfonilamino-, haloalquil C₁-C₆-sulfonil(alquil C₁-C₆)amino-, cicloalquil C₃-C₆-sulfonilamino-, cicloalquil C₃-C₆-sulfonil(alquil C₁-C₆)amino-, hidroxiamino-, hidroxi(alquil C₁-C₆)amino, alcoxi C₁-C₆-amino, alcoxi C₁-C₆(alquil C₁-C₆)amino, haloalcoxi C₁-C₆-amino, haloalcoxi C₁-C₆(alquil C₁-C₆)amino; y un sistema de anillos seleccionado del grupo que consiste en un anillo de fenilo, un anillo de heteroarilo de 5-6 miembros y un anillo de heterociclilo de 3-6 miembros, en donde dicho sistema de anillos está sustituido por 0 a 5 R¹⁶;

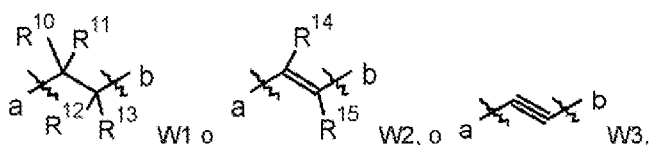
al menos un R⁹ se selecciona del grupo que consiste en alquilo C₅-C₆, haloalquilo C₅-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₃-alquil C₃-, alcoxi C₃-alquil C₁-C₂-, haloalcoxi C₁-C₃-alquil C₁-C₃-, alcoxi C₁-C₃-alcoxi C₁-C₃-alquil C₁-C₃-, hidroxialquil C₁-C₆-, -alquil C₁-C₃-S(O)_m-alquilo C₁-C₆-, -alquil C₁-C₃-S(O)_m-haloalquilo C₁-C₆-, -alquil C₁-C₃-S(O)_m-cicloalquilo C₃-C₆-, cianoalquil C₁-C₆-, y un sistema de anillos seleccionado del grupo que consiste en: un anillo de fenilo, un anillo de heteroarilo de 5-6 miembros y un anillo de heterociclilo de 3-6 miembros, en donde dicho sistema de anillos está sustituido por 0 a 5 R¹⁶;

m es un número entero de 0, 1 o 2;

cada R¹⁶ es independientemente halógeno, ciano, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆ o haloalcoxi C₁-C₆;

o D es un anillo de fenilo sustituido por al menos un R⁸; y

W es o



en donde:

"a" indica el punto de unión al resto fenilpiridazinodiona/fenilpiridazinona,

"b" indica el punto de unión al anillo D,

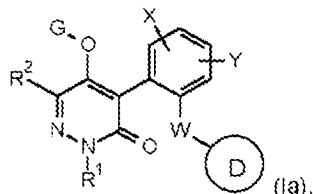
R¹⁰, R¹², R¹⁴ y R¹⁵ son cada uno independientemente hidrógeno, alquilo C₁-C₃ o haloalquilo C₁-C₃;

o R¹⁰ y R¹² junto con los átomos de carbono a los que están unidos forman un anillo carbocíclico C₃-C₆; y

R¹¹ y R¹³ son cada uno independientemente hidrógeno, halógeno, alquilo C₁-C₃ o haloalquilo C₁-C₃;

5 con la condición de que cuando uno de R¹¹ o R¹³ es halógeno, alquilo C₁-C₃ o haloalquilo C₁-C₃, el otro es hidrógeno.

2. Un compuesto de la fórmula (Ia)



o una sal o N-óxido del mismo, en donde

R¹ se selecciona del grupo que consiste en alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₃-C₆, alcoxi C₁-C₂-alquilo C₁-C₂, alqueno C₂-C₄, haloalquilo C₁-C₄, ciano-alquilo C₁-C₄, haloalqueno C₂-C₄, alquino C₂-C₄ y haloalquino C₂-C₄;

