



19



OFICINA ESPAÑOLA DE  
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA

11 Número de publicación: **2 278 738**

51 Int. Cl.:  
**C07C 237/30** (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

86 Número de solicitud europea: **01924277 .5**

86 Fecha de presentación : **20.03.2001**

87 Número de publicación de la solicitud: **1265850**

87 Fecha de publicación de la solicitud: **18.12.2002**

54 Título: **Antranilamidas insecticidas.**

30 Prioridad: **22.03.2000 US 191242 P**  
**24.07.2000 US 220232 P**  
**11.12.2000 US 254635 P**  
**17.01.2001 US 262015 P**

45 Fecha de publicación de la mención BOPI:  
**16.08.2007**

45 Fecha de la publicación del folleto de la patente:  
**16.08.2007**

73 Titular/es:  
**E.I. DU PONT DE NEMOURS AND COMPANY**  
**1007 Market Street**  
**Wilmington, Delaware 19898, US**

72 Inventor/es: **Lahm, George, P.;**  
**Myers, Brian, J.;**  
**Selby, Thomas, P. y**  
**Stevenson, Thomas, M.**

74 Agente: **Torner Lasalle, Nuria**

ES 2 278 738 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).

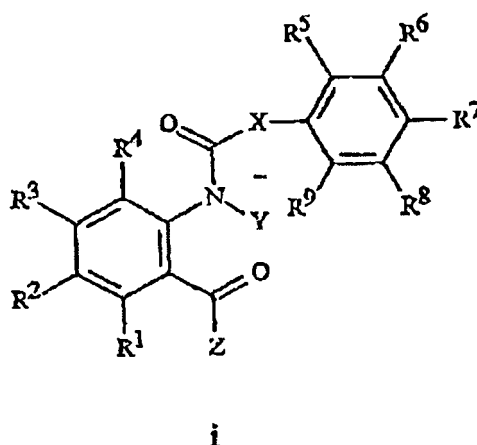
DESCRIPCIÓN

Antranilamidas insecticidas.

5 Esta invención trata sobre determinadas antranilamidas, sus N-óxidos, sales y composiciones apropiadas para su uso en agricultura, y sobre los métodos de su uso como artropodocidas tanto en entornos agronómicos como no agronómicos.

10 El control de las plagas de artrópodos es extremadamente importante para conseguir una alta eficiencia en los cultivos. El daño causado por los artrópodos sobre los cultivos en crecimiento y almacenados puede provocar una reducción significativa en la productividad y, de esta forma, resultar en un aumento de costes para el consumidor. El control de las plagas de artrópodos en cultivos forestales, cultivos de invernadero, cultivos ornamentales, viveros, productos alimentarios y de fibra almacenados, ganado, salud doméstica, pública y animal también es de importancia. Existen numerosos productos que se pueden adquirir comercialmente para estos propósitos, pero continúa existiendo  
15 la necesidad de nuevos compuestos que sean más efectivos, menos costosos, menos tóxicos, medioambientalmente más seguros o que posean distintos modos de acción.

NL 9202078 revela derivados del ácido N-acil antranílico de Fórmula I como insecticidas



donde, entre otros,

40 X es un enlace directo;

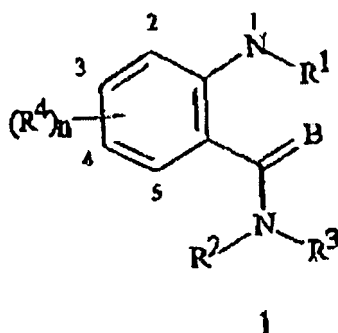
Y es H o alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>;

45 Z es NH<sub>2</sub>, NH(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>) o N(alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>)<sub>2</sub>; y

R<sup>1</sup> a R<sup>9</sup> son de forma independiente H, halógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, fenilo, hidroxilo, alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> o aciloxilo C<sub>1</sub>-C<sub>7</sub>.

50 **Breve exposición de la invención**

Esta invención pertenece a un método para el control de artrópodos que comprende la puesta en contacto de los artrópodos o de su entorno con una cantidad con eficacia artropodocida de un compuesto de Fórmula I, su N-óxido o sales apropiadas para su uso agrícola



## ES 2 278 738 T3

donde

A y B son de forma independiente O o S;

5 cada J es de forma independiente un grupo fenilo o naftilo sustituido con de 1 a 2 R<sup>5</sup> y opcionalmente sustituido con de 1 a 3 R<sup>6</sup>;

10 o cada J es de forma independiente un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros o un sistema de anillos heterocíclicos fusionado de 8, 9 o 10 miembros donde cada anillo o sistema de anillos está opcionalmente sustituido con de 1 a 4 R<sup>7</sup>;

n es de 1 a 4;

15 R<sup>1</sup> es H; o alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquino C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> o cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> cada uno opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de entre el grupo formado por halógeno, CN, NO<sub>2</sub>, hidroxilo, alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, dialquilamino C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> y cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>; o

20 R<sup>1</sup> es alquilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquilaminocarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, dialquilaminocarbonilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> o C (=A) J;

R<sup>2</sup> es H, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquino C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, dialquilamino C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>, cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> o alquilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>;

25 R<sup>3</sup> es H; G; alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquino C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, cada uno opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de entre el grupo formado por halógeno, G, CN, NO<sub>2</sub>, hidroxilo, alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, trialquilsililo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, o a fenilo, fenoxilo o anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, cada anillo opcionalmente sustituido con de uno a tres sustituyentes seleccionados de forma independiente de entre el  
30 grupo formado por alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alquino C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalqueno C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquino C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, halocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, halógeno, CN, NO<sub>2</sub>, alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, dialquilamino C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>, cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, (alquil) cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alquilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquilaminocarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, dialquilaminocarbonilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> y trialquilsililo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>; alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>; alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>; dialquilamino C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>;  
35 cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>; C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alcoxilcarbonilo o alquilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>; o

R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> se pueden tomar conjuntamente con el nitrógeno al cual están unidos para formar un anillo que contiene de 2 a 6 átomos de carbono y opcionalmente un átomo adicional de nitrógeno, azufre o oxígeno, dicho anillo puede estar opcionalmente sustituido con de 1 a 4 sustituyentes seleccionados de entre el grupo formado por alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>,  
40 halógeno, CN, NO<sub>2</sub> y alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>;

G es un anillo carbocíclico o heterocíclico no aromático de 5 o 6 miembros, opcionalmente incluyendo uno o dos miembros de anillos seleccionados de entre el grupo formado por C (=O), SO o S(O)<sub>2</sub> y opcionalmente sustituido con de 1 a 4 sustituyentes seleccionados de entre el grupo formado por alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>, halógeno, CN, NO<sub>2</sub> y alcoxilo C<sub>1</sub>-  
45 C<sub>2</sub>;

50 cada R<sup>4</sup> es de forma independiente H, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquino C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquino C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, halocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, halógeno, CN, NO<sub>2</sub>, hidroxilo, alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilsulfino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, dialquilamino C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>, cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, o trialquilsililo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>;

o

55 cada R<sup>4</sup> es de forma independiente fenilo, bencilo o fenoxilo, cada uno opcionalmente sustituido con alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alquino C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalqueno C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquino C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, halocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, halógeno, CN, NO<sub>2</sub>, alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, dialquilamino C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>, cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, (alquil)cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alquilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquilaminocarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, dialquilaminocarbonilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> o  
60 trialquilsililo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>;

65 cada R<sup>5</sup> es de forma independiente haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquino C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, halocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, CN, NO<sub>2</sub>, haloalcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, tioalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilsulfino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, dialquilamino C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>, o cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alquilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquilaminocarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, o dialquilaminocarbonilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>; o

(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub> cuando están unidos a átomos de carbono adyacentes se pueden tomar conjuntamente como -OCF<sub>2</sub>O-, -CF<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>O-, o -OCF<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>O-;

## ES 2 278 738 T3

cada R<sup>6</sup> es de forma independiente H, halógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o alcoxicarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>; o

5 cada R<sup>6</sup> es de forma independiente fenilo, bencilo, fenoxilo, anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros o un sistema heterobíclico fusionado de 8, 9 o 10 miembros aromático, cada anillo opcionalmente sustituido con de uno a tres sustituyentes seleccionados de forma independiente de entre el grupo formado por alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, halocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, halógeno, CN, NO<sub>2</sub>, alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfinilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, dialquilamino C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>, cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, (alquil)cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alquilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alcóxilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquilaminocarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, dialquilaminocarbonilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> y trialquilsililo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>;

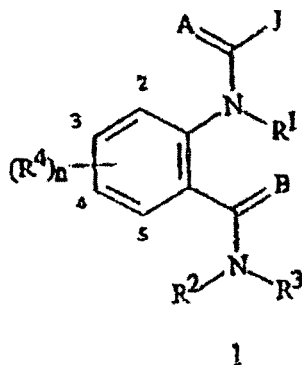
15 cada R<sup>7</sup> es de forma independiente H, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, halocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, halógeno, CN, CO<sub>2</sub>H, CONH<sub>2</sub>, NO<sub>2</sub>, hidroxilo, alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfinilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilsulfinilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, dialquilamino C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>, cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alquilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alcóxilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquilaminocarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, dialquilaminocarbonilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, trialquilsililo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>;

20 o cada R<sup>7</sup> es de forma independiente fenilo, bencilo, benzoilo, fenoxilo, anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros o un sistema heterobíclico fusionado de 8, 9 o 10 miembros aromático, cada anillo opcionalmente sustituido con de uno a tres sustituyentes seleccionados de forma independiente de entre el grupo formado por alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, halocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, halógeno, CN, NO<sub>2</sub>, alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfinilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, dialquilamino C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>, cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, (alquil)cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alquilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alcóxilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquilaminocarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, dialquilaminocarbonilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> o trialquilsililo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>;

mientras que

30 J es distinto de un 1, 2, 3-tiadiazol opcionalmente sustituido.

Esta invención también pertenece a compuestos de fórmula 1, sus N-óxidos y sales apropiadas para su uso en agricultura



50 donde

55 A y B son de forma independiente O o S; cada J es de forma independiente un grupo fenilo o naftilo sustituido con de 1 a 2 R<sup>5</sup> y opcionalmente sustituido con de 1 a 3 R<sup>6</sup>; o cada J es de forma independiente un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros o un sistema de anillos heterobíclicos fusionado de 8, 9 o 10 miembros aromático donde cada anillo o sistema de anillos está opcionalmente sustituido con de 1 a 4 R<sup>7</sup>;

n es de 1 a 4;

60 R<sup>1</sup> es H; o alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> o cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> cada uno opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de entre el grupo formado por halógeno, CN, NO<sub>2</sub>, hidroxilo, alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfinilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alcóxilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, dialquilamino C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> y cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>; o R<sup>1</sup> es alquilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alcóxilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquilaminocarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, dialquilaminocarbonilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> o C (=A) J;

65 R<sup>2</sup> es H, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, dialquilamino C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>, cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alcóxilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> o alquilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>;

## ES 2 278 738 T3

R<sup>3</sup> es H; alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, cada uno opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de entre el grupo formado por halógeno, CN, NO<sub>2</sub>, hidroxilo, alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfinilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alcóxilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, trialquilsililo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, o un anillo de fenoxilo opcionalmente sustituido con de uno a tres sustituyentes seleccionados de forma independiente de entre el grupo formado por alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, halocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, halógeno, CN, NO<sub>2</sub>, alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfinilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, dialquilamino C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>, cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, (alquil)cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alquilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alcóxilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquilaminocarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, dialquilaminocarbonilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> o trialquilsililo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>; alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>; alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>; dialquilamino C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>; cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>; alcóxicarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> o alquilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>; o

R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> se pueden tomar conjuntamente con el nitrógeno al cual están unidos para formar un anillo que contiene de 2 a 6 átomos de carbono y opcionalmente un átomo adicional de nitrógeno, azufre o oxígeno, dicho anillo puede estar opcionalmente sustituido con de 1 a 4 sustituyentes seleccionados de entre el grupo formado por alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>, halógeno, CN, NO<sub>2</sub> y alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>;

cada R<sup>4</sup> es de forma independiente H; alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, halocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, halógeno, CN, NO<sub>2</sub>, alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfinilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilsulfinilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, dialquilamino C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>, cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, o trialquilsililo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>;

cada R<sup>5</sup> es de forma independiente haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, halocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, haloalcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfinilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilsulfinilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, CN, NO<sub>2</sub>, alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, dialquilamino C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>, cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alquilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alcóxicarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquilaminocarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, o dialquilaminocarbonilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>; o

(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub> cuando están unidos a átomos de carbono adyacentes se pueden tomar conjuntamente como -OCF<sub>2</sub>O-, -CF<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>O-, o -OCF<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>O-;

cada R<sup>6</sup> es de forma independiente H, halógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o alcóxicarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>; o

cada R<sup>6</sup> es de forma independiente fenilo, bencilo, fenoxilo, anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros o un sistema heterobíciclico fusionado de 8, 9 o 10 miembros aromático, cada anillo opcionalmente sustituido con de uno a tres sustituyentes seleccionados de forma independiente de entre el grupo formado por alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, halocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, halógeno, CN, NO<sub>2</sub>, alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfinilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, dialquilamino C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>, cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, (alquil)cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alquilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alcóxilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquilaminocarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, dialquilaminocarbonilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> y trialquilsililo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>;

cada R<sup>7</sup> es de forma independiente H, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, halocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, halógeno, CN, CO<sub>2</sub>H, CONH<sub>2</sub>, NO<sub>2</sub>, hidroxilo, alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfinilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilsulfinilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, dialquilamino C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>, cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alquilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alcóxicarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquilaminocarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, dialquilaminocarbonilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, trialquilsililo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>; o

cada R<sup>7</sup> es de forma independiente fenilo, bencilo, benzoílo, fenoxilo, anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros o un sistema heterobíciclico fusionado de 8, 9 o 10 miembros aromático, cada anillo opcionalmente sustituido con de uno a tres sustituyentes seleccionados de forma independiente de entre el grupo formado por alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, halocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, halógeno, CN, NO<sub>2</sub>, alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfinilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, dialquilamino C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>, cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, (alquil)cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alquilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alcóxilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquilaminocarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, dialquilaminocarbonilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> o trialquilsililo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>;

mientras que

(i) al menos uno de los grupos R<sup>4</sup> y al menos uno de los grupos R<sup>7</sup> sean distintos de H;

(ii) J sea distinto de un 1,2,3-tiadiazol opcionalmente sustituido;

(iii) cuando J sea una piridina opcionalmente sustituida y R<sup>2</sup> sea A, R<sup>3</sup> es distinto de H o CH<sub>3</sub>;

(iv) cuando J es una piridina opcionalmente sustituida, entonces R<sup>7</sup> no puede ser CONH<sub>2</sub>, alquilaminocarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> o dialquilaminocarbonilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>;

(v) cuando J es un pirazol, tetrazol o pirimidina opcionalmente sustituidos, entonces R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> no pueden ser ambos hidrógeno.

Esta invención también trata sobre composiciones artropodocidas que contienen una cantidad de eficacia artropodocida de un compuesto de Fórmula 1 y al menos un componente adicional seleccionado de entre el grupo que consiste en surfactantes, diluyentes sólidos y diluyentes líquidos.

### Detalles de la invención

En las recitaciones anteriores, el término “alquilo”, utilizado sólo o en palabras compuestas como “alquiltio” o “haloalquilo” incluye alquilos de cadena lineal o ramificada, como, metilo, etilo, n-propilo, i-propilo, o los distintos isómeros de butilo, pentilo o hexilo. El término “1-2 alquilo” indica que una o dos de las posiciones disponibles para el sustituyente puede ser alquilo. “Alquenilo” también incluye alquenos de cadena lineal o ramificada como 1-propenilo, 2-propenilo, y los distintos isómeros de butenilo, pentenilo y hexenilo. “Alquenilo” también incluye polienos como 1,2-propadienilo y 2,4-hexadienilo. “Alquinilo” incluye alquinos de cadena lineal o ramificada como 1-propinilo, 2-propinilo y los distintos isómeros de butinilo, pentinilo y hexinilo. “Alquinilo” también incluye motivos compuestos de múltiples triples enlaces como 2,5-hexadiinilo. “Alcoxilo” incluye, por ejemplo, metoxilo, etoxilo, n-propiloxilo, isopropiloxilo y los distintos isómeros de butoxilo, pentoxilo y hexiloxilo. “Alcoxiloalquilo” denota una sustitución alcoxilo sobre el alquilo. Algunos ejemplos de “alcoxiloalquilo” incluyen CH<sub>3</sub>OCH<sub>2</sub>, CH<sub>3</sub>OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>, CH<sub>3</sub>CH<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>, CH<sub>3</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub> y CH<sub>3</sub>CH<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>. “Alquiltio” incluye motivos alquiltio de cadena lineal o ramificada como metiltio, etiltio, y los distintos isómeros de propiltio, butiltio, pentiltio y hexiltio. “Cicloalquilo” incluye, por ejemplo, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo y ciclohexilo.

El término “anillo heterocíclico” o “sistema de anillos heterocíclicos” denota anillos o sistemas de anillos en los cuales al menos un átomo de anillo no es carbono y comprende de 1 a 4 heteroátomos seleccionados de forma independiente de entre el grupo consistente en nitrógeno, oxígeno y azufre, mientras que cada anillo heterocíclico no contiene más de 4 nitrógenos, no más de 2 oxígenos y no más de 2 azufres. El anillo heterocíclico puede estar unido a través de cualquier carbono o nitrógeno disponible por reemplazamiento de hidrógeno sobre dicho carbono o nitrógeno. El término “sistema de anillos aromático” denota carbociclos y heterociclos totalmente insaturados en los cuales el sistema de anillos policíclicos es aromático (donde aromático indica que se cumple la regla de Hückel para el sistema de anillos). El término “anillo heteroaromático” denota anillos totalmente aromáticos en los cuales al menos un átomo del anillo no es carbono y comprende de 1 a 4 heteroátomos seleccionados de forma independiente de entre el grupo que consiste en nitrógeno, oxígeno y azufre, mientras que cada anillo heterocíclico no contiene más de 4 nitrógenos, no más de 2 oxígenos y no más de 2 azufres (donde aromático indica que se cumple la regla de Hückel). El anillo heterocíclico puede estar unido a través de cualquier carbono o nitrógeno disponible por reemplazamiento de hidrógeno sobre dicho carbono o nitrógeno. El término “sistema de anillos heterocíclico aromático” incluye heterociclos totalmente aromáticos y heterociclos en los cuales al menos un anillo del sistema de anillos policíclicos es aromático (donde aromático indica que se cumple la regla de Hückel). El término “sistema de anillos heterobicíclicos fusionados” incluye un sistema de anillos que compuesto de dos anillos fusionados en los cuales al menos un átomo del anillo no es carbono y puede ser aromático o no aromático, tal como se ha definido anteriormente.