R² se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₃-alquil C₁-C₃-, alcoxi C₁-C₆, alcoxi C₁-C₃-alquilo C₁-C₃-, alcoxi C₁-C₃-alcoxi C₁-C₃-alquil C₁-C₃-, cicloalquilo C₃-C₆, alqueno C₂-C₆, haloalqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, hidroxialquil C₁-C₆-, alquil C₁-C₆-carbonil-, -S(O)_m-alquilo C₁-C₆-, -NR⁴R⁵-, -C(alquil C₁-C₃)=N-O-alquilo C₁-C₃ y haloalquino C₂-C₆;

G es hidrógeno o C(O)R³;

R³ se selecciona del grupo que consiste en alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, alquil C₁-C₆-S-, alcoxi C₁-C₆-, -NR⁴R⁵ y fenilo opcionalmente sustituido con uno o más R⁶; cada R⁴ y R⁵ se selecciona independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆ y cicloalquilo C₃-C₆, o R⁴ y R⁵ juntos pueden formar un anillo de morfolino; y

R⁶ se selecciona del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃ y haloalcoxi C₁-C₃;

X es ciclopropilo;

Y es hidrógeno, alquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃ o halógeno;

D es un anillo heteroarilo monocíclico sustituido o no sustituido que contiene 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados independientemente de oxígeno, nitrógeno y azufre, y en donde cuando D está sustituido, está sustituido en al menos un átomo de carbono del anillo con R⁸ y/o en un átomo de nitrógeno del anillo con R⁹;

cada R⁸ es independientemente hidrógeno, oxígeno, hidroxilo, halógeno, ciano, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alcoxi C₁-C₃-alquilo C₁-C₃-, haloalcoxi C₁-C₃-alquil C₁-C₃-, alcoxi C₁-C₃-alcoxi C₁-C₃-alquil C₁-C₃-, alqueno C₂-C₆, haloalqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, haloalquino C₂-C₆, hidroxialquil C₁-C₆-, alquil C₁-C₆-carbonil-, haloalquil C₁-C₆-carbonil-, cicloalquil C₃-C₆-carbonil-, -S(O)_m-haloalquilo C₁-C₆-, -S(O)_m-cicloalquilo C₃-C₆-, -O-S(O)₂-alquilo C₁-C₃-, -alquil C₁-C₃-S(O)_m-alquilo C₁-C₆-, -alquil C₁-C₃-S(O)_m-haloalquilo C₁-C₆-, -alquil C₁-C₃-S(O)_m-cicloalquilo C₃-C₆-, cianoalquil C₁-C₆-, NR⁴R⁵-, -C(S)NR⁴R⁵-, -S(O)₂NHC(O)alquilo C₁-C₃-, -S(O)₂NR⁴R⁵-, -C(O)OH-, -C(O)Oalquilo C₁-C₆-, -C(O)NHS-(O)₂-alquilo C₁-C₆-, -C(O)NR⁴R⁵-, -NR⁴C(O)NR⁴R⁵-, alquil C₁-C₆-carbonil(alquil C₁-C₆)amino-, haloalquil C₁-C₆-carbonilamino-, haloalquil C₁-C₆-carbonil(alquil C₁-C₆)amino-, alquil C₁-C₆-sulfonilamino-, alquil C₁-C₆-sulfonil(alquil C₁-C₆)amino-, haloalquil C₁-C₆-sulfonilamino-, haloalquil C₁-C₆-sulfonil(alquil C₁-C₆)amino-, cicloalquil C₃-C₆-sulfonilamino-, cicloalquil C₃-C₆-sulfonil(alquil C₁-C₆)amino-, hidroxiamino-, hidrox(alquil C₁-C₆)amino, alcoxi C₁-C₆-amino, alcoxi C₁-C₆(alquil C₁-C₆)amino, haloalcoxi C₁-C₆-amino, haloalcoxi C₁-C₆(alquil C₁-C₆)amino; o un sistema de anillos seleccionado del grupo que consiste en: un anillo de fenilo, un anillo de heteroarilo de 5-6 miembros y un anillo de heterociclilo de 3-6 miembros, en donde dicho sistema de anillos está sustituido por 0 a 5 R¹⁶;

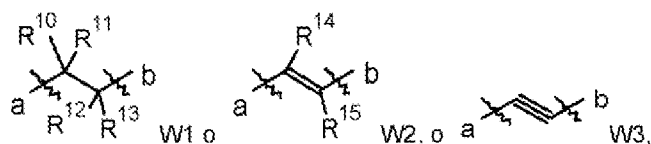
m es un número entero de 0, 1 o 2; y

cada R⁹ es independientemente alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₃-alquilo C₁-C₃-, haloalcoxi C₁-C₃-alquil C₁-C₃-, alcoxi C₁-C₃-alcoxi C₁-C₃-alquil C₁-C₃-, hidroxialquil C₁-C₆-, -alquil C₁-C₃-S(O)_m-alquilo C₁-C₆-, -alquil C₁-C₃-S(O)_m-haloalquilo C₁-C₆-, -alquil C₁-C₃-S(O)_m-cicloalquilo C₃-C₆-, cianoalquil C₁-C₆-, o un sistema de anillos seleccionado del grupo que consiste en: un anillo de fenilo, un anillo de heteroarilo de 5-6 miembros y un anillo de heterociclilo de 3-6 miembros, en donde dicho sistema de anillos está sustituido por 0 a 5 R¹⁶;

cada R¹⁶ es independientemente halógeno, ciano, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆ o haloalcoxi C₁-C₆; o D es un anillo de fenilo sustituido o sin sustituir, y en donde cuando dicho anillo de fenilo está sustituido, está sustituido por 1 a 5 R⁸;

y

W es o



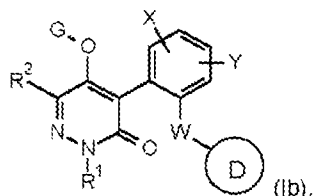
en donde

"a" indica el punto de unión al resto fenilpiridazinodiona/fenilpiridazinona,

"b" indica el punto de unión al anillo D,

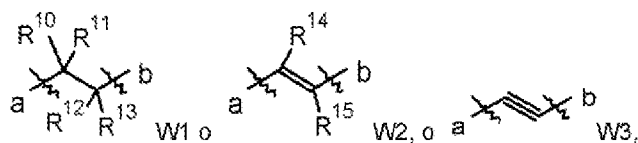
- 5 R^{10} , R^{12} , R^{14} y R^{15} son cada uno independientemente hidrógeno, alquilo C₁-C₃ o haloalquilo C₁-C₃; o R^{10} y R^{12} junto con los átomos de carbono a los que están unidos forman un anillo carbocíclico C₃-C₆; y R^{11} y R^{13} son cada uno independientemente hidrógeno, halógeno, alquilo C₁-C₃, o haloalquilo C₁-C₃, con la condición de que cuando uno de R^{11} o R^{13} es halógeno, alquilo C₁-C₃ o haloalquilo C₁-C₃, el otro es hidrógeno.

- 10 3. Un compuesto de fórmula (Ib)