El término “halógeno”, solo o bien en palabras compuestas como “haloalquilo”, incluye flúor, cloro, bromo o yodo. Además, cuando se utiliza en palabras compuestas como “haloalquilo”, dicho alquilo puede estar parcial o totalmente sustituido con átomos de halógeno que pueden ser iguales o distintos. Algunos ejemplos de “haloalquilo” incluyen F<sub>3</sub>C-, ClCH<sub>2</sub>-, CF<sub>3</sub>CH<sub>2</sub>- y CF<sub>3</sub>CCl<sub>2</sub>-. Los términos “haloalquenilo”, “haloalquinilo”, “haloalcoxilo” y similares, se definen de forma análoga al término “haloalquilo”. Algunos ejemplos de “haloalquinilo” incluyen HC=CCHCl-, CF<sub>3</sub>C=C-, CCl<sub>3</sub>C=C- y FCH<sub>2</sub>C=CCH<sub>2</sub>-. Algunos ejemplos de “haloalcoxilo” incluyen CF<sub>3</sub>O-, CCl<sub>3</sub>CH<sub>2</sub>O-, HCF<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>O- y CF<sub>3</sub>CH<sub>2</sub>O-.

El número total de átomos de carbono en un grupo sustituyente se indica con el sufijo “C<sub>i</sub>-C<sub>j</sub>” donde i y j son números de 1 a 6. Por ejemplo, alquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> designa desde metilsulfonilo hasta propilsulfonilo; alcoxilalquilo C<sub>2</sub> designa CH<sub>3</sub>OCH<sub>2</sub>; alcoxiloalquilo C<sub>3</sub> designa, por ejemplo, CH<sub>3</sub>CH(OCH<sub>3</sub>), CH<sub>3</sub>OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub> o CH<sub>3</sub>CH<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>; y alcoxiloalquilo C<sub>4</sub> designa los diversos isómeros de un grupo alquilo sustituido con un grupo alcoxilo que contiene un total de cuatro átomos de carbono, siendo algunos ejemplos CH<sub>3</sub>CH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub> y CH<sub>3</sub>CH<sub>2</sub>OCH<sub>2</sub>CH<sub>2</sub>. En las recitaciones anteriores, cuando un compuesto de Fórmula 1 contiene un anillo heterocíclico, todos los sustituyentes están unidos a este anillo a través de cualquier carbono o nitrógeno disponible por reemplazamiento de un hidrógeno sobre dicho carbono o nitrógeno.

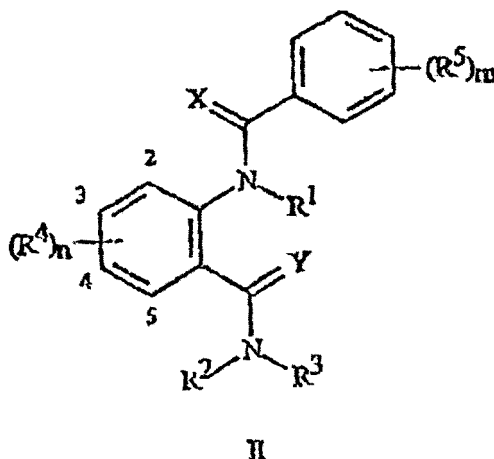
Cuando un grupo contiene un sustituyente que pueda ser hidrógeno, por ejemplo R<sup>3</sup>, entonces, cuando este sustituyente se toma como hidrógeno, se reconoce que ello equivale a que dicho grupo no esté sustituido.

Los compuestos de esta invención puede existir como uno o más estereoisómeros. Los diversos estereoisómeros incluyen enantiómeros, diastereoisómeros, atropoisómeros e isómeros geométricos. Cualquier persona con experiencia en el campo de la técnica apreciará que un estereoisómero puede ser más activo y/o puede mostrar efectos beneficiosos cuando se enriquece en relación a los otros estereoisómeros o cuando se separa de los otros estereoisómeros. Además, el técnico experimentado sabe como separar, enriquecer y/o preparar selectivamente dichos estereoisómeros. Así pues, los compuestos de la invención puede estar presentes como una mezcla de estereoisómeros, estereoisómeros individuales, o como una forma ópticamente activa.

La presente invención comprende compuestos seleccionados de Fórmula 1, N-óxidos y sus sales apropiadas para uso agrícola. Las personas con experiencia en el campo de la técnica apreciarán que no todos los heterociclos que contienen nitrógeno pueden formar N-óxidos ya que el nitrógeno necesita un par libre disponible para la oxidación al óxido; las personas con experiencia en el campo de la técnica reconocerá aquellos heterociclos que contienen nitrógeno que pueden formar N-óxidos. Las personas con experiencia en el campo de la técnica también sabrán que las aminas terciarias pueden formar N-óxidos. Los métodos sintéticos para la preparación de N-óxidos de heterociclos y aminas terciarias son bien conocidas por aquellas personas con experiencia en el campo de la técnica incluyendo la oxidación de heterociclos y aminas terciarias con peroxiacidos como ácido peracético y m-cloroperbenzoico (MCPBA), peróxido de hidrógeno, hidroperóxidos de alquilo como hidroperóxido de t-butilo, perborato de sodio, y dioxiranos como dimetildioxirano. Estos métodos para la preparación de N-óxidos han sido extensamente descritas y revisadas en la literatura, ver por ejemplo: T. L. Gilchrist en *Comprehensive Organic Synthesis*, vol. 7, pp 748-750, S. V. Ley, Ed., Pergamon Press; M. Tisler y B. Stanovnik en *Comprehensive Heterocyclic Chemistry*, vol. 3, pp 18-19, A. J. Boulton y A. McKillop, Eds., Pergamon Press; M. R. Grimmett y B. R. T. Keene en *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 43, pp 139-151, A. R. Katritzky, Ed., Academic Press; M. Tisler y B. Stanovnik en *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 9, pp 285-291, A. R. Katritzky y A. J. Boulton, Eds., Academic Press; y G. W. H. Cheeseman y E. S. G. Werstiuk en *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 22, pp 390-392, A. R. Katritzky y A. J. Boulton, Eds., Academic Press.

Las sales de los compuestos de la invención incluyen sales de adición ácida con ácidos orgánicos o inorgánicos como ácido bromhídrico, clorhídrico, nítrico, fosfórico, sulfúrico, acético, butírico, fumárico, láctico, maleico, malónico, oxálico, propiónico, salicílico, tartárico, 4-toluenosulfónico o valérico.

Son notables ciertos compuestos de Fórmula II



II

donde

X e Y son O;

m es de 1 a 5;

n es de 1 a 4;

R<sup>1</sup> es H; o alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> o cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> cada uno opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de entre el grupo formado por halógeno, CN, NO<sub>2</sub>, hidroxilo, alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, dialquilamino C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> y cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>; o

R<sup>1</sup> es alquilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquilaminocarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, dialquilaminocarbonilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>

R<sup>2</sup> es H, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, dialquilamino C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>, cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> o alquilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>;

R<sup>3</sup> es i-propilo o t-butilo; y

cada R<sup>4</sup> y R<sup>5</sup> es de forma independiente H, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, halocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, halógeno, CN, NO<sub>2</sub>, hidroxilo, alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilsulfino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, dialquilamino C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>, cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alquilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, dialquilaminocarbonilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, dialquilsililo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>;

o

5 cada R<sup>4</sup> y R<sup>5</sup> es de forma independiente fenilo opcionalmente sustituido con alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alquino C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalqueno C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquino C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, halocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, halógeno, CN, NO<sub>2</sub>, alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfinilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, dialquilamino C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>, cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, (alquil)cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alquilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquilaminocarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, dialquilaminocarbonilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> o trialquilsililo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>;

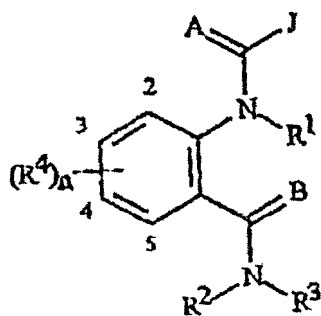
10 También son notables los métodos para el control de artrópodos que comprenden la puesta en contacto de los artrópodos o de su entorno con una cantidad con eficacia artropodocida de un compuesto de Fórmula II y composiciones insecticidas fabricadas a partir de estos compuestos.

También son notables ciertos compuestos de Fórmula III

15

20

25



III

30

donde

A y B son de forma independiente O o S;

35

J es un grupo fenilo sustituido con de 1 a 2 R<sup>5</sup> y sustituido de forma opcional con de 1 a 3 R<sup>6</sup>, o un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros opcionalmente sustituido con de 1 a 4 R<sup>7</sup>;

n es de 1 a 4;

40

R<sup>1</sup> es H; o alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquino C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> o cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> cada uno opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de entre el grupo formado por halógeno, CN, NO<sub>2</sub>, hidroxilo, alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfinilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, dialquilamino C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> y cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>; o

45

R<sup>1</sup> es alquilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquilaminocarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, dialquilaminocarbonilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>

R<sup>2</sup> es H, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquino C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, dialquilamino C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>, cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> o alquilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>;

50

R<sup>3</sup> es H; o alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquino C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> o cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> cada uno opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de entre el grupo formado por halógeno, CN, NO<sub>2</sub>, hidroxilo, alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfinilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> y alquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>; o

55

R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> se pueden tomar conjuntamente con el nitrógeno al cual están unidos para formar un anillo que contiene de 2 a 6 átomos de carbono y opcionalmente un átomo adicional de nitrógeno, azufre o oxígeno, dicho anillo puede estar opcionalmente sustituido con de 1 a 4 sustituyentes seleccionados de entre el grupo formado por alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>, halógeno, CN, NO<sub>2</sub> y alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>;

60

65 cada R<sup>4</sup> es de forma independiente H, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquino C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquino C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, halocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, halógeno, CN, CO<sub>2</sub>H, CONH<sub>2</sub>, NO<sub>2</sub>, hidroxilo, alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfinilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilsulfinilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, dialquilamino C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>, cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alquilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, dialquilaminocarbonilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, trialquilsililo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>;

o



## ES 2 278 738 T3

cada R<sup>4</sup> es de forma independiente fenilo, bencilo, benzofilo, fenoxilo, cada uno opcionalmente sustituido con alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, halocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, halógeno, CN, NO<sub>2</sub>, alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfinilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, dialquilamino C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>, cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, (alquil)cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alquilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquilaminocarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, dialquilaminocarbonilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> o trialquilsililo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>;

cada R<sup>5</sup> es de forma independiente haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, halocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, haloalcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfinilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilsulfinilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, CN, NO<sub>2</sub>, alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, dialquilamino C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>, cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alquilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquilaminocarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, o dialquilaminocarbonilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>; o

(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub> cuando están unidos a átomos de carbono adyacentes se pueden tomar conjuntamente como -OCF<sub>2</sub>O-, -CF<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>O-, o -OCF<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>O-;

cada R<sup>6</sup> es de forma independiente H, halógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o alcoxilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>; o

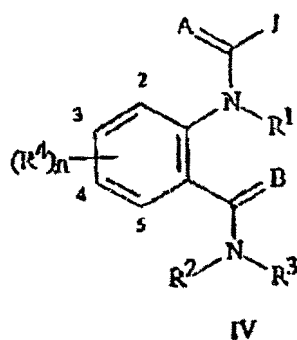
cada R<sup>6</sup> es de forma independiente fenilo, bencilo, fenoxilo, cada uno opcionalmente sustituido alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, halocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, halógeno, CN, NO<sub>2</sub>, alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfinilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, dialquilamino C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>, cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, (alquil)cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alquilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquilaminocarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, dialquilaminocarbonilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> y trialquilsililo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>;

cada R<sup>7</sup> es de forma independiente H, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, halocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, halógeno, CN, CO<sub>2</sub>H, CONH<sub>2</sub>, NO<sub>2</sub>, hidroxilo, alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfinilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilsulfinilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, dialquilamino C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>, cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alquilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquilaminocarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, dialquilaminocarbonilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, trialquilsililo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>; o

cada R<sup>7</sup> es de forma independiente fenilo, bencilo, benzofilo o fenoxilo, cada uno opcionalmente sustituido con alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, halocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, halógeno, CN, NO<sub>2</sub>, alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfinilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, dialquilamino C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>, cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, (alquil)cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alquilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquilaminocarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, dialquilaminocarbonilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> o trialquilsililo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>;

También son notables los métodos para el control de artrópodos que comprenden la puesta en contacto de los artrópodos o de su entorno con una cantidad de eficacia artropodocida de un compuesto de Fórmula III y los insecticidas fabricados a partir de estos compuestos.

También son notables ciertos compuestos de Fórmula IV



donde

A y B son de forma independiente O o S;

J es un grupo fenilo sustituido con de 1 a 2 R<sup>5</sup> y sustituido de forma opcional con de 1 a 3 R<sup>6</sup>, o un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros opcionalmente sustituido con de 1 a 4 R<sup>7</sup>;

n es de 1 a 4;

## ES 2 278 738 T3

R<sup>1</sup> es H; o alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquino C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> o cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> cada uno opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de entre el grupo formado por halógeno, CN, NO<sub>2</sub>, hidroxilo, alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfinilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, dialquilamino C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> y cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>; o

R<sup>1</sup> es alquilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alcocicarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquilaminocarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, dialquilaminocarbonilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>

R<sup>2</sup> es H, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquino C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, dialquilamino C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>, cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> o alquilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>;

R<sup>3</sup> es H; o alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquino C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> o cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> cada uno opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de entre el grupo formado por halógeno, CN, NO<sub>2</sub>, hidroxilo, alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfinilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> y alquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>; alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>; alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>; dialquilamino C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>; cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>; alcocicarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> o alquilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>; o

R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> se pueden tomar conjuntamente con el nitrógeno al cual están unidos para formar un anillo que contiene de 2 a 6 átomos de carbono y opcionalmente un átomo adicional de nitrógeno, azufre o oxígeno, dicho anillo puede estar opcionalmente sustituido con de 1 a 4 sustituyentes seleccionados de entre el grupo formado por alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>, halógeno, CN, NO<sub>2</sub> y alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>;

cada R<sup>4</sup> es de forma independiente H, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquino C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquino C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, halocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, halógeno, CN, CO<sub>2</sub>H, CONH<sub>2</sub>, NO<sub>2</sub>, hidroxilo, alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfinilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilsulfinilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, dialquilamino C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>, cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alquilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alcocicarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, dialquilaminocarbonilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, trialquilsililo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>;

o

cada R<sup>4</sup> es de forma independiente fenilo, bencilo o fenoxilo, cada uno opcionalmente sustituido con alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alquino C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalqueno C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquino C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, halocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, halógeno, CN, NO<sub>2</sub>, alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfinilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, dialquilamino C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>, cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, (alquil)cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alquilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquilaminocarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, dialquilaminocarbonilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> o trialquilsililo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>;

cada R<sup>5</sup> es de forma independiente alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquino C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquino C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, halocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, halógeno, CN, CO<sub>2</sub>NH<sub>2</sub>, NO<sub>2</sub>, hidroxilo, alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilsulfinilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, dialquilamino C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>, cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alquilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alcocicarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquilaminocarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, dialquilaminocarbonilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, o trialquilsililo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>; o

(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub> cuando están unidos a átomos de carbono adyacentes se pueden tomar conjuntamente como -OCF<sub>2</sub>O-, -CF<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>O-, o -OCF<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>O-;

cada R<sup>6</sup> es de forma independiente H, halógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquino C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> o alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>; o

cada R<sup>6</sup> es de forma independiente fenilo, bencilo, fenoxilo, anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, cada anillo opcionalmente sustituido con alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alquino C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalqueno C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquino C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, halocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, halógeno, CN, NO<sub>2</sub>, alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfinilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, dialquilamino C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>, cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, (alquil)cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alquilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquilaminocarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, dialquilaminocarbonilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> y trialquilsililo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>;

cada R<sup>7</sup> es de forma independiente H, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquino C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquino C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, halocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, halógeno, CN, CO<sub>2</sub>H, CONH<sub>2</sub>, NO<sub>2</sub>, hidroxilo, alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfinilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilsulfinilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, dialquilamino C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>, cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alquilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alcocicarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquilaminocarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, dialquilaminocarbonilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, trialquilsililo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>; o

cada R<sup>7</sup> es de forma independiente fenilo, bencilo, benzoilo, fenoxilo, anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, cada anillo opcionalmente sustituido con alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alquino C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalqueno C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquino C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, halocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, halógeno, CN, NO<sub>2</sub>, alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfinilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, dialquilamino C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>, cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, (alquil)cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alquilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquilaminocarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, dialquilaminocarbonilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> o trialquilsililo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>;

## ES 2 278 738 T3

mientras que cuando A y B sean ambos O, R<sup>2</sup> sea H o alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub>, R<sup>3</sup> sea H o alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>3</sub> y R<sup>4</sup> sea H, halógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, fenilo, hidroxilo o alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, entonces un R<sup>5</sup> es distinto de halógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, hidroxilo o alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>.

5 También son notables los métodos para el control de artrópodos que comprenden la puesta en contacto de los artrópodos o su entorno con una cantidad de eficacia artropodocida de un compuesto de Fórmula IV y las composiciones insecticidas fabricadas a partir de estos compuestos.

Los métodos preferidos respecto a una mejor actividad son:

10

Preferido 1

Los métodos que comprenden compuestos de Fórmula 1 donde J es un grupo fenilo sustituido con de 1 a 2 R<sup>5</sup> y opcionalmente sustituido con de 1 a 3 R<sup>6</sup>.

15

Preferido 2

Los métodos de Preferido 1 donde

20

A y B son ambos O;

n es de 1 a 2;

25

R<sup>1</sup> es H; o alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alquino C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alquilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> o alcoxilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>;

R<sup>2</sup> es H, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alquino C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alquilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> o alcoxicarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>;

30

R<sup>3</sup> es alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquino C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> o cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, cada uno opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de entre el grupo formado por halógeno, CN, alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>, alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>, alquilsulfinilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> y alquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>;

35

uno de los grupos R<sup>4</sup> está unido al anillo fenilo en la posición 2 o en la posición 5, y dicho R<sup>4</sup> es alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, halógeno, CN, NO<sub>2</sub>, alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfinilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilsulfinilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, o haloalquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>;

40

cada R<sup>5</sup> es de forma independiente haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, CN, NO<sub>2</sub>, haloalcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfinilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilsulfinilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o alcoxicarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>; o

(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub> cuando están unidos a átomos de carbono adyacentes se pueden tomar conjuntamente como -OCF<sub>2</sub>O-, -CF<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>O-, o -OCF<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>O-;

45

cada R<sup>6</sup> es de forma independiente H, halógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> o alcoxicarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>; o

cada R<sup>6</sup> es de forma independiente fenilo o un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, cada anillo opcionalmente sustituido con alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alquino C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalqueno C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquino C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, halocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, halógeno, CN, NO<sub>2</sub>, alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfinilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, dialquilamino C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>, cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, (alquil)cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alquilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquilaminocarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, dialquilaminocarbonilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> y trialquilsililo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>;

55

Preferido 3

Los métodos de Preferido 2 donde

60

R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> son ambos H;

R<sup>3</sup> es alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, opcionalmente sustituido con halógeno, CN, OCH<sub>3</sub>, o S(O)pCH<sub>3</sub>;

cada R<sup>4</sup> es de forma independiente H, CH<sub>3</sub>, CF<sub>3</sub>, OCF<sub>3</sub>, OCHF<sub>2</sub>, S(O)pCF<sub>3</sub>, S(O)pCHF<sub>2</sub>, CN o halógeno;

65

cada R<sup>5</sup> es de forma independiente CF<sub>3</sub>, OCF<sub>3</sub>, OCHF<sub>2</sub>, S(O)pCF<sub>3</sub>, S(O)pCHF<sub>2</sub>, OCH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, OCF<sub>2</sub>CHF<sub>2</sub>, S(O)pCH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub> o S(O)pCF<sub>2</sub>CHF<sub>2</sub>;

## ES 2 278 738 T3

cada  $R^6$  es de forma independiente H, halógeno o metilo; o fenilo, pirazol, imidazol, triazol, piridina o pirimidina, estando cada anillo sustituido opcionalmente con alquilo  $C_1-C_4$ , haloalquilo  $C_1-C_4$ , halógeno o CN; y

p es 0, 1 o 2.

5

Preferido 4

Los métodos de Preferido 3 donde  $R^3$  es i-propilo o t-butilo.

10

Preferido 5

Los métodos que comprenden los compuestos de Fórmula I donde J es un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros sustituido opcionalmente con de 1 a 4  $R^7$ .

15

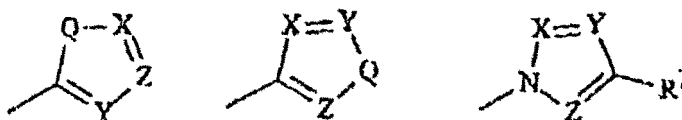
Preferido 6

Los métodos de Preferido 5 donde

20

J es un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros seleccionado de entre el grupo consistente en J-1, J-2, J-3, J-4 y J-5, estando cada J opcionalmente sustituido con de 1 a 3  $R^7$

25



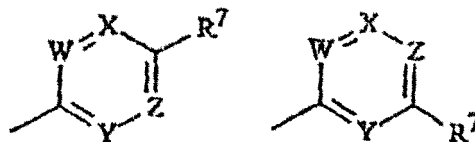
30

J-1

J-2

J-3

35



40

J-4

J-5

;

45

Q es O, S o  $NR^7$ ; y

W, X, Y y Z son de forma independiente N o  $CR^7$ , mientras que en J-4 y J-5 al menos uno de entre W, X, Y y Z sea N.

50

Preferido 7

Los métodos de Preferido 5 o Preferido 6 donde

55

A y B son O;

n es de 1 a 2;

60

$R^1$  es H; o alquilo  $C_1-C_4$ , alquenilo  $C_2-C_4$ , alquinilo  $C_2-C_4$ , alquilcarbonilo  $C_2-C_6$  o alcoxicarbonilo  $C_2-C_6$ ;

$R^2$  es H, alquilo  $C_1-C_4$ , alquenilo  $C_2-C_4$ , alquinilo  $C_2-C_4$ , cicloalquilo  $C_3-C_6$ , alquilcarbonilo  $C_2-C_6$  o alcoxicarbonilo  $C_2-C_6$ ;

65

$R^3$  es alquilo  $C_1-C_6$ , alquenilo  $C_2-C_6$ , alquinilo  $C_2-C_6$  o cicloalquilo  $C_3-C_6$ , cada uno opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de entre el grupo formado por halógeno, CN, alcoxilo  $C_1-C_2$ , alquiltio  $C_1-C_2$ , alquilsulfino  $C_1-C_2$  y alquilsulfonilo  $C_1-C_2$ ;

## ES 2 278 738 T3

uno de los grupos  $R^4$  está unido al anillo fenilo en la posición 2, y dicho  $R^4$  es alquilo  $C_1-C_4$ , haloalquilo  $C_1-C_4$ , halógeno, CN,  $NO_2$ , alcoxilo  $C_1-C_4$ , haloalcoxilo  $C_1-C_4$ , alquiltio  $C_1-C_4$ , alquilsulfinilo  $C_1-C_4$ , alquilsulfonilo  $C_1-C_4$ , haloalquiltio  $C_1-C_4$ , haloalquilsulfinilo  $C_1-C_4$ , o haloalquilsulfonilo  $C_1-C_4$ ; y

5 cada  $R^7$  es de forma independiente H, alquilo  $C_1-C_4$ , haloalquilo  $C_1-C_4$ , halógeno, CN,  $NO_2$ , alcoxilo  $C_1-C_4$ , haloalcoxilo  $C_1-C_4$ , alquiltio  $C_1-C_4$ , alquilsulfinilo  $C_1-C_4$ , alquilsulfonilo  $C_1-C_4$ , haloalquiltio  $C_1-C_4$ , haloalquilsulfinilo  $C_1-C_4$ , haloalquilsulfonilo  $C_1-C_4$  o alcocarbonilo  $C_2-C_4$ ; o un fenilo o un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, cada anillo opcionalmente sustituido con alquilo  $C_1-C_4$ , alquenilo  $C_2-C_4$ , alquinilo  $C_2-C_4$ , cicloalquilo  $C_3-C_6$ , haloalquilo  $C_1-C_4$ , haloalquenilo  $C_2-C_4$ , haloalquinilo  $C_2-C_4$ , halocicloalquilo  $C_3-C_6$ , halógeno, CN,  $NO_2$ , alcoxilo  $C_1-C_4$ , haloalcoxilo  $C_1-C_4$ , alquiltio  $C_1-C_4$ , alquilsulfinilo  $C_1-C_4$ , alquilsulfonilo  $C_1-C_4$ , alquilamino  $C_1-C_4$ , dialquilamino  $C_2-C_8$ , cicloalquilamino  $C_3-C_6$ , (alquil)cicloalquilamino  $C_3-C_6$ , alquilcarbonilo  $C_2-C_4$ , alcocarbonilo  $C_2-C_6$ , alquilaminocarbonilo  $C_2-C_6$ , dialquilaminocarbonilo  $C_3-C_8$  y trialquilsililo  $C_3-C_6$ ;

15 Preferido 8

Los métodos de Preferido 7 donde

J se selecciona de entre el grupo consistente en piridina, pirimidina, pirazol, imidazol, triazol, tiofeno, tiazol y oxazol, furano, isotiazol e isoxazol, cada uno opcionalmente sustituido con de 1 a 3  $R^7$ ;

Preferido 9

25 Los métodos de Preferido 8 donde

J se selecciona de entre el grupo consistente en piridina, pirimidina, pirazol, tiofeno y tiazol, cada uno opcionalmente sustituido con de 1 a 3  $R^7$ ;

30  $R^1$  y  $R^2$  son ambos H;

$R^3$  es alquilo  $C_1-C_4$  opcionalmente sustituido con halógeno, CN,  $OCH_3$ , o  $S(O)pCH_3$ ;

35 cada  $R^4$  es de forma independiente H,  $CH_3$ ,  $CF_3$ ,  $OCF_3$ ,  $OCHF_2$ ,  $S(O)pCF_3$ ,  $S(O)pCHF_2$ , CN o halógeno;

cada  $R^7$  es de forma independiente H, halógeno,  $CH_3$ ,  $CF_3$ ,  $OCF_3$ ,  $OCHF_2$ ,  $S(O)pCF_3$ ,  $S(O)pCHF_2$ ,  $OCH_2CF_3$ ,  $OCF_2CHF_2$ ,  $S(O)pCH_2CF_3$  o  $S(O)pCF_2CHF_2$ ; o fenilo, pirazol, imidazol, triazol, piridina o pirimidina, estando cada anillo sustituido opcionalmente con alquilo  $C_1-C_4$ , haloalquilo  $C_1-C_4$ , alcoxilo  $C_1-C_4$ , haloalcoxilo  $C_1-C_4$ , alquiltio  $C_1-C_4$ , alquilsulfinilo  $C_1-C_4$ , alquilsulfonilo  $C_1-C_4$ , halógeno o CN; y

40 p es 0, 1 o 2.

Preferido 10

45 Los métodos de Preferido 9 donde J es una piridina opcionalmente sustituida con de 1 a 3  $R^7$ .

Preferido 11

50 Los métodos de Preferido 10 donde un  $R^7$  es un fenilo opcionalmente sustituido con alquilo  $C_1-C_4$ , haloalquilo  $C_1-C_4$ , halógeno o CN.

55 Preferido 12

Los métodos de Preferido 10 donde un  $R^7$  es pirazol, imidazol, triazol, piridina o pirimidina, estando cada anillo sustituido con alquilo  $C_1-C_4$ , haloalquilo  $C_1-C_4$ , halógeno o CN.

60 Preferido 13

Los métodos de Preferido 9 donde J es una pirimidina opcionalmente sustituida con de 1 a 3  $R^7$ .

65

## ES 2 278 738 T3

### Preferido 14

Los métodos de Preferido 13 donde un R<sup>7</sup> es un fenilo opcionalmente sustituido con alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, halógeno o CN.

### Preferido 15

Los métodos de Preferido 13 donde un R<sup>7</sup> es pirazol, imidazol, triazol, piridina o pirimidina, estando cada anillo sustituido con alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, halógeno o CN.

### Preferido 16

Los métodos de Preferido 9 donde J es un pirazol opcionalmente sustituida con de 1 a 3 R<sup>7</sup>.

### Preferido 17

Los métodos de Preferido 16 donde un R<sup>7</sup> es un fenilo opcionalmente sustituido con alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, halógeno o CN.

### Preferido 18

Los métodos de Preferido 16 donde un R<sup>7</sup> es pirazol, imidazol, triazol, piridina o pirimidina, estando cada anillo sustituido con alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, halógeno o CN.

### Preferido 19

Los métodos de Preferido 18 R<sup>7</sup> es una piridina opcionalmente sustituida con alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, halógeno o CN.

El método más preferido comprende un compuesto de Fórmula I seleccionado de entre el grupo consistente en:

3-metil-N-(1-metiletil)-2-[[4-(trifluorometil)benzof]amino]-benzamida,

2-metil-N-(2-metil-6-[[1-metiletil]amino]carbonil]fenil)-4-(trifluorometil)benzamida,

2-metil-N-[2-metil-6-[[1-metiletil]amino]carbonil]fenil]-6-(trifluorometil)-3-piridincarboximida,

1-etil-N-[2-metil-6-[[1-metiletil]amino]carbonil]fenil]-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-carboximida,

1-(2-fluorofenil)-N-[2-metil-6-[[1-metiletil]amino]carbonil]fenil]-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-carboximida,

1-(3-cloro-2-piridinil)-N-[2-metil-6-[[1-metiletil]amino]carbonil]fenil]-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-carboximida,

N-[2-cloro-6-[[1-metiletil]amino]carbonil]fenil]-3-(trifluorometil)-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-carboximida,

3-bromo-1-(2-clorofenil)-N-[2-metil-6-[[1-metiletil]amino]carbonil]fenil]-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-carboximida, y

3-bromo-N-[2-cloro-6-[[1-metiletil]amino]carbonil]fenil]-1-(2-clorofenil)-1H-pirazol-5-carboximida.

Los compuestos preferidos en cuanto a mejor actividad y/o facilidad de síntesis son:

### Preferido A

Compuestos de Fórmula I donde J es un grupo fenilo sustituido con de 1 a 2 R<sup>5</sup> y opcionalmente sustituido con de 1 a 3 R<sup>6</sup>.

## ES 2 278 738 T3

### Preferido B

Los métodos de Preferido A donde

5 A y B son ambos O;

n es de 1 a 2;

10 R<sup>1</sup> es H; o alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alquino C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alquilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> o alcoxilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>;

R<sup>2</sup> es H, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alquino C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alquilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> o alcoxilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>;

15 R<sup>3</sup> es alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquino C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> o cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, cada uno opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de entre el grupo formado por halógeno, CN, alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>, alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>, alquilsulfinilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> y alquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>;

20 uno de los grupos R<sup>4</sup> está unido al anillo fenilo en la posición 2 o en la posición 5, y dicho R<sup>4</sup> es alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, halógeno, CN, NO<sub>2</sub>, alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfinilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilsulfinilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, o haloalquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>;

25 cada R<sup>5</sup> es de forma independiente haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, CN, NO<sub>2</sub>, haloalcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfinilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilsulfinilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o alcoxilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>; o

(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub> cuando están unidos a átomos de carbono adyacentes se pueden tomar conjuntamente como -OCF<sub>2</sub>O-, -CF<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>O-, o -OCF<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>O-;

30 cada R<sup>6</sup> es de forma independiente H, halógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> o alcoxilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>; o

35 cada R<sup>6</sup> es de forma independiente fenilo o un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, cada anillo opcionalmente sustituido con alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alquino C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalqueno C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquino C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, halocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, halógeno, CN, NO<sub>2</sub>, alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfinilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, dialquilamino C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>, cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, (alquil)cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alquilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquilaminocarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, dialquilaminocarbonilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> y trialquilsililo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>;

### Preferido C

40 Los métodos de Preferido B donde

R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> son ambos H;

45 R<sup>3</sup> es alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, opcionalmente sustituido con halógeno, CN, OCH<sub>3</sub>, S(O)<sub>p</sub>CHF<sub>3</sub>;

cada R<sup>4</sup> es de forma independiente H, CH<sub>3</sub>, CF<sub>3</sub>, OCF<sub>3</sub>, OCHF<sub>2</sub>, S(O)<sub>p</sub>CF<sub>3</sub>, S(O)<sub>p</sub>CHF<sub>2</sub>, CN o halógeno;

50 cada R<sup>5</sup> es de forma independiente CF<sub>3</sub>, OCF<sub>3</sub>, OCHF<sub>2</sub>, S(O)<sub>p</sub>CF<sub>3</sub>, S(O)<sub>p</sub>CHF<sub>2</sub>, OCH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, OCF<sub>2</sub>CHF<sub>2</sub>, S(O)<sub>p</sub>CH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub> o S(O)<sub>p</sub>CF<sub>2</sub>CHF<sub>2</sub>;

cada R<sup>6</sup> es de forma independiente H, halógeno o metilo; o fenilo, pirazol, imidazol, triazol, piridina o pirimidina, estando cada anillo sustituido opcionalmente con alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, halógeno o CN; y

55 p es 0, 1 o 2.

### Preferido D

60 Los compuestos de Preferido C donde R<sup>3</sup> es i-propilo o t-butilo.

### Preferido E

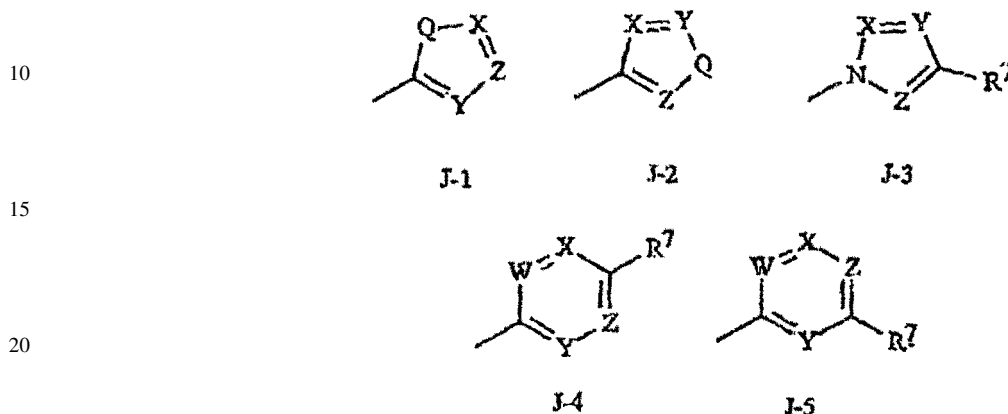
65 Los compuestos de Fórmula I donde J es un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros sustituido opcionalmente con de 1 a 4 R<sup>7</sup>.

## ES 2 278 738 T3

### Preferido F

Los compuestos de Preferido E donde

J es un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros seleccionado de entre el grupo consistente en J-1, J-2, J-3, J-4 y J-5, estando cada J opcionalmente sustituido con de 1 a 3 R<sup>7</sup>



Q es O, S o NR<sup>7</sup>; y

W, X, Y y Z son de forma independiente N o CR<sup>7</sup>, mientras que en J-4 y J-5 al menos uno de entre W, X, Y y Z sea N.

### 30 Preferido G

Los compuestos de Preferido E o Preferido F donde

A y B son O;

n es de 1 a 2;

R<sup>1</sup> es H; o alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alquino C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alquilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> o alcoxicarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>;

R<sup>2</sup> es H, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alquino C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alquilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> o alcoxicarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>;

R<sup>3</sup> es alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquino C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> o cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, cada uno opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de entre el grupo formado por halógeno, CN, alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>, alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>, alquilsulfino C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> y alquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>;

uno de los grupos R<sup>4</sup> está unido al anillo fenilo en la posición 2, y dicho R<sup>4</sup> es alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, halógeno, CN, NO<sub>2</sub>, alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilsulfino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, o haloalquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>; y

cada R<sup>7</sup> es de forma independiente H, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, halógeno, CN, NO<sub>2</sub>, alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilsulfino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o alcoxicarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>; o un fenilo o un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, cada anillo opcionalmente sustituido con alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alquino C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalqueno C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquino C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, halocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, halógeno, CN, NO<sub>2</sub>, alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, dialquilamino C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>, cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, (alquil)cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alquilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxicarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquilaminocarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, dialquilaminocarbonilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> y trialquilsililo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>;

### 60 Preferido H

Los compuestos de Preferido G donde

J se selecciona de entre el grupo consistente en piridina, pirimidina, pirazol, imidazol, triazol, tiofeno, tiazol y oxazol, furano, isotiazol e isoxazol, cada uno opcionalmente sustituido con de 1 a 3 R<sup>7</sup>;



## ES 2 278 738 T3

### Preferido I

Los compuestos de Preferido H donde

5 J se selecciona de entre el grupo consistente en piridina, pirimidina, pirazol, tiofeno y tiazol, cada uno opcionalmente sustituido con de 1 a 3 R<sup>7</sup>;

R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> son ambos H;

10 R<sup>3</sup> es alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> opcionalmente sustituido con halógeno, CN, OCH<sub>3</sub>, o S(O)pCH<sub>3</sub>;

cada R<sup>4</sup> es de forma independiente H, CH<sub>3</sub>, CF<sub>3</sub>, OCF<sub>3</sub>, OCHF<sub>2</sub>, S(O)pCF<sub>3</sub>, S(O)pCHF<sub>2</sub>, CN o halógeno;

15 cada R<sup>7</sup> es de forma independiente H, halógeno, CH<sub>3</sub>, CF<sub>3</sub>, OCF<sub>3</sub>, OCHF<sub>2</sub>, S(O)pCF<sub>3</sub>, S(O)pCHF<sub>2</sub>, OCH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, OCF<sub>2</sub>CHF<sub>2</sub>, S(O)pCH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub> o S(O)pCF<sub>2</sub>CHF<sub>2</sub>; o fenilo, pirazol, imidazol, triazol, piridina o pirimidina, estando cada anillo sustituido opcionalmente con alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalxoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfínilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, halógeno o CN; y

p es 0, 1 o 2.

20

### Preferido J

Los métodos de Preferido I donde J es una piridina opcionalmente sustituida con de 1 a 3 R<sup>7</sup>.

25 Preferido K

Los compuestos de Preferido J donde un R<sup>7</sup> es un fenilo opcionalmente sustituido con alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, halógeno o CN.

30 Preferido L

Los compuestos de Preferido J donde un R<sup>7</sup> es pirazol, imidazol, triazol, piridina o pirimidina, estando cada anillo sustituido con alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, halógeno o CN.

35 Preferido M

Los compuestos de Preferido I donde J es una pirimidina opcionalmente sustituida con de 1 a 3 R<sup>7</sup>.

### Preferido N

40

Los compuestos de Preferido M donde un R<sup>7</sup> es un fenilo opcionalmente sustituido con alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, halógeno o CN.

### Preferido O

45

Los compuestos de Preferido M donde un R<sup>7</sup> es pirazol, imidazol, triazol, piridina o pirimidina, estando cada anillo sustituido con alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, halógeno o CN.

### Preferido P

50

Los compuestos de Preferido I donde J es un pirazol opcionalmente sustituida con de 1 a 3 R<sup>7</sup>.

### Preferido Q

55

Los compuestos de Preferido P donde un R<sup>7</sup> es un fenilo opcionalmente sustituido con alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, halógeno o CN.

### Preferido R

60

Los compuestos de Preferido P donde un R<sup>7</sup> es pirazol, imidazol, triazol, piridina o pirimidina, estando cada anillo sustituido con alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, halógeno o CN.

### Preferido S

65

Los compuestos de Preferido R donde R<sup>7</sup> es una piridina opcionalmente sustituida con alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, halógeno o CN.

## ES 2 278 738 T3

Los compuestos más preferidos son los de Fórmula I seleccionados de entre el grupo consistente en:

3-metil-N-(1-metiletil)-2-[[4-(trifluorometil)benzoil]amino]-benzamida,

2-metil-N-(2-metil-6-[[1-metiletil]amino]carbonil]fenil)-4-(trifluorometil)benzamida,

2-metil-N-[2-metil-6-[[1-metiletil]amino]carbonil]fenil]-6-(trifluorometil)-3-piridincarboximida,

1-etil-N-[2-metil-6-[[1-metiletil]amino]carbonil]fenil]-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-carboximida,

1-(2-fluorofenil)-N-[2-metil-6-[[1-metiletil]amino]carbonil]fenil]-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-carboximida,

1-(3-cloro-2-piridinil)-N-[2-metil-6-[[1-metiletil]amino]carbonil]fenil]-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-carboximida,

N-[2-cloro-6-[[1-metiletil]amino]carbonil]fenil]-3-(trifluorometil)-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-carboximida,

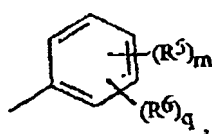
3-bromo-1-(2-clorofenil)-N-[2-metil-6-[[1-metiletil]amino]carbonil]fenil]-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-carboximida, y

3-bromo-N-[2-cloro-6-[[1-metiletil]amino]carbonil]fenil]-1-(2-clorofenil)-1H-pirazol-5-carboximida.

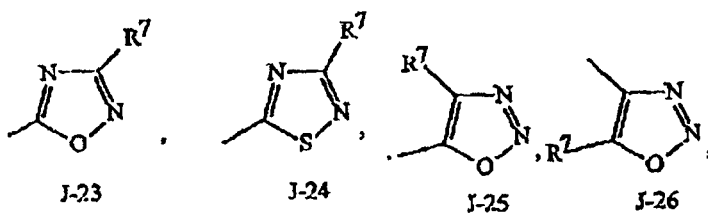
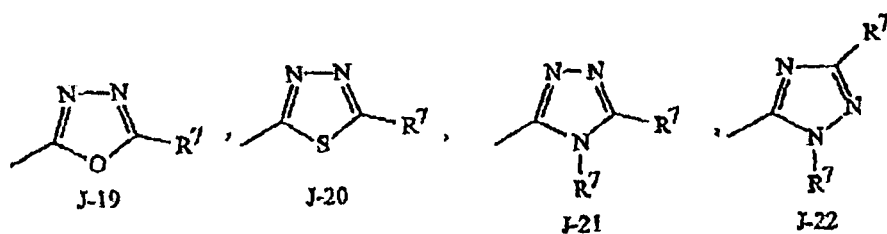
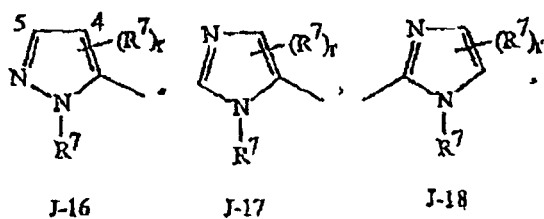
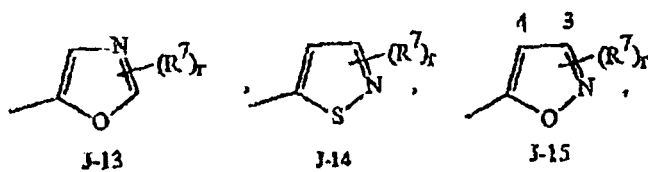
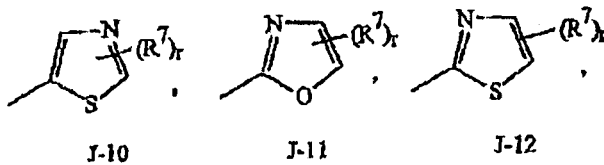
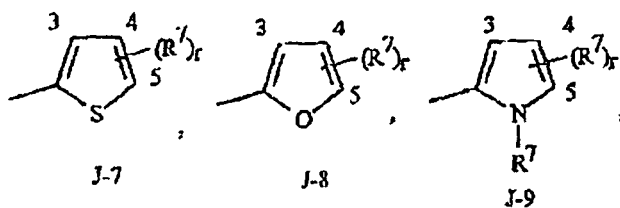
Las composiciones preferidas son aquellas que comprenden compuestos de fórmula I como los preferidos en Preferido 1 a Preferido 19, y los compuestos específicamente preferidos mostrados anteriormente.

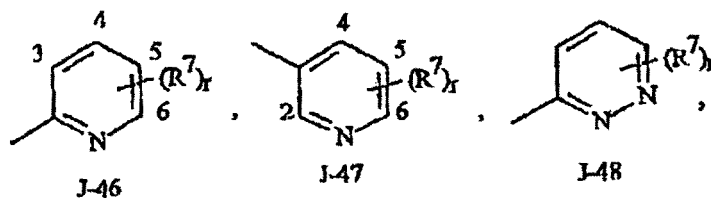
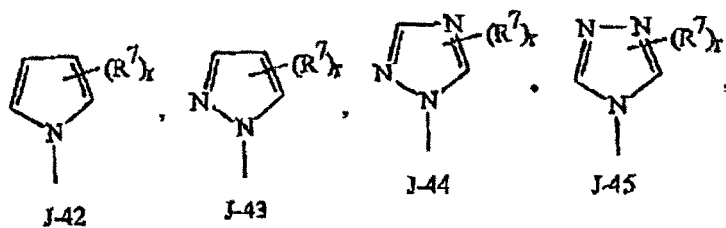
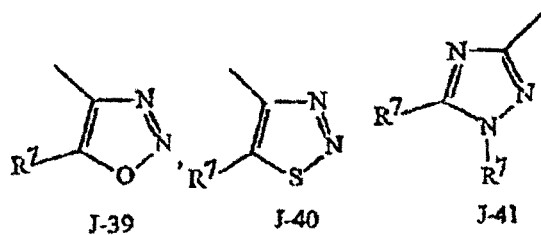
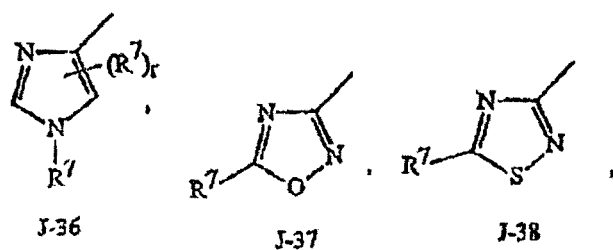
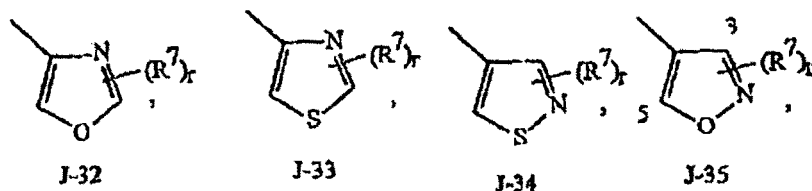
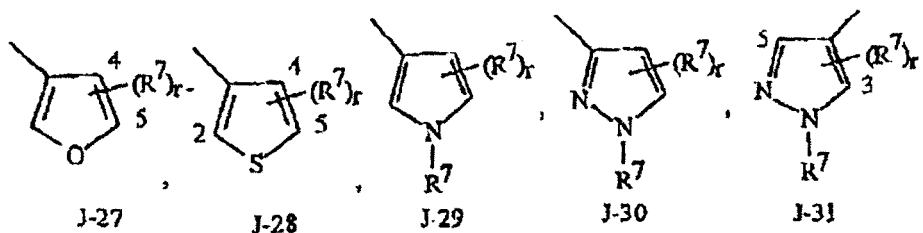
Tal como se ha hecho notar anteriormente, cada J es de forma independiente un grupo fenilo o un grupo naftilo sustituido con de 1 a 2  $R^5$  y opcionalmente sustituido con de 1 a 3  $R^6$ ; o cada J es de forma independiente un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros o un sistema de anillos heterobíciclicos fusionados de 8, 9 o 10 miembros aromático donde cada anillo o sistema de anillos está opcionalmente sustituido con de 1 a 4  $R^7$ . El término "opcionalmente sustituido" en relación a estos grupos J se refiere a grupos que no están sustituidos o que tienen al menos un sustituyente distinto de hidrógeno que no elimina la actividad artropodocida que posee el análogo no sustituido. También debe notarse que los J-1 a J-5 anteriores denotan anillos heteroaromáticos de 5 o 6 miembros. Un ejemplo de fenilo sustituido con de 1 a 2  $R^5$  y opcionalmente sustituido con de 1 a 3  $R^6$  es el anillo que se ilustra como J-6 en el Panel 1, donde m es un entero entre 1-2 y q es un entero de 1 a 3. Debe notarse que al menos un  $R^5$  debe estar presente en J-6. Aunque los grupos  $R^6$  se muestran en la estructura J-6, debe notarse que no necesitan estar presentes ya que son sustituyentes opcionales. Un ejemplo de grupo naftilo sustituido con de 1 a 2  $R^5$  y opcionalmente sustituido con de 1 a 3  $R^6$  es el anillo que se ilustra como J-59 en el Panel 1, donde m es un entero entre 1-2 y q es un entero de 1 a 3. Debe notarse que al menos un  $R^5$  debe estar presente en J-59. Aunque los grupos  $R^6$  se muestran en la estructura J-59, debe notarse que no necesitan estar presentes ya que son sustituyentes opcionales. Ejemplos de anillos heteroaromáticos de 5 o 6 miembros opcionalmente sustituidos con de 1 a 4  $R^7$  incluyen los anillos J-7 hasta J-58 que se ilustran en el Panel 1 donde r es un entero de 1 a 4. Debe notarse que J-7 hasta J-26 son ejemplos de J-1, J-27 hasta J-41 son ejemplos de J-2, J-42 hasta J-44 son ejemplos de J-3, J-46 hasta J-53 son ejemplos de J-4 y que J-54 hasta J-58 son ejemplos de J-5. Los átomos de nitrógeno que necesitan sustitución para completar sus valencias están sustituidos con  $R^7$ . Debe notarse que algunos grupos J sólo pueden estar sustituidos con menos de 4 grupos  $R^7$  (por ejemplo J-19, J-20, J-23 hasta J-26 y J-37 hasta J-40 sólo pueden estar sustituidos con un  $R^7$ ). Algunos ejemplos de sistemas de anillos heterobíciclicos fusionados de 8, 9 o 10 miembros aromáticos opcionalmente sustituidos con de 1 a 4  $R^7$  incluyen J-60 hasta J-90 ilustrados en el Panel 1 donde r es un entero de 1 a 4. Aunque los grupos  $R^7$  se muestran en las estructuras J-7 hasta J-58 y J-60 hasta J-90, debe notarse que no necesitan estar presentes ya que son sustituyentes opcionales. Debe notarse que cuando  $R^5$ ,  $R^6$  y/o  $R^7$  son H cuando están unidos a un átomo, esto es lo mismo que decir que dicho átomo no está sustituido. Debe notarse que cuando el punto de unión entre  $(R^5)_m$ ,  $(R^6)_q$  o  $(R^7)_r$  y el grupo J está ilustrado como flotante,  $(R^5)_m$ ,  $(R^6)_q$  o  $(R^7)_r$  pueden estar unidos a cualquier átomo de carbono disponible del grupo. Debe notarse que cuando el punto de unión del grupo J se ilustra como flotante, el grupo J puede estar unido al resto de la Fórmula I a través de cualquier carbono disponible del grupo J por reemplazamiento de un átomo de hidrógeno.

Panel 1

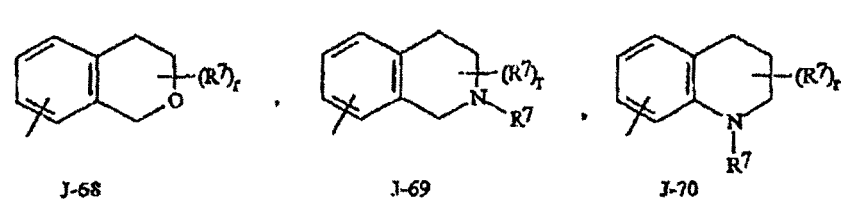
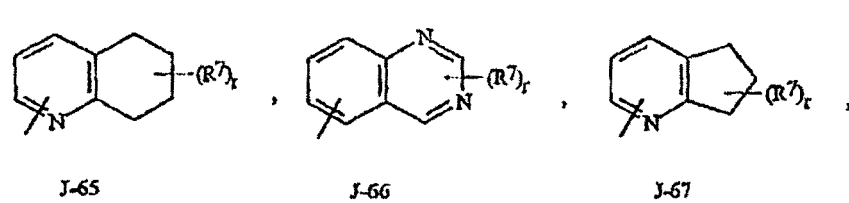
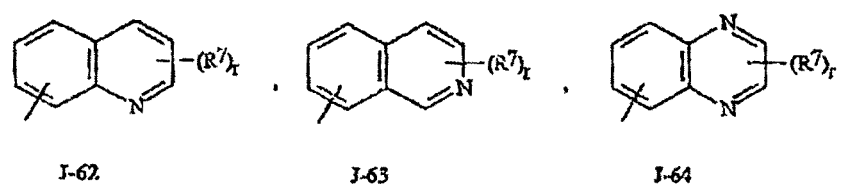
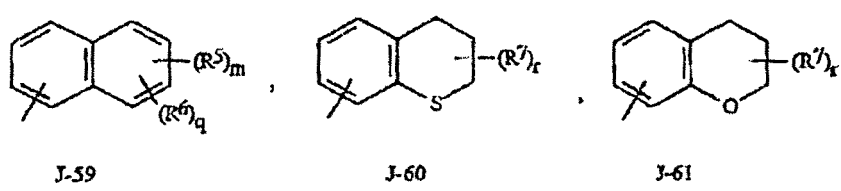
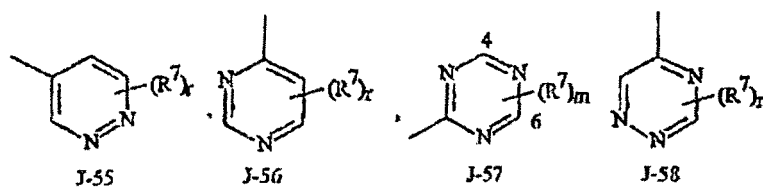
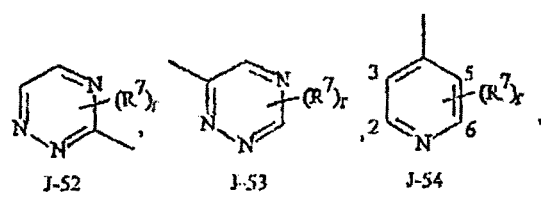
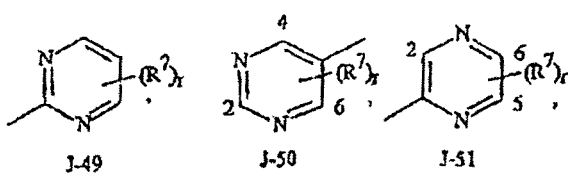


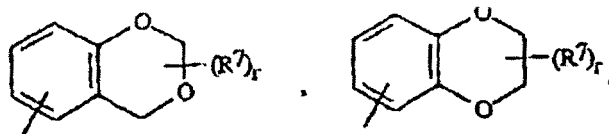
J-6





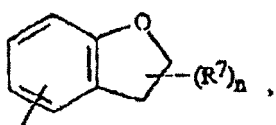
5  
10  
15  
20  
25  
30  
35  
40  
45  
50  
55  
60  
65



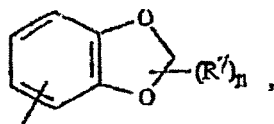


J-71

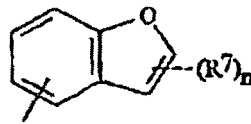
J-72



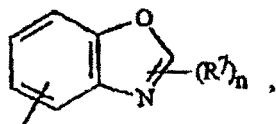
J-73



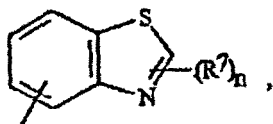
J-74



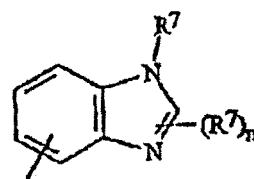
J-75



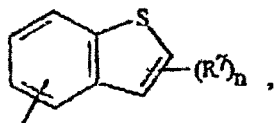
J-76



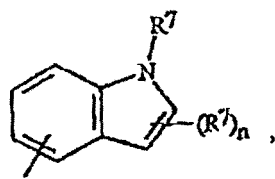
J-77



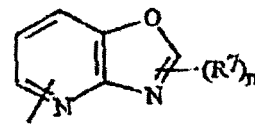
J-78



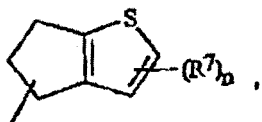
J-79



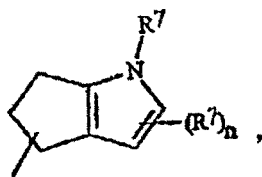
J-80



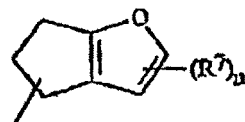
J-81



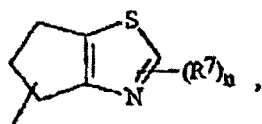
J-82



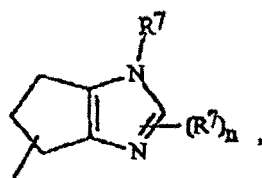
J-83



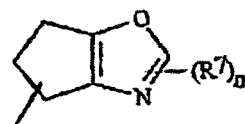
J-84



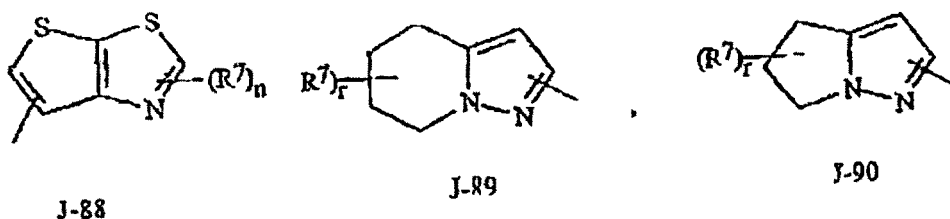
J-85



J-86

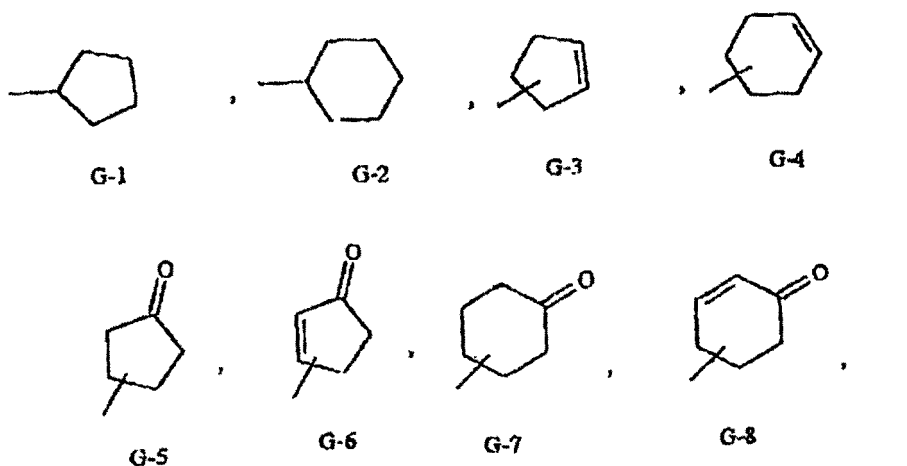


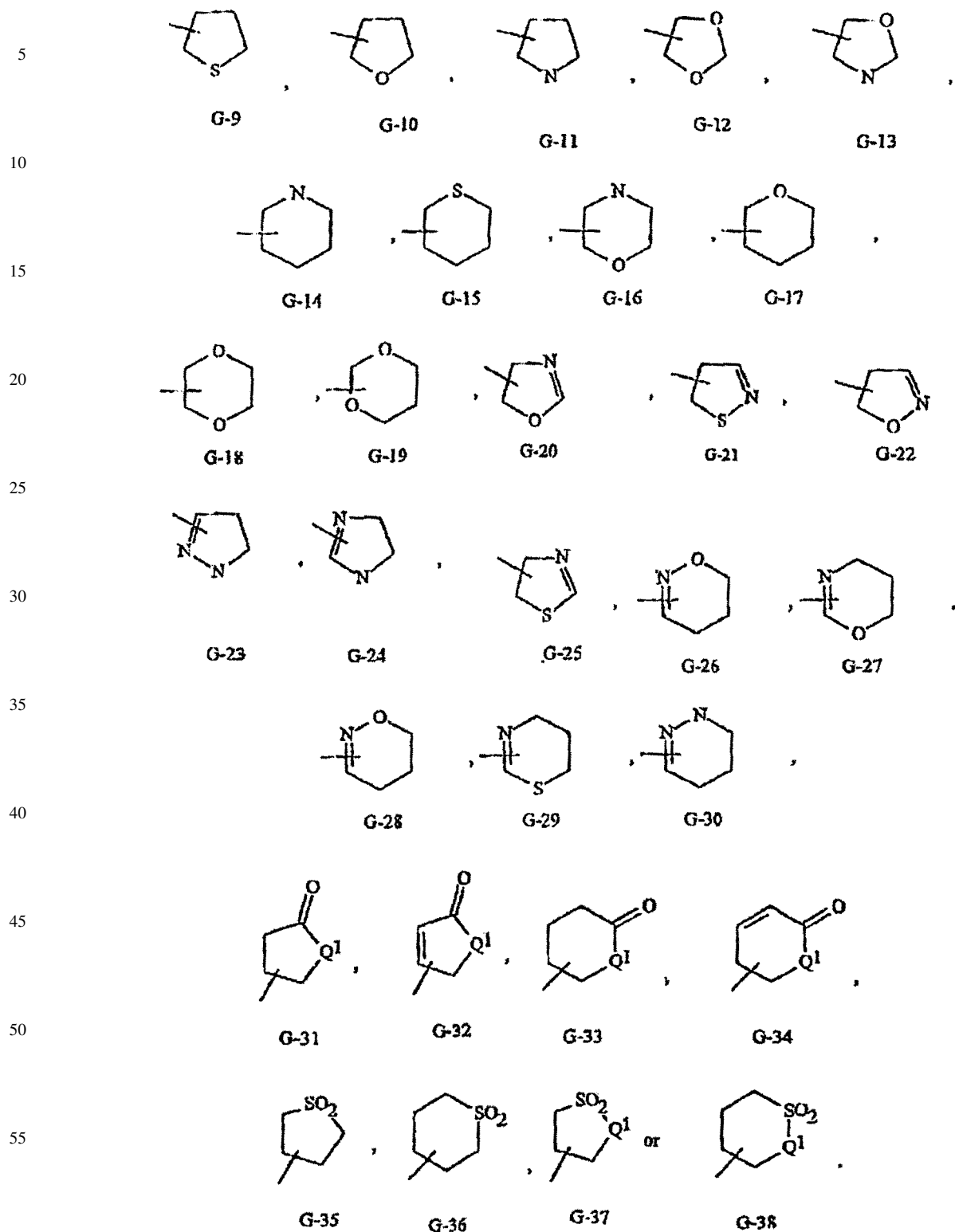
J-87



Tal como se ha hecho notar anteriormente, G es un anillo carbocíclico o heterocíclico no aromático de 5 o 6 miembros, que incluye opcionalmente uno o dos miembros del anillo seleccionados de entre el grupo consistente en C(=O), SO, o S(O)<sub>2</sub> y opcionalmente sustituido con de 1 a 4 sustituyentes seleccionados de entre el grupo consistente en alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>, halógeno, CN, NO<sub>2</sub> y alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>. El término "opcionalmente sustituido" en relación a estos grupos G se refiere a grupos que no están sustituidos o que tienen al menos un sustituyente distinto de hidrógeno que no elimina la actividad artropodocida que posee el análogo no sustituido. Debe notarse que cuando el punto de unión del grupo G se ilustra como flotante, el grupo G puede estar unido al resto de la Fórmula I a través de cualquier carbono disponible del grupo G por reemplazamiento de un átomo de hidrógeno. Algunos ejemplos de anillos carbocíclicos no aromáticos de 5 o 6 miembros como G incluyen los anillos ilustrados como G-1 hasta G-8 del Panel 2, donde tales anillos están opcionalmente sustituidos con de 1 a 4 sustituyentes seleccionados de entre el grupo consistente en alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>, halógeno, CN, NO<sub>2</sub> y alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>. Algunos ejemplos de anillos heterocíclicos no aromáticos de 5 o 6 miembros como G incluyen los anillos ilustrados como G-9 hasta G-48 del Panel 2, donde tales anillos están opcionalmente sustituidos con de 1 a 4 sustituyentes seleccionados de entre el grupo consistente en alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>, halógeno, CN, NO<sub>2</sub> y alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>. Debe notarse que cuando G comprende un anillo seleccionado de G-31 hasta G-34, G-37 y G-38, Q1 se selecciona de entre O, S o N. Debe notarse que cuando G es G-11, G-13, G-14, G-16- G-23, G-24, G-30 hasta G-34, G-37 y G-38 y Q1 es N, el átomo de nitrógeno puede completar su valencia mediante sustitución con H o bien con alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>.

## Panel 2





Tal como se ha hecho notar anteriormente, cada R<sup>6</sup> y cada R<sup>7</sup> pueden ser de forma independiente (entre otros) anillos heteroaromáticos de 5 o 6 miembros o sistemas de anillos heterobíclicos fusionados de 8, 9 o 10 miembros, estando cada anillo opcionalmente sustituido con de uno a tres sustituyentes seleccionados de forma independiente de entre el grupo consistente en alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alquino C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalqueno C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquino C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, halocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, halógeno, CN, NO<sub>2</sub>, alcóxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, ha-

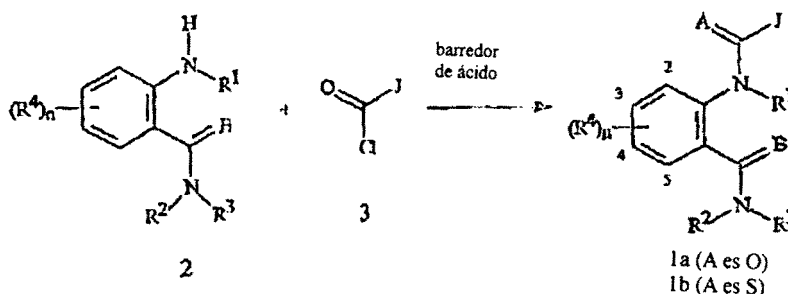


loalcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, dialquilamino C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>, cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, (alquil)cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alquilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquilaminocarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, dialquilaminocarbonilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> o trialquilsililo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>. Algunos ejemplos de tales grupos R<sup>6</sup> y R<sup>7</sup> incluyen los anillos o los sistemas de anillos ilustrados como anillos J-7 hasta J-58 y J-60 hasta J-90 ilustrados en el Panel 1, excepto que tales anillos están opcionalmente sustituidos con de 1 a 3 sustituyentes seleccionados de entre el grupo que consiste en alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alquino C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalqueno C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquino C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, halocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, halógeno, CN, NO<sub>2</sub>, alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, dialquilamino C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>, cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, (alquil)cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alquilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquilaminocarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, dialquilaminocarbonilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> o trialquilsililo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> antes que (R<sup>7</sup>)r. Debe notarse que estos sustituyentes pueden estar unidos a cualquier átomo de carbono disponible del grupo J por reemplazamiento de un átomo de hidrógeno. Debe notarse que cuando el punto de unión del grupo J se ilustra como flotante, el grupo J puede estar unido al resto de la Fórmula I a través de cualquier carbono disponible del grupo J por reemplazamiento de un átomo de hidrógeno.

Se puede utilizar uno o más de los siguientes métodos y variaciones tal como se describen en los Esquemas 1-17 para preparar los compuestos de Fórmula 1. Las definiciones de A, B, J, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>5</sup>, R<sup>6</sup>, R<sup>7</sup>, m y n en los compuestos de Fórmula 1-34 anteriores son tal como se ha definido anteriormente en la Breve Exposición de la Invención. Los compuestos de Fórmulas 1a-c, 2a-b, 4a-g, 5a-b son varios subconjuntos de los compuestos de Fórmula 1, 2, 4 y 5.

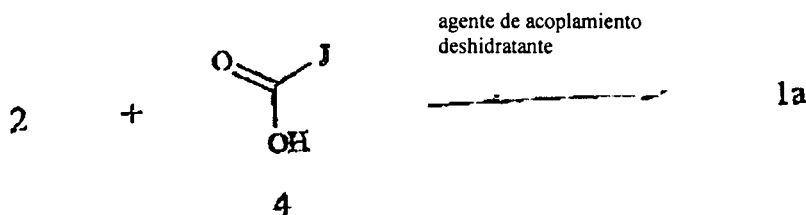
Los compuestos de Fórmula 1 pueden prepararse mediante los procedimientos mostrados en los Esquemas 1-17. Un procedimiento típico se detalla en el Esquema 1 y comprende el acoplamiento de una amida antranfílica de Fórmula 2 con un cloruro de ácido de Fórmula 3 en presencia de un barredor de ácido para dar el compuesto de Fórmula 1. Algunos barredores de ácido típicos incluyen bases de tipo amina como trietilamina, diisopropiltilenamina y piridina; otros barredores de ácido incluyen hidróxidos como hidróxido de sodio y de potasio y carbonatos como carbonato de sodio y carbonato de potasio. En ciertos casos es útil utilizar barredores de ácido soportados sobre polímero como diisopropiltilenamina unida a polímero y dimetilaminopiridina unida a polímero. En un paso posterior, las amidas de Fórmula 1a pueden convertirse a tioamidas de Fórmula 1b utilizando diversos reactivos de tio transferencia incluyendo pentaazufreo de fósforo y reactivo de Lawesson's.

Esquema 1



Un procedimiento alternativo para la preparación de compuestos de fórmula 1a comprende el acoplamiento de una amida antranfílica de Fórmula 2 con un ácido de Fórmula 4 en presencia de un agente deshidratante como diciclohexilcarbodiimida (DCC). De nuevo, los reactivos soportados sobre polímero también son de utilidad en este proceso, como ciclohexilcarbodiimida unida a polímero. Los procedimientos sintéticos de los Esquemas 1 y 2 son solamente ejemplos representativos de métodos de utilidad para la preparación de compuestos de Fórmula 1 ya que existe extensa literatura sintética para este tipo de reacción.

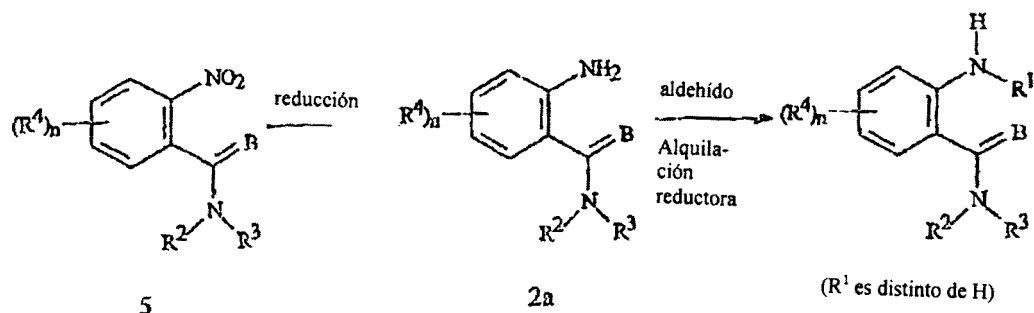
Esquema 2



Las personas con experiencia en el campo de la técnica también notarán que los cloruros de ácido de Fórmula 3 pueden ser preparados a partir de ácidos de Fórmula 4 mediante una multitud de métodos suficientemente conocidos.

Las amidas antranflicas de Fórmula 2a se pueden conseguir típicamente a partir de las correspondientes 2-nitrobenzamidias de Fórmula 5 mediante hidrogenación catalítica del grupo nitro. Los procedimientos típicos comprenden la reducción con hidrógeno en presencia de un catalizador metálico como paladio sobre carbono u óxido de platino en disolventes hidroxílicos como etanol e isopropanol. Estos procedimientos se hallan bien documentados en la literatura química. Los sustituyentes R<sup>1</sup> como alquilo, alquilo sustituido y similares generalmente se pueden introducir en este paso mediante procedimientos conocidos incluyendo alquilación directa o bien mediante el método generalmente preferido de alquilación reductiva de la amina. Un método normalmente empleado es la combinación de la anilina 2a con un aldehído en presencia de un agente reductor como cianoborohidruro de sodio para fabricar los compuestos de Fórmula 2b donde R<sup>1</sup> es alquilo, alquenoilo, alquinilo o sus derivados sustituidos.

Esquema 3

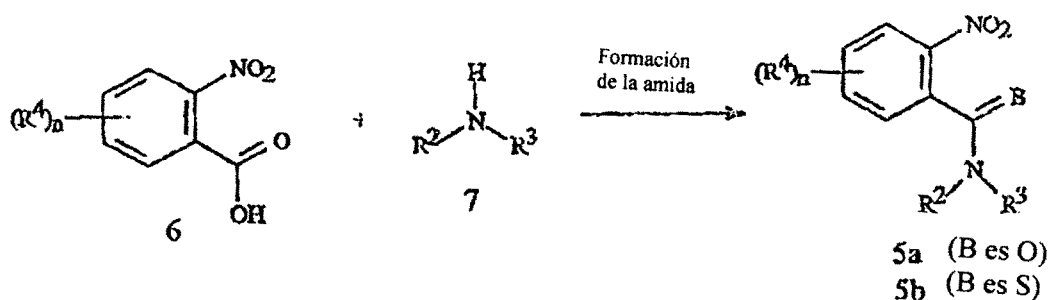


Los intermedios de tipo amida de Fórmula 5a se preparan de forma inmediata a partir de ácidos 2-nitrobenzoicos que se pueden adquirir comercialmente. Se pueden aplicar aquí los métodos típicos para la fabricación de amidas. Éstos incluyen el acoplamiento deshidratante directo de ácidos de Fórmula 6 con aminas de Fórmula 7 utilizando por ejemplo DCC, y la conversión de los ácidos a una forma activada como los cloruros de ácido o los anhídridos y el posterior acoplamiento con aminas para formar las amidas de Fórmula 5a.

Hemos encontrado que el etilcloroformiato es un reactivo especialmente útil para este tipo de reacción que involucra la activación del ácido. Existe una extensa literatura química sobre este tipo de reacción.

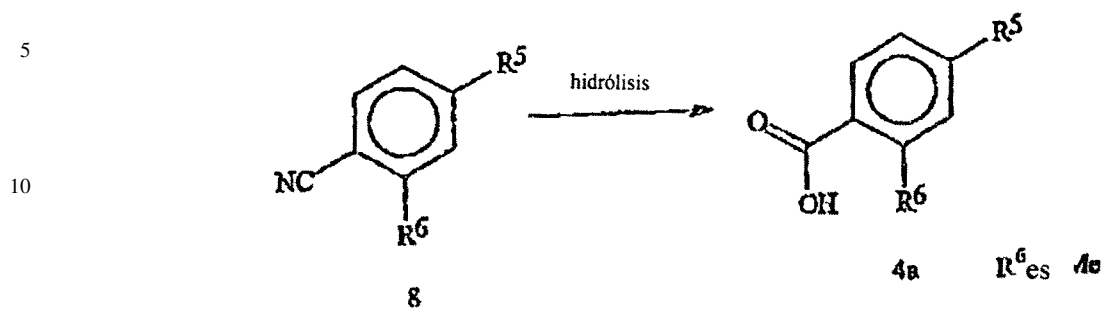
Las amidas de fórmula 5a se convierten de forma inmediata en tioamidas de Fórmula 5b utilizando agentes de tio transferencia asequibles comercialmente como pentasulfuro de fósforo y Reactivo de Lawesson.

Esquema 4



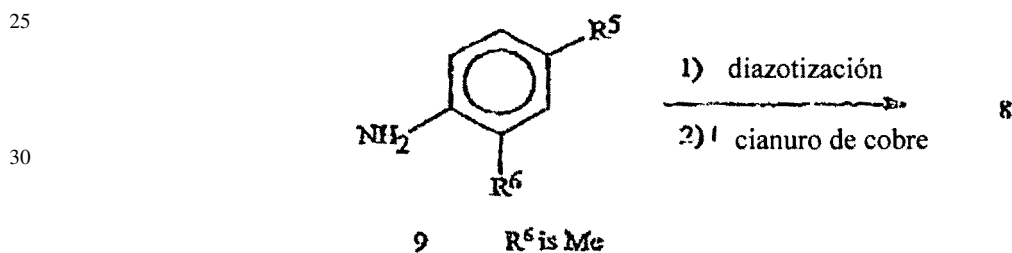
Los ácidos benzoicos de fórmula 4 (J es un fenilo opcionalmente sustituido) son generalmente bien conocidos en la técnica, así como los procedimientos para su preparación. Un subgrupo de ácidos benzoicos de la invención particularmente útiles son los ácidos 2-metil-4-perfluoroalquilbenzoicos de Fórmula 4a (R<sup>5</sup> es igual a, por ejemplo, CF<sub>3</sub>, C<sub>2</sub>F<sub>5</sub>, C<sub>3</sub>F<sub>7</sub>). La síntesis de estos compuestos se muestra de forma esquematizada en los Esquemas 5-9. Los ácidos benzoicos de fórmula 4a pueden ser preparados a partir de los benzonitrilos de Formula 8 por hidrólisis. Las condiciones usadas pueden involucrar el uso de una base como un hidróxido de metal alcalino o un alcóxido (por ejemplo, hidróxido de sodio o potasio) en un disolvente como agua, etanol o etilenglicol (por ejemplo J Chem. Soc. 1948,1025). De forma alternativa, la hidrólisis se puede llevar a cabo utilizando un ácido como ácido sulfúrico o ácido fosfórico en un disolvente apropiado como agua (por ejemplo Org. Synth. 1955, Coll vol. 3, 557). La elección de las condiciones depende de la estabilidad de R<sup>5</sup> a las condiciones de reacción y normalmente se utilizan temperaturas elevadas para llevar a cabo esta transformación.

Esquema 5



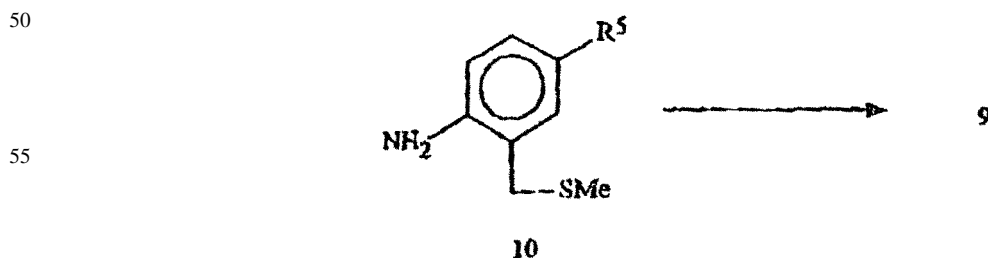
20 Los nitrilos de Fórmula 8 pueden ser preparados a partir de anilinas de fórmula 9 mediante la secuencia clásica que comprende diazotización y tratamiento de la sal de diazonio intermedia con una sal de cianuro de cobre (por ejemplo J. Amer. Chem. Soc. 1902, 24, 1035).

Esquema 6



40 Las anilinas de Fórmula 9 pueden ser preparadas a partir de compuestos de Fórmula 10. Esta transformación se puede llevar a cabo mediante un procedimiento bien conocido que utiliza níquel Raney (Org. Synth. Coll. Vol VI, 581). De forma alternativa, la misma transformación se puede llevar a cabo mediante la utilización de un catalizador apropiado como paladio en presencia de hidrógeno. La reacción normalmente se lleva a cabo a presiones de  $10^2$  hasta  $10^5$  kPa en un disolvente orgánico apropiado como, pero sin estar limitado a, tolueno. Normalmente se necesitan temperaturas elevadas de 80-110°C para que se lleve a cabo la transformación. Como notarán las personas con experiencia en el campo de la técnica, son posibles numerosas modificaciones químicas del motivo tioéter, y pueden utilizarse cuando se considere necesario para facilitar esta transformación.

Esquema 7



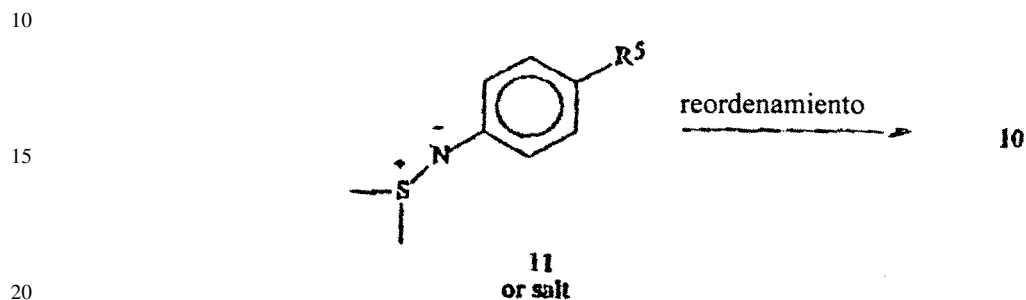
65 Los compuestos de Fórmula 10 pueden ser preparados a partir de iminosulfuranos de Fórmula 11.

La transformación se puede llevar a cabo en un disolvente prótico como metanol o agua, en un disolvente no prótico como diclorometano o tolueno en presencia de una base apropiada como trietilamina (por ejemplo Org. Synth. Coll. Vol. VI, 581) o metóxido de sodio, o en una combinación de un disolvente prótico, un disolvente no prótico y una base. La temperatura a la cual se lleva a cabo la reacción está normalmente en el rango de 40-110°C. Como

## ES 2 278 738 T3

notarán las personas con experiencia en el campo de la técnica, también pueden utilizarse las sales apropiadas de los compuestos de Fórmula 11 como, pero sin estar limitado a, un hidrocloruro, un sulfato o un bisulfato, mientras que primeramente se utilice la cantidad apropiada de base para generar la base libre 11. Ello se puede llevar a cabo como una etapa separada o como parte integral de la etapa que comprende la transformación del compuesto de Fórmula 11 en los compuestos de Fórmula 10.

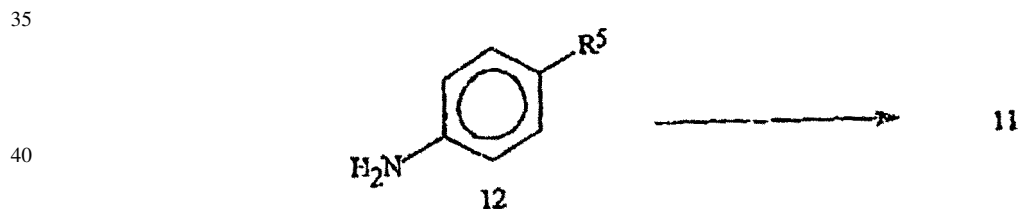
Esquema 8



25 Los compuestos de Fórmula 11 pueden ser preparados a partir de anilinas de Fórmula 12 mediante la reacción con sulfuro de dimetilo y un agente clorante apropiado como, pero sin estar limitado a N-clorosuccinimida (por ejemplo Org. Synth. Coll. Vol. VI, 581), cloro o N-clorobenzotriazol. De forma alternativa, las anilinas de Fórmula 12 se pueden tratar con dimetil sulfóxido que halla sido "activado" mediante tratamiento con un agente como anhídrido acético, anhídrido trifluoroacético, anhídrido trifluorometanosulfónico, ciclohexilcarbodiimida, trióxido de azufre o pentóxido de fósforo. La reacción se lleva a cabo en un disolvente orgánico apropiado como diclorometano o dimetilsulfóxido. La reacción se lleva a cabo a una temperatura de -70°C a 25°C y depende del disolvente y reactivo utilizados.

30

Esquema 9



45 Las amidas antranflicas intermedias de Fórmula 2a y 2b también pueden prepararse a partir de los anhídridos isatoicos de Fórmula 13 y 14 (Esquema 10). Algunos procedimientos típicos comprenden la combinación de cantidades equimolares de la amina 7 con el anhídrido isatónico en disolventes apróticos polares como piridina y dimetiloformamida a temperaturas que van desde temperatura ambiente hasta 100°C. Se pueden introducir sustituyentes R<sup>1</sup> como alquilo y alquilo sustituido mediante la alquilación catalizada por base del anhídrido isatoico 13 con agentes de alquilación conocidos.

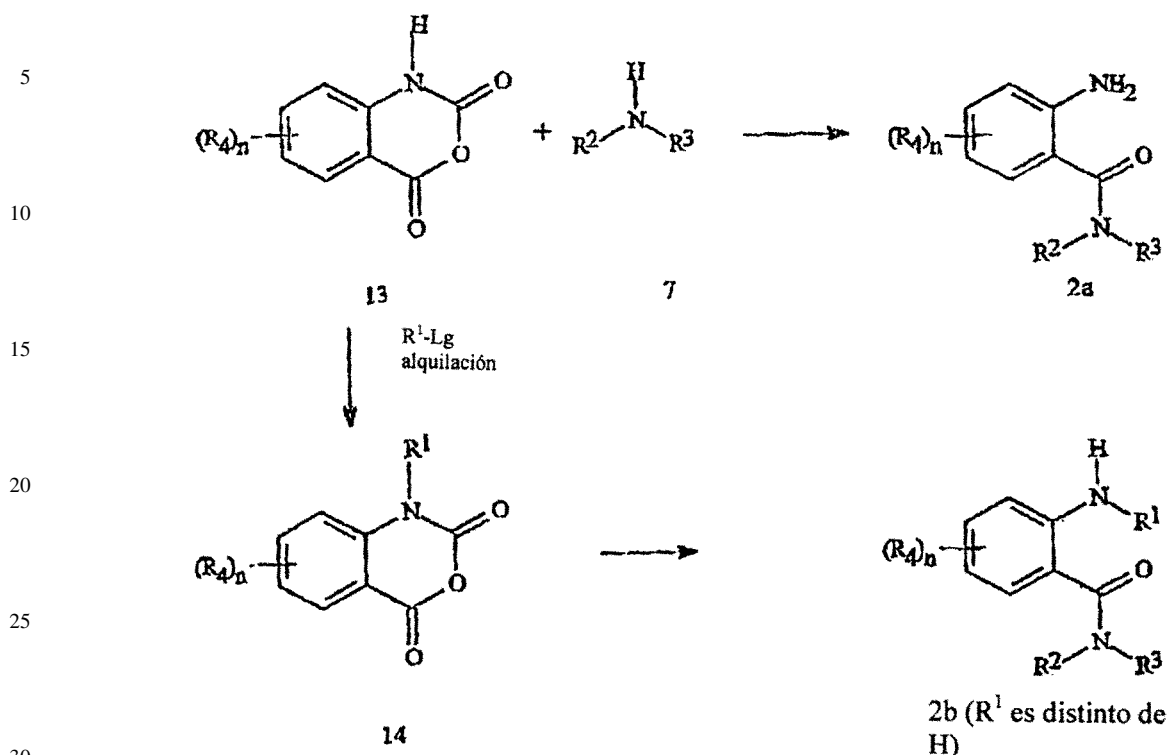
50

55 R<sup>1</sup>-Lg (donde Lg es un grupo saliente como halógeno, sulfonatos de alquilo o arilo o sulfatos de alquilo) para dar los intermedios sustituidos con alquilo 14. Los anhídrido isatoicos de Fórmula 13 se pueden fabricar mediante los métodos que se describen en Coppola, Synthesis 505-36 (1980).

60

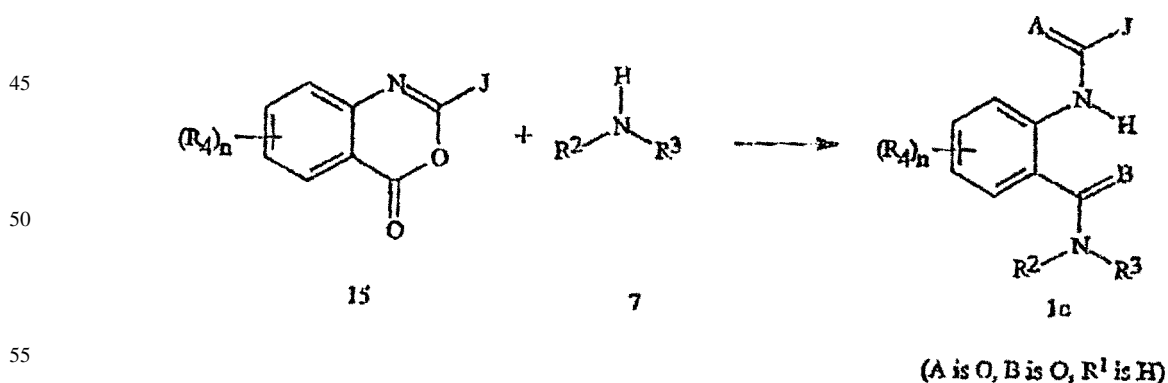
65

Esquema 10



Un procedimiento alternativo para la preparación de compuestos específicos de Fórmula 1 (donde A es O, B es O y R<sup>1</sup> es H) comprende la reacción de una amina 7 con una benzoxazinona de Fórmula 15. Los procedimientos típicos comprenden la combinación de la amina con la benzoxazinona en disolventes como tetrahidrofurano o piridina a temperaturas que van desde temperatura ambiente hasta la temperatura de reflujo del disolvente. Las benzoxazinonas están bien documentadas en la literatura química y se pueden obtener mediante métodos conocidos que comprenden el acoplamiento de un ácido antranílico o un anhídrido isatoico con un cloruro de ácido. Para referencias sobre la síntesis y la química de benzoxazinonas ver Jakobsen *et al*, Biorganic and Medicinal Chemistry, 2000, 8, 2095-2103 y las referencias que se citan en ese trabajo. Ver también Coppola, J Heterocyclic Chemistry, 1999, 36, 563-588.

Esquema 11



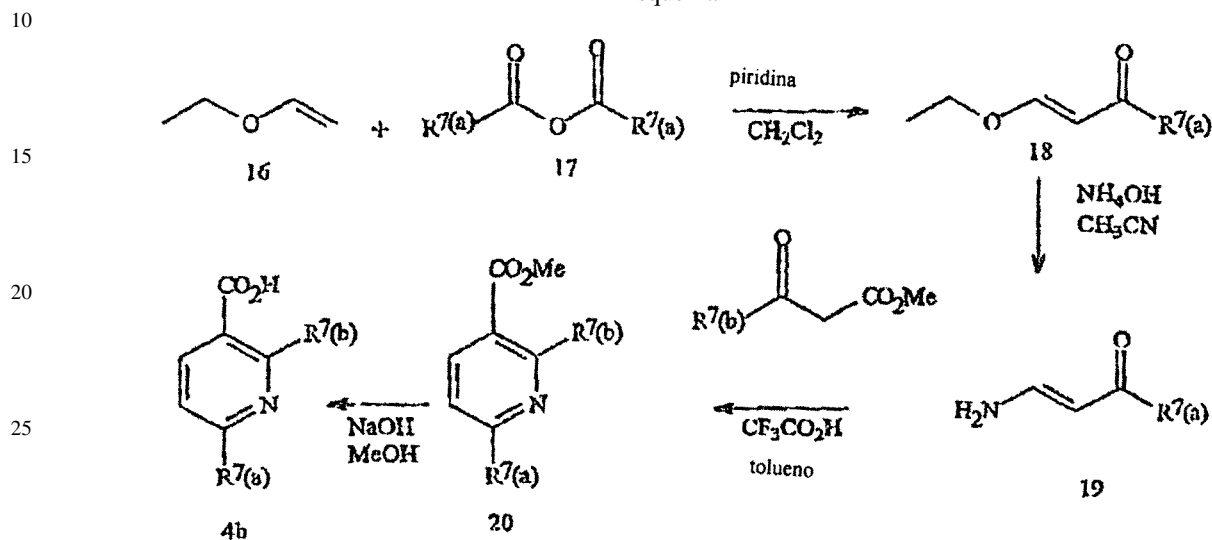
Los ácidos heterocíclicos 4, donde J es igual a un heterociclo opcionalmente sustituido, puede prepararse mediante los procedimientos que se muestran en los Esquemas 12-17. Se pueden encontrar referencias tanto generales como específicas a una amplia variedad de ácidos heterocíclicos, incluyendo tiofenos, furanos, piridinas, pirimidinas, triazoles, imidazoles, pirazoles, tiazoles, oxazoles, isotiazoles, tiadiazoles, oxadiazoles, triazinas, pirazinas, piridazinas, e isoxazoles en los siguientes compendios:

Rodd's Chemistry de Chemistry de Carbon Compuestos, Vol. IVa a IVI., S. Coffey editor, Elsevier Scientific Publishing, New York, 1973; Comprehensive Heterocyclic Chemistry, Vol. 1-7, A. R. Katritzky y C. W. Rees editores, Pergamon Press, New York, 1984; Comprehensive Heterocyclic Chemistry Vol. 1-9, A. R. Katritzky, C. W. Rees, y E. F. Scriven editores, Pergamon Press, New York, 1996; y la serie The Chemistry of Heterocyclic Compounds, E. C. Taylor, editor, Wiley, New York. Algunos ácidos heterocíclicos particularmente útiles de esta invención incluyen

ácidos de piridina, ácidos de pirimidina y ácidos de pirazol. Los procedimientos para la síntesis de algunos ejemplos representativos de cada uno se detallan en los Esquemas 12-17. Se pueden encontrar diversos ácidos heterocíclicos y los métodos generales para su síntesis en la World Patent Application WO98/57397.

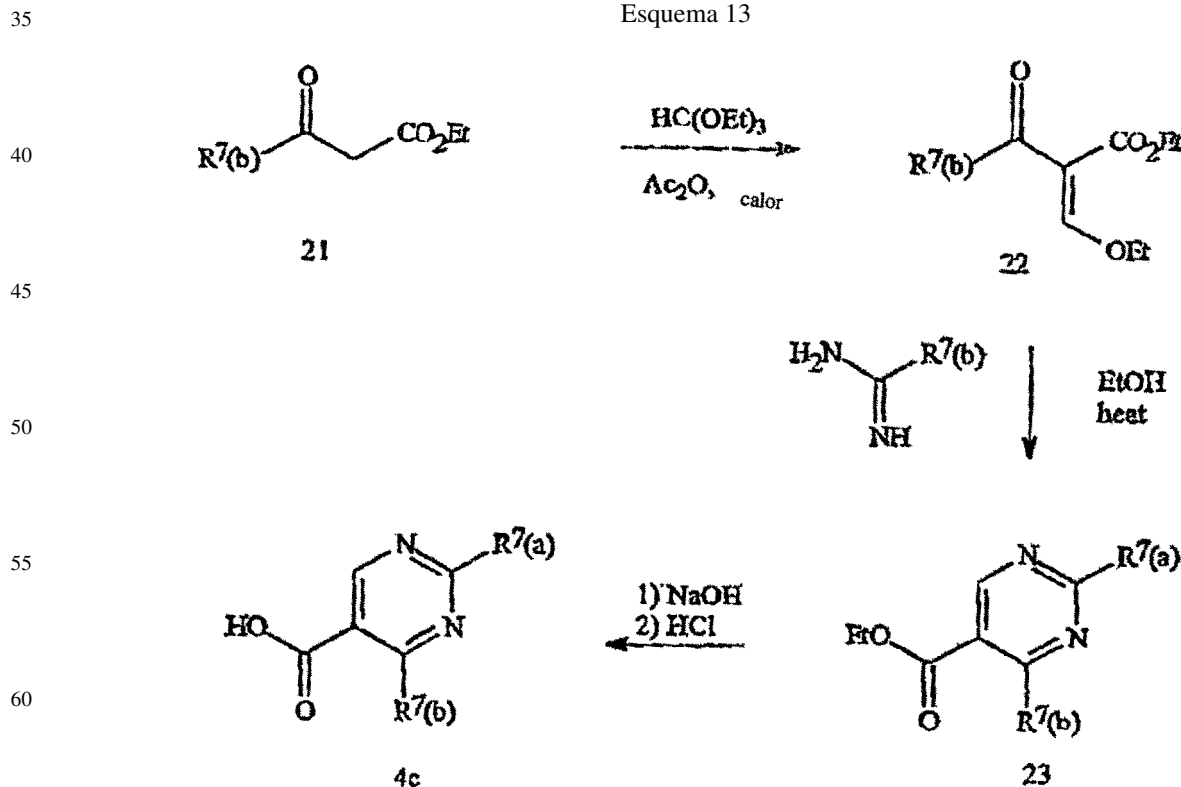
5 La síntesis de ácidos de piridina representativos (4b) se muestra en el Esquema 12. Este procedimiento comprende la síntesis conocida de piridinas a partir de  $\beta$ -cetoésteres y 4-aminobutenonas (19). Los grupos sustituyentes  $R^7(a)$  y  $R^7(b)$  incluyen por ejemplo alquilo y haloalquilo.

Esquema 12



La síntesis de ácidos de pirimidina representativos (4c) se muestra en el Esquema 13. Este procedimiento comprende los procedimientos de síntesis conocidos de pirimidinas a partir de viniliden- $\beta$ -cetoésteres (22) y amidinas. Los grupos sustituyentes  $R^7(a)$  y  $R^7(b)$  incluyen por ejemplo alquilo y haloalquilo.

Esquema 13



La síntesis de ácidos de pirazol representativos (4d-4g) se muestra en los Esquemas 14-17. Los pirazoles 4d se describen en el Esquema 14. La síntesis del Esquema 14 comprende como etapa clave la introducción del sustituyente  $R^7(b)$  mediante la alquilación del pirazol. El agente alquilante  $R^7(b)$ -Lg (donde Lg es un grupo saliente como Cl, Br,

I, sulfonatos como p-toluenosulfonato o metanosulfonato o sulfatos como  $-\text{SO}_2\text{OR}^7(\text{b})$  incluye grupos  $\text{R}^7(\text{b})$  como alquilo  $\text{C}_1\text{-C}_6$ , alqueno  $\text{C}_2\text{-C}_6$ , alquino  $\text{C}_2\text{-C}_6$ , cicloalquilo  $\text{C}_3\text{-C}_6$ , haloalquilo  $\text{C}_1\text{-C}_6$ , haloalqueno  $\text{C}_2\text{-C}_6$ , haloalquino  $\text{C}_2\text{-C}_6$ , halocicloalquilo  $\text{C}_3\text{-C}_6$ , alquilcarbonilo  $\text{C}_2\text{-C}_6$ , alcoxicarbonilo  $\text{C}_2\text{-C}_6$ , dialquilaminocarbonilo  $\text{C}_3\text{-C}_8$ , trialquilsililo  $\text{C}_3\text{-C}_6$ ; o fenilo, bencilo, benzofilo, anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros o un sistema de anillos heterocíclico fusionado de 8, 9 o 10 miembros aromático, estando cada anillo o sistema de anillos opcionalmente sustituido. La oxidación del grupo metilo da el ácido carboxílico del pirazol. Algunos de los grupos  $\text{R}^7(\text{a})$  más preferidos incluyen haloalquilo.

Esquema 14

10

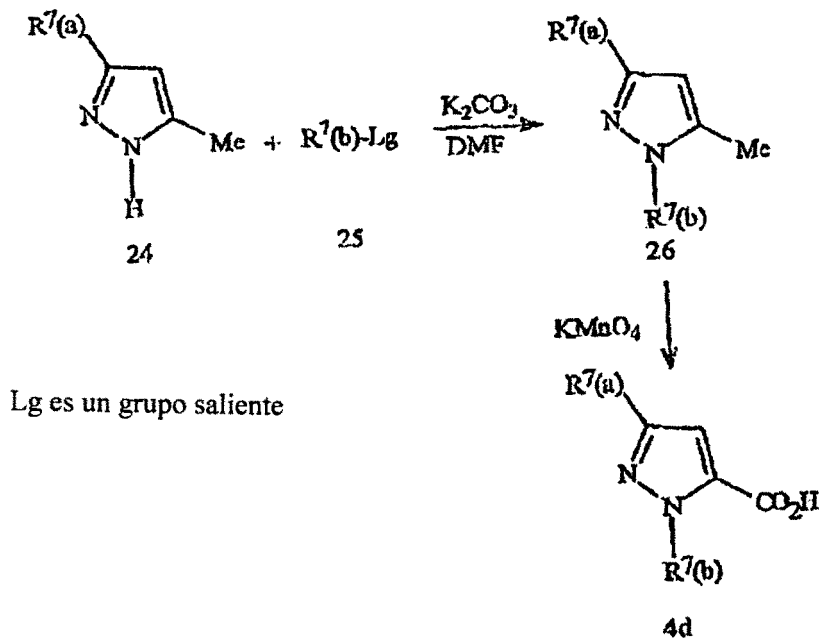
15

20

25

30

35



Los pirazoles 4e se describen en el Esquema 15. Estos ácidos de pirazol se pueden preparar mediante la metalación y carboxilación de los pirazoles de Fórmula 28 como etapa clave. El grupo  $\text{R}^7(\text{b})$  se introduce de forma similar a como se muestra en el Esquema 14, es decir, mediante la alquilación con un agente alquilante  $\text{R}^7(\text{b})$ . Grupos representativos  $\text{R}^7(\text{a})$  incluyen por ejemplo ciano, y haloalquilo.

40

Esquema 15

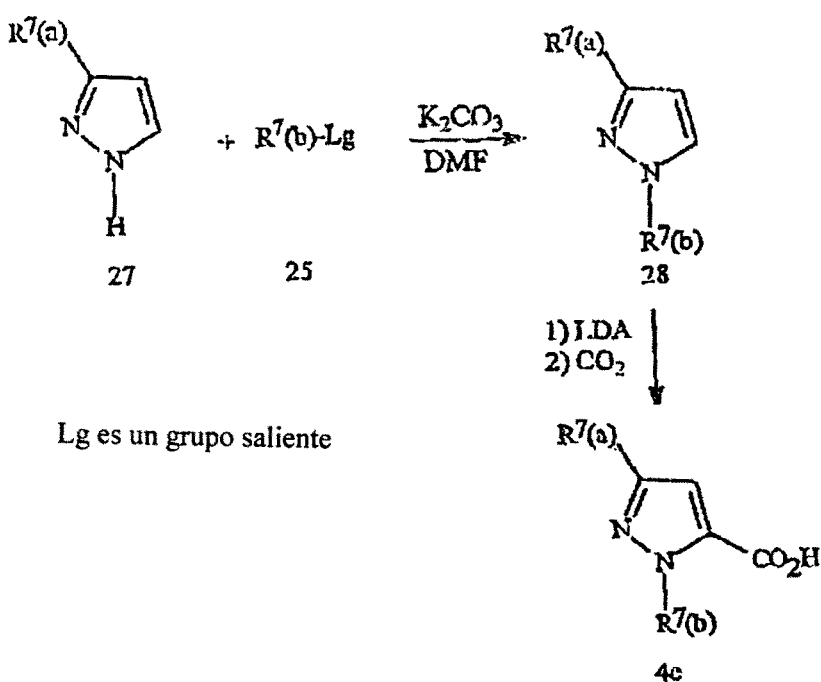
45

50

55

60

65

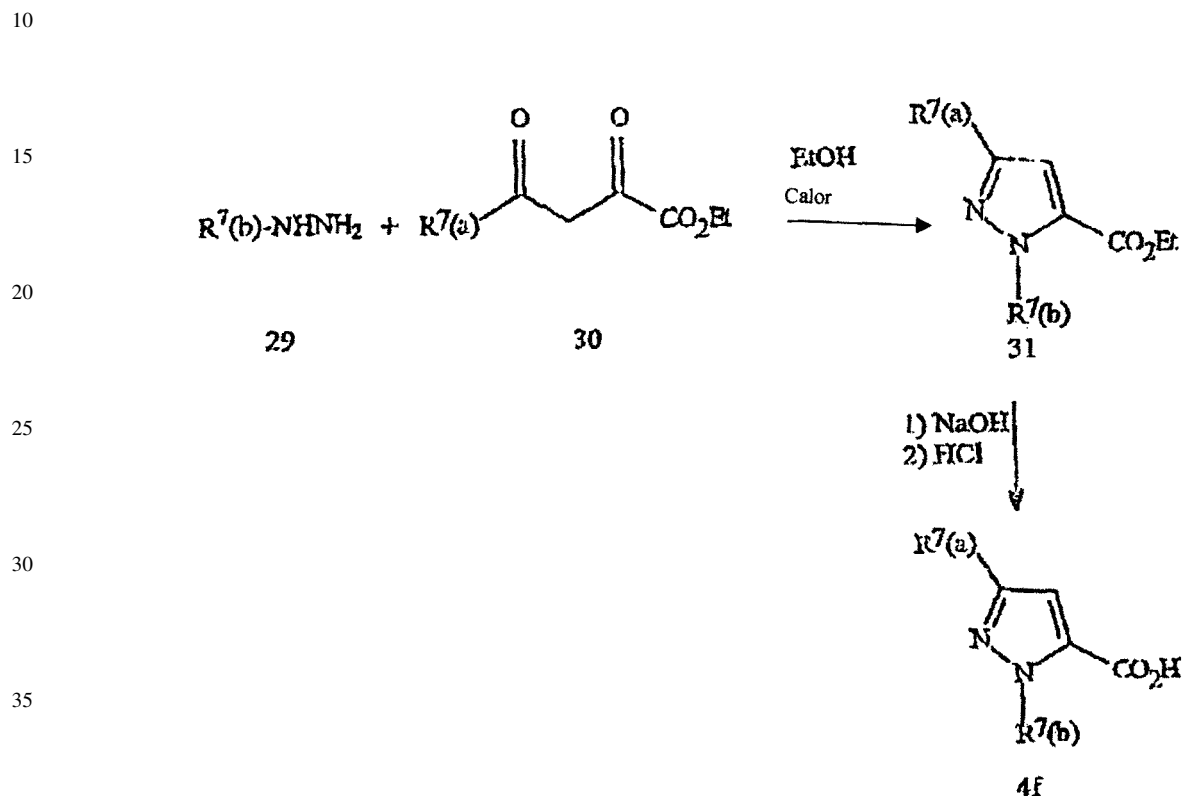


## ES 2 278 738 T3

Los pirazoles 4f se describen en el Esquema 16. Se pueden preparar mediante la reacción de una fenil hidrazina opcionalmente sustituida 29 con un piruvato 30 para dar los ésteres de pirazol 31.

La hidrólisis del éster da los ácidos de pirazol 4f. Este procedimiento es particularmente útil para la preparación de compuestos en los cuales R<sup>7</sup>(b) es fenilo opcionalmente sustituido y R<sup>7</sup>(a) es haloalquilo.

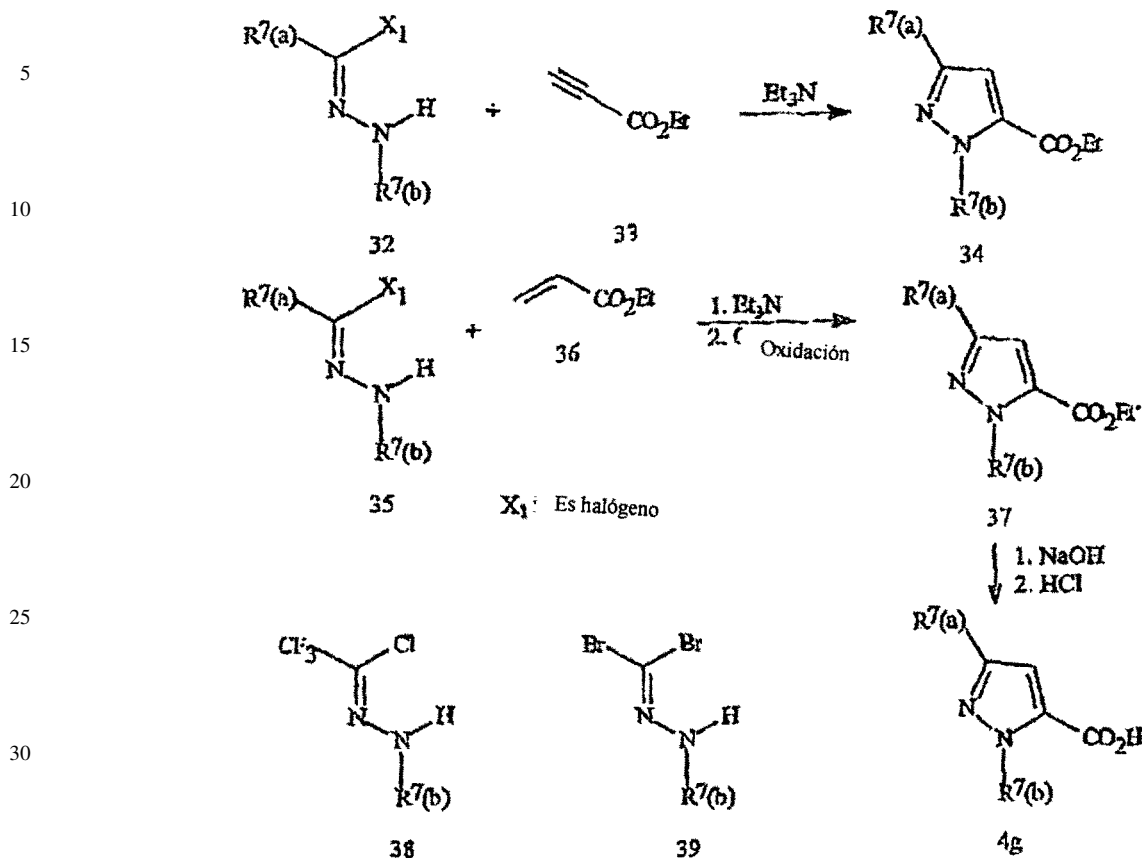
Esquema 16



Los pirazoles ácidos de Fórmula 4g se describen en el Esquema 17. Se pueden preparar mediante una cicloadición 3+2 de una nitrilimina sustituida de forma apropiada con propiolatos (33) o acrilatos (36) sustituidos. La cicloadición con acrilatos necesita una etapa adicional de oxidación del intermedio pirazolina al pirazol. La hidrólisis del éster da los ácidos de pirazol 4g. Los iminohaluros preferidos para esta reacción incluyen el iminocloruro (38) y el iminodibromuro (39) de trifluorometilo. Los compuestos como 38 son conocidos (J. Heterocycl. Chem. 1985, 22 (2), 565-8). Los compuestos como 39 se pueden conseguir mediante métodos conocidos (Tetrahedron Letters 1999, 40, 2605). Estos procedimientos son particularmente útiles para la preparación de compuestos donde R<sup>7</sup>(b) es un fenilo opcionalmente sustituido y R<sup>7</sup>(a) es haloalquilo o bromo.



Esquema 17



Se reconoce que algunos de los reactivos y condiciones de reacción descritos anteriormente para la preparación de los compuestos de Fórmula 1 pueden no ser compatibles con ciertas funcionalidades presentes en los intermedios. En estos casos, la incorporación de secuencias de protección/desprotección o de interconversiones de grupos funcionales en la síntesis ayudará a la obtención de los productos deseados. La utilización y elección de los grupos protectores será evidente para aquellos con experiencia en la síntesis química (ver, por ejemplo, Greene, T.W.; Wuts, P. G. M. Protective Groups in Organic Synthesis, 2ª ed.; Wiley: New York, 1991). Las personas con experiencia en el campo de la técnica reconocerán que, en algunos casos, después de la introducción de un determinado reactivo tal como se muestra en cualquiera de los esquemas individuales, puede ser necesario llevar a cabo etapas sintéticas rutinarias adicionales que no se han descrito en detalle para completar la síntesis de los compuestos de Fórmula 1. Las personas con experiencia en el campo de la técnica también reconocerán que puede ser necesario llevar a cabo una combinación de los pasos ilustrados en los esquemas anteriores en un orden distinto del que se deriva de la secuencia particular presentada para preparar los compuestos de Fórmula 1.

Las personas con experiencia en el campo de la técnica también reconocerán que los compuestos de Fórmula 1 y los intermedios aquí descritos pueden ser sometidos a diversas reacciones electrofílicas, nucleofílicas, de radicales, organometálicas, de oxidación y de reducción para añadir sustituyentes o modificar sustituyentes existentes.

Sin más elaboración, se cree que las personas con experiencia en el campo de la técnica, utilizando la descripción precedente pueden utilizar la presente invención en toda su extensión. Así pues, los siguientes ejemplos son meramente ilustrativos, y no limitantes de la revelación en ningún modo. Los porcentajes son en peso excepto para las mezclas de disolventes utilizados en cromatografía o donde se indique de otra forma. Las partes y los porcentajes para las mezclas de disolventes utilizados en cromatografía son en volumen a menos que se indique de otra forma. Los espectros de  $^1\text{H}$  RMN se dan en ppm de desplazamiento a campo más bajo respecto al tetrametilsilano; s es singulete, d es doblete, t es triplete, q es cuadruplete, m es multiplete, dd es doblete de dobletes, dt es doblete de tripletes, br s es singulete ancho.

#### Ejemplo 1

##### Etapas A

##### Preparación de 3-metil-N-(1-metiletilo)-2-nitrobenzamida

Una solución de ácido 3-metil-2-nitrobenzoico (2.00 g, 11.0 mmol) y trietilamina (1.22 g, 12.1 mmol) en 25 mL de cloruro de metileno se enfrió hasta 10°C. Se añadió con cuidado cloroformiato de etilo y se formó un precipitado

## ES 2 278 738 T3

sólido. Después de agitar durante 30 minutos se añadió isopropilamina (0.94 g, 16.0 mmol) y resultó una solución homogénea. La reacción se agitó durante otra hora adicional, se vertió en agua y se extrajo con acetato de etilo. Los extractos orgánicos se lavaron con agua, se secaron sobre sulfato de magnesio y se evaporaron bajo presión reducida para dar 1.96 g del intermedio deseado en la forma de un sólido de color blanco que funde a 126-128°C.

<sup>1</sup>H RMN (CDCl<sub>3</sub>) δ 1.24 (d, 6H), 2.38 (s, 3H), 4.22 (m, 1H), 5.80 (br s, 1H), 7.4 (m, 3H).

### Etapa B

#### Preparación de 2-amino-3-metil-N-(1-metiletil)benzamida

La 2-nitrobenzamida de la Etapa A (1.70 g, 7.6 mmol) se hidrogenó sobre Pd/C al 5% en 40 mL de etanol a 50 psi. Cuando cesó la absorción de hidrógeno, la reacción se filtró a través de celite y el celite se lavó con éter. El filtrado se evaporó bajo presión reducida para dar 1.41 g del compuesto del título en la forma de un sólido que funde a 149-151°C.

<sup>1</sup>H RMN (CDCl<sub>3</sub>) δ 1.24 (dd, 6H), 2.16 (s, 3H), 4.25 (m, 1H), 5.54 (br s, 2H), 5.85 (br s, 1H), 6.59 (t, 1H), 7.13 (d, 1H), 7.17 (d, 1H).

### Etapa C

#### Preparación de 3-metil-N-(1-metiletil)-2-[[4-trifluorometoxi]benzoil]amino]benzamida

Se añadió cloruro de 4-(trifluorometoxi)benzoilo (0.29 g, 1.3 mmol) gota a gota a una mezcla de la anilina de la Etapa B (0.25 g, 1.3 mmol) y trietilamina (0.13 g, 1.3 mmol) en 5 mL de cloruro de metileno a temperatura ambiente. Después de agitar durante una hora la reacción se vertió en agua y se extrajo con acetato de etilo. Los extractos combinados se secaron sobre sulfato de magnesio y se evaporaron bajo presión reducida. Los sólidos resultantes se lavaron con hexano/éter y se filtraron para dar 0.41 g del compuesto del título, un compuesto de la presente invención, en la forma de un sólido que funde a 207-209°C.

<sup>1</sup>H RMN (CDCl<sub>3</sub>) δ 1.19 (d, 6H), 2.33 (s, 3H), 4.15 (m, 1H), 5.97 (br d, 1H), 7.2-7.4 (m, 6H), 8.04 (d, 1H), 10.11 (brs, 1H).

### Ejemplo 2

#### Etapa A

#### Preparación de ácido 1-etil-3-trifluorometilpirazol-5-il carboxílico

A una mezcla de 3-trifluorometilpirazol (5 g, 37 mmol) y carbonato de potasio en polvo (10 g, 72 mmol), mientras se agitaba en 30 mL de N, N-dimetilformamida, se añadió yodoetano (8 g, 51 mmol) gota a gota. Después de una suave reacción exotérmica, la reacción se agitó durante toda la noche a temperatura ambiente. La mezcla de reacción se repartió entre 100 mL de éter de dietilo y 100 mL de agua. La capa de éter se separó, se lavó con agua (3X) y salmuera, y se secó sobre sulfato de magnesio. La evaporación del disolvente en vacío dio 4 g de aceite.

A 3.8 g de este aceite, agitando en 40 mL de tetrahidrofurano bajo nitrógeno en un baño de hielo seco/acetona, se añadieron 17 mL de una solución de n-butil litio en tetrahidrofurano 2.5 M (43 mmol) gota a gota y la solución se agitó durante 20 minutos a -78°C. Se burbujeó un exceso de dióxido de carbono en la solución agitada a una velocidad moderada durante 10 minutos. Después de la adición de dióxido de carbono, se dejó que la reacción alcanzara lentamente temperatura ambiente y se agitó durante toda la noche. La mezcla de reacción se repartió entre éter de dietilo (100 mL) y hidróxido de sodio acuoso 0.5 N (100 mL). La capa básica se separó y se acidificó con ácido clorhídrico concentrado hasta un pH de 2-3. La mezcla acuosa se extrajo con acetato de etilo (100 mL) y el extracto orgánico se lavó con agua y salmuera y se secó sobre sulfato de magnesio. El residuo aceitoso, que quedó después de evaporar el disolvente al vacío, se trituró hasta conseguir un sólido a partir de una pequeña cantidad de cloruro de n-butilo. Después de filtrar y secar, se obtuvo una muestra ligeramente impura de ácido 1-etil-3-trifluorometilpirazol-5-il carboxílico (1.4 g) en la forma de un sólido con un amplio rango de punto de fusión.

<sup>1</sup>H RMN (CDCl<sub>3</sub>): 9.85 (br s, 1H), 7.23 (s, 1H), 4.68 (q, 2H), 1.51 (t, 3H) ppm.

### Etapa B

#### Preparación de 2-[1-etil-3-trifluorometilpirazol-5-il carbamoil]-3-metil-N-(1-metiletil)benzamida

A una solución de ácido 1-etil-3-trifluorometilpirazol-5-il carboxílico (0.5 g, 2.4 mmol), agitando en 20 mL de cloruro de metileno, se añadió cloruro de oxalilo (1.2 mL, 14 mmol). Después de la adición de 2 gotas de N, N-dimetilformamida, hubo formación de espuma y burbujas. La mezcla de reacción se calentó a reflujo durante 1 hr en la forma de una solución de color amarillo. Después de dejar enfriar, el disolvente se eliminó al vacío y el residuo resultante se disolvió en 20 mL de tetrahidrofurano. A la disolución agitada, se añadió 2-amino-3-metil-N-(1-metiletil)

## ES 2 278 738 T3

benzamida (0.7 g, 3.6 mmol) seguido de la adición gota a gota de N,N-diisopropiletilamina (3 mL, 17 mmol). Después de agitar a temperatura ambiente durante toda la noche, la mezcla de reacción se repartió entre acetato de etilo (100 mL) y ácido clorhídrico acuoso 1N (75 mL). La capa orgánica separada se lavó con agua y salmuera y se secó sobre sulfato de magnesio. La evaporación al vacío dió un residuo sólido de color blanco, que después de su purificación por cromatografía de columna sobre gel de sílice (2:1 hexanos/acetato de etilo) dió 0.5 g del compuesto del título, un compuesto de la presente invención, que funde a 223-226°C.

$^1\text{H}$  RMN (DMSO- $\text{D}_6$ ): 10.15 (s, 1H), 8.05 (d, 1H), 7.45 (s, 1H), 7.43-7.25 (m, 3H), 4.58 (q, 2H), 3.97 (m, 1H), 2.45 (s, 3H), 1.36 (t, 3H), 1.06 (d, 6H) ppm.

### Ejemplo 3

#### Etapa A

#### Preparación de S,S-dimetil-N-[4-(trifluorometil)fenil]sulfilimina

Se añadió una solución de N-clorosuccinimida (12.43 g, 93.1 mmol) en ~170 mL de diclorometano a una mezcla de 4-(trifluorometil)anilina (15 g, 93.1 mmol) y sulfuro de dimetilo (6.35 g, 102 mmol) en 230 mL de diclorometano a -5-0°C. Una vez hubo finalizado la adición, la mezcla se agitó a 0-5°C durante 1h, y se añadió N-clorosuccinimida (0.02 g, 4.64 mmol). Después de otros 30 minutos, la mezcla se lavó con 500 mL de hidróxido de sodio 1N.

La fase orgánica se secó y se evaporó para dar el producto en la forma de un sólido 19-72 g que funde a 101-103°C (después de cristalizar desde acetato de etilo/hexanos).

IR (Nujol) 1603, 1562, 1532, 1502, 1428, 1402, 1335, 1300, 1270, 1185, 1150, 1103, 1067, 1000, 972, 940, 906, 837, 817  $\text{cm}^{-1}$ .

$^1\text{H}$  RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  7.35 (d, J=8.8 Hz, 2 H), 6.84 (d, J=8.8 Hz, 2 H), 2.67 (s, 3 H).

#### Etapa B

#### 2-[(metiltio)metil]-4-(trifluorometil)benzenamina

Se añadió metóxido de sodio en metanol (1.95 g, 9.02 mmol, 25%) a S,S-dimetil-N-[4-(trifluorometil)fenil]sulfilimina de la Etapa A (2 g, 9.04 mmol) en 15 mL de tolueno. La mezcla se calentó hasta -80°C durante ~1 h. La mezcla se dejó enfriar hasta 25 C y se vertió en 100 mL de agua. La mezcla se extrajo con 2x100 mL de acetato de etilo y los extractos combinados se secaron y se evaporaron para dar 1.8 g del producto en la forma de un sólido que funde a 65.5-67.5°C (después de cristalizar desde hexanos).

IR (nujol) 3419, 3333, 1629, 1584, 1512, 1440, 1334, 1302, 1235, 1193, 1139, 1098, 1078, 979, 904, 832  $\text{cm}^{-1}$ .

$^1\text{H}$  RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  7.35 (dd, J=1.5 Hz x 8.2 Hz, 1H) 6.72 (d, J=8.4 Hz) 4.39 (br. s, 2 H), 3.69 (s, 2 H), 1.99 (s, 3 H).

#### Etapa C

#### Preparación de 2-metil-4-(trifluorometil)benzenamina

Se añadió níquel Raney activado (500 g de pasta húmeda, ~50  $\mu$ ) se añadió en porciones a una solución de 2-[(metiltio)metil]-4-(trifluorometil) benzenamina (55.3 g, 0.25 moles) en 1 L de etanol durante 30 minutos a 25-30°C. La mezcla heterogénea se agitó vigorosamente durante 30 minutos después de la adición. Se detuvo la agitación, y se dejó que los sólidos se depositaran durante una hora. El líquido se decantó de los sólidos y se vertió a través de papel de filtro.

El filtrado se evaporó bajo presión reducida, y seguidamente el residuo se recogió en diclorometano. La fase orgánica se separó desde un volumen pequeño de agua, se secó sobre sulfato de magnesio y se evaporó bajo presión reducida para dar 37.6 g del compuesto del título en la forma de un aceite de color ámbar.

$^1\text{H}$  RMN ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  7.28 (m, 2H), 6.68 (d, 1H), 3.87 (br s, 2H), 2.19 (s, 3H).

#### Etapa D

#### Preparación de 2-metil-4-(trifluorometil)benzonitrilo

Se añadió ácido clorhídrico concentrado (16 mL) gota a gota a una velocidad moderada a una mezcla heterogénea de 2-metil-4-(trifluorometil)benzenamina (14 g, 80 mmol) y 120 mL de agua mientras se agitaba vigorosamente. Se obtuvo como resultado una suspensión espesa que se agitó durante 20 minutos, se diluyó con 280 mL de agua y se enfrió hasta 5°C. Se añadió lentamente una solución de nitrito de sodio (5.5 g, 80 mmol) y 25 mL de agua a

## ES 2 278 738 T3

la suspensión de reacción. Después de agitar durante 30 minutos a 5°C se obtuvo una solución que se agitó en frío durante otros 30 minutos y seguidamente se neutralizó con carbonato de potasio. Esta solución de sal de diazonio se añadió seguidamente en porciones a través de una cánula a una mezcla agitada a 95°C de cianuro de potasio (22 g, 0.34 moles), sulfato de cobre pentahidrato (20 g, 80 mmol) y 140 mL de agua. Después de la adición la mezcla se agitó durante 30 minutos a 95°C y seguidamente se dejó enfriar a temperatura ambiente.

Se añadió éter y la mezcla heterogénea se filtró a través de celite. La fase acuosa se extrajo con éter, y los extracto orgánicos combinados se secaron sobre sulfato de magnesio y se concentraron bajo presión reducida para dar 13.1 g del compuesto del título en la forma de un aceite de color marrón.

$^1\text{H RMN (CDCl}_3) \delta$  7.74 (d, 1H), 7.60 (s, 1H), 7.55 (d, 1H), 2.64 (s, 3H).

Etapa E

*Preparación del ácido 2-metil-4-trifluorometilbenzoico*

Se añadieron hidróxido de potasio (15.7 g, 0.28 moles) y 15 mL de agua en la forma de una solución, a una mezcla heterogénea agitada de 2-metil-4-(trifluorometil)benzonitrilo (13 g, 70 mmol) y 135 mL de etilenglicol. La mezcla de reacción se calentó a 120-130°C durante 20 horas y se dejó enfriar a temperatura ambiente. La solución oscura se vertió en 800 mL de agua y se filtró a través de celite. El filtrado se lavó con éter y seguidamente el extracto acuoso se acidificó con ácido clorhídrico concentrado. Esta fase acuosa se extrajo tres veces con acetato de etilo, los extractos orgánicos se combinaron, se secaron sobre sulfato de magnesio y se evaporaron bajo presión reducida para dar el compuesto del título en la forma de un sólido de color marrón claro.

$^1\text{H RMN (CDCl}_3) \delta$  7.98 (d, 1H), 7.70 (s, 1H), 7.65 (d, 1H), 2.60 (s, 3H).

Etapa F

*Preparación de cloruro de 2-metil-4-(trifluorometox)benzoílo*

Se añadió cloruro de tionilo (0.42 g, 3.5 mmol) a una solución del ácido benzoico de la Etapa E (0.50 g, 2.4 mmol) en 10 mL de tolueno a temperatura ambiente. La reacción se sometió a reflujo durante tres horas y seguidamente se dejó enfriar hasta temperatura ambiente. El disolvente se evaporó bajo presión reducida y el exceso de cloruro de tionilo se eliminó por destilación azeotrópica con tolueno. El cloruro de benzoílo obtenido se utilizó directamente en la Etapa G.

Etapa G

*Preparación de 2-metil-N-[2-metil-6-[(1-metiletil)amino]-carbonil]fenil]-4-(trifluorometil)benzamida*

El cloruro de benzoílo de la Etapa F (0.29 g, 1.3 mmol) se añadió a una mezcla de la anilina del Ejemplo 1, Etapa B (0.36 g, 1.9 mmol) y diisopropiltilamina (0.26 g, 2.0 mmol) en 10 mL de cloroformo a temperatura ambiente. La reacción se mantuvo bajo agitación durante toda la noche. El precipitado sólido se filtró y se secó para dar 0.38 g del compuesto del título, un compuesto de la presente invención, en la forma de un sólido que funde a 247-248°C.

$^1\text{H RMN (CDCl}_3) \alpha$  1.24 (d, 6H), 2.41 (s, 3H), 2.58 (s, 3H), 4.20 (m, 1H), 5.94 (br d, 1H), 7.2-7.3 (m, 2H), 7.40 (d, 1H), 7.52 (s, 1H), 7.53 (d, 1H), 7.70 (d, 1H), 9.36 (br s, 1H).

Ejemplo 4

Etapa A

*Preparación de cloruro de 2-metil-6-(trifluorometil)-3-piridincarbonilo*

Se añadió cloruro de tionilo (4.35 g, 36.5 mmol) a una mezcla de ácido 2-metil-6-trifluorometilnicotínico (5.00 g, 24.4 mmol) en 75 mL de tolueno y la mezcla se calentó a reflujo durante 3 horas. La reacción se dejó enfriar hasta temperatura ambiente y el disolvente se eliminó bajo presión reducida. El exceso de cloruro de tionilo se eliminó por destilación azeotrópica con tolueno. El cloruro de ácido resultante se utilizó directamente en el Ejemplo 4, Etapa B.

Etapa B

*Preparación de 8-metil-2-[2-metil-6-(trifluorometil)-3-piridinil]-4H-3,1-benzoxazina*

Una mezcla del anhídrido 6-metil isatoico (3.92 g, 22.1 mmol) y el cloruro de ácido de la Etapa A (5.45 g, 24.3 mmol) se calentó a reflujo en piridina durante 16 horas. La solución de color marrón oscuro se dejó enfriar hasta temperatura ambiente y el disolvente se eliminó bajo presión reducida. Se eliminó el exceso de piridina mediante destilación azeotrópica con tolueno. Se añadió éter y el sólido de color marrón resultante se eliminó mediante filtración. El sólido se recogió en una mezcla de bicarbonato de sodio acuoso y cloroformo, los extractos de cloroformo se

## ES 2 278 738 T3

secaron sobre sulfato de magnesio y se evaporaron. El exceso de piridina se eliminó nuevamente mediante destilación azeotrópica con tolueno para dar 5.1 g del compuesto del título en la forma de un sólido de color marrón.

<sup>1</sup>H RMN (CDCl<sub>3</sub>) δ 2.65 (s, 3H), 3.11 (s, 3H), 7.49 (t, 1H) 7.40 (m, 1H), 7.68-7.73 (m, 2H), 1.11 (d, 1H), 8.58 (d, 1H).

### Etapa C

#### *Preparación de 2-metil-N-[2-metil-6-[(1-metiletil)amino]carbonil]fenil]-6-(trifluorometil)-3-piridina*

Se añadió isopropilamina (7.37 g, 0.125 mmol) a una mezcla de la benzoxazinona de la Etapa B (4.00 g, 12.5 mmol) en 30 mL de tetrahidrofurano. Se formó una solución homogénea. La mezcla se calentó brevemente, después de lo cual se formó un grueso precipitado de color blanco. El disolvente se eliminó bajo presión reducida y el sólido resultante se lavó con éter y se filtró para dar 4.48 g del compuesto del título en la forma de un sólido que funde a 247-248°C.

<sup>1</sup>H RMN (CDCl<sub>3</sub>) δ 1.24 (d, 6H), 2.41 (s, 3H), 2.77 (s, 3H), 4.17 (m, 1H), 5.96 (bd, 1H), 7.21 (m, 2H) 7.40 (m, 1H), 7.53 (d, 1H), 7.97 (d, 1H), 9.80 (bs, 1H).

### Ejemplo 5

#### Etapa A

#### *Preparación de 4-Metil-N-[2-metil-6-[(1-metiletil(amino)carbonil]fenil]-2-(trifluorometil)-5 pirimidincarboxamida*

A una solución de 0.8 g (4 mmol) de ácido 4-metil-2-trifluorometilpirimidina-5-carboxílico [fabricado mediante el método de Palanki *et al.*, J. Med. Chem. 2000, 43, 3995], mientras se agitaba en 15 mL de cloruro de metileno, se añadió cloruro de oxalilo (2 mL, 23 mmol). Después de la adición de 2 gotas de N,N-dimetilformamida, se formó espuma y burbujas. La mezcla de reacción se calentó a reflujo durante 1 hr en la forma de una solución de color amarillo. Después de dejar enfriar, el disolvente se eliminó al vacío y el residuo resultante se disolvió en 20 mL de tetrahidrofurano. A la disolución agitada, se añadió 2-amino-3-metil-N-(1-metiletil)benzamida (1 g, 5 mmol) seguido de la adición gota a gota de N,N-diisopropiletilamina (3 ml, 17 mmol). Después de agitar a temperatura ambiente durante toda la noche, la mezcla de reacción se repartió entre acetato de etilo