o una sal o N-óxido del mismo, en donde

- 15 R^1 se selecciona del grupo que consiste en alquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₃-C₆, alcoxi C₁-C₂-alquilo C₁-C₂, alquenilo C₂-C₄, haloalquilo C₁-C₄, ciano-alquilo C₁-C₄, haloalquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄ y haloalquinilo C₂-C₄; R^2 se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₃-alquil C₁-C₃, alcoxi C₁-C₆, alcoxi C₁-C₃-alquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃-alcoxi C₁-C₃-alquil C₁-C₃, cicloalquilo C₃-C₆, alquenilo C₂-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, hidroxialquil C₁-C₆, alquil C₁-C₆-carbonil-, -S(O)_m-alquilo C₁-C₆, -NR⁴R⁵, -C(alquil C₁-C₃)=N-O-alquilo C₁-C₃ y haloalquinilo C₂-C₆; G es hidrógeno o C(O)R³; R^3 se selecciona del grupo que consiste en alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, alquil C₁-C₆-S-, alcoxi C₁-C₆, -NR⁴R⁵ y fenilo opcionalmente sustituido con uno o más R⁶; cada R⁴ y R⁵ se selecciona independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆ y cicloalquilo C₃-C₆, o R⁴ y R⁵ juntos pueden formar un anillo de morfolinilo; y R^6 se selecciona del grupo que consiste en halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃ y haloalcoxi C₁-C₃. X hidrógeno, alquilo C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃ o halógeno; Y es ciclopropilo; D es un anillo heteroarilo monocíclico sustituido o no sustituido que contiene 1, 2 o 3 heteroátomos seleccionados independientemente de oxígeno, nitrógeno y azufre, y en donde cuando D está sustituido, está sustituido en al menos un átomo de carbono del anillo con R⁸ y/o en un átomo de nitrógeno del anillo con R⁹; cada R⁸ es independientemente hidrógeno, oxígeno, hidroxilo, halógeno, ciano, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alcoxi C₁-C₃-alquilo C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃-alquil C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃-alcoxi C₁-C₃-alquil C₁-C₃, alquenilo C₂-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, haloalquinilo C₂-C₆, hidroxialquil C₁-C₆, alquil C₁-C₆-carbonil-, haloalquil C₁-C₆-carbonil-, cicloalquil C₃-C₆-carbonil-, -S(O)_m-haloalquilo C₁-C₆, -S(O)_m-cicloalquilo C₃-C₆, -O-S(O)₂-alquilo C₁-C₃, -alquil C₁-C₃-S(O)_m-alquilo C₁-C₆, -alquil C₁-C₃-S(O)_m-haloalquilo C₁-C₆, -alquil C₁-C₃-S(O)_m-cicloalquilo C₃-C₆, cianoalquil C₁-C₆, NR⁴R⁵, -C(S)NR⁴R⁵, -S(O)₂NHC(O)alquilo C₁-C₃, -S(O)₂NR⁴R⁵, -C(O)OH, -C(O)Oalquilo C₁-C₆, -C(O)NHS-(O)₂-alquilo C₁-C₆, -C(O)NR⁴R⁵, -NR⁴C(O)NR⁴R⁵, alquil C₁-C₆-carbonil(alquil C₁-C₆)amino-, haloalquil C₁-C₆-carbonilamino-, haloalquil C₁-C₆-carbonil(alquil C₁-C₆)amino-, alquil C₁-C₆-sulfonilamino-, alquil C₁-C₆-sulfonil(alquil C₁-C₆)amino-, haloalquil C₁-C₆-sulfonilamino-, haloalquil C₁-C₆-sulfonil(alquil C₁-C₆)amino-, cicloalquil C₃-C₆-sulfonilamino-, cicloalquil C₃-C₆-sulfonil(alquil C₁-C₆)amino-, hidroxiamino-, hidroxi(alquil C₁-C₆)amino, alcoxi C₁-C₆-amino, alcoxi C₁-C₆(alquil C₁-C₆)amino, haloalcoxi C₁-C₆-amino, haloalcoxi C₁-C₆(alquil C₁-C₆)amino; o un sistema de anillos seleccionado del grupo que consiste en un anillo de fenilo, un anillo de heteroarilo de 5-6 miembros y un anillo de heterociclilo de 3-6 miembros, en donde dicho sistema de anillos está sustituido por 0 a 5 R¹⁶; m es un número entero de 0, 1 o 2; y cada R⁹ es independientemente alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₃-alquilo C₁-C₃, haloalcoxi C₁-C₃-alquil C₁-C₃, alcoxi C₁-C₃-alcoxi C₁-C₃-alquil C₁-C₃, hidroxialquil C₁-C₆, -alquil C₁-C₃-S(O)_m-alquilo C₁-C₆, -alquil C₁-C₃-S(O)_m-haloalquilo C₁-C₆, -alquil C₁-C₃-S(O)_m-cicloalquilo C₃-C₆, cianoalquil C₁-C₆, o un sistema de anillos seleccionado del grupo que consiste en: un anillo de fenilo, un anillo de heteroarilo de 5-6 miembros y un anillo de heterociclilo de 3-6 miembros, en donde dicho sistema de anillos está sustituido por 0 a 5 R¹⁶; cada R¹⁶ es independientemente halógeno, ciano, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆ o haloalcoxi C₁-C₆; o D es un anillo de fenilo sustituido o sin sustituir, y en donde cuando dicho anillo de fenilo está sustituido, está sustituido por 1 a 5 R⁸; y W es o



en donde

"a" indica el punto de unión al resto fenilpiridazinodiona/fenilpiridazinona,

"b" indica el punto de unión al anillo D,

R¹⁰, R¹², R¹⁴ y R¹⁵ son cada uno independientemente hidrógeno, alquilo C₁-C₃ o haloalquilo C₁-C₃;

o R¹⁰ y R¹² junto con los átomos de carbono a los que están unidos forman un anillo carbocíclico C₃-C₆; y

R¹¹ y R¹³ son cada uno independientemente hidrógeno, halógeno, alquilo C₁-C₃, o haloalquilo C₁-C₃, con la condición de que cuando uno de R¹¹ o R¹³ es halógeno, alquilo C₁-C₃ o haloalquilo C₁-C₃, el otro es hidrógeno.

4. El compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3, en donde G es hidrógeno o -C(O)R³ y R³ es alquilo C₁-C₄, alqueno C₂-C₃, alquino C₂-C₃, alcoxi C₁-C₄, -NR⁴R⁵ en donde R⁴ y R⁵ forman juntos un anillo de morfolino, o fenilo.

5. El compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones precedentes, en donde G es hidrógeno o C(O)R³ en donde R³ es isopropilo, t-butilo, metilo, etilo, propargilo, metoxi, etoxi o *tert*-butoxi.

6. El compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones 1, 3, 4 o 5, en donde X es hidrógeno, alquilo C₁-C₃, halógeno o haloalquilo C₁.

7. El compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones 1, 2, 4, 5 o 6, en donde Y es hidrógeno, alquilo C₁-C₃, haloalquilo C₁-C₃ o halógeno.

8. El compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones precedentes, en el que X está en *orto* con respecto al resto piridazinona/piridazina-diona.

9. El compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones precedentes, en donde Y está en *orto* respecto al resto -W-D.

10. El compuesto de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones precedentes, en el que R¹ es metilo, etilo, *n*-propilo, ciclopropilo, propargilo o haloalquilo C₁.

11. El compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones precedentes, en donde R² se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, alcoxi C₁-C₃-alquilo C₁-C₃, cicloalquilo C₃-C₆, alqueno C₂-C₆, haloalqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆ y haloalquino C₂-C₆.

12. El compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones precedentes, en donde D es un anillo de heteroarilo monocíclico sustituido o sin sustituir.

13. El compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 11, en donde D es un anillo de fenilo sustituido o sin sustituir.

14. El compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones precedentes, en donde W es W1 y cada uno de R¹⁰, R¹¹, R¹² y R¹³ es hidrógeno.

15. El compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 13, en donde W es W2 y cada uno de R¹⁴ y R¹⁵ es hidrógeno.

16. El compuesto según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 13, en donde W es W3.

17. Una composición herbicida que comprende un compuesto herbicida de acuerdo con una cualquiera de las reivindicaciones 1-16 y un adyuvante de formulación agronómicamente aceptable.

18. Una composición herbicida según la reivindicación 17, que comprende además al menos un plaguicida adicional.

19. Una composición herbicida según la reivindicación 18, en donde el pesticida adicional es un herbicida o un protector de herbicidas.

20. Un método de control del crecimiento de plantas indeseadas, que comprende aplicar un compuesto de fórmula (I), (Ia) o (Ib) como se define en una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 16, o una composición herbicida según una cualquiera de las reivindicaciones 17 a 19, a las plantas indeseadas o al emplazamiento de las mismas.

21. Uso de un compuesto de fórmula (I), (Ia) o (Ib) como se define en una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 16 como herbicida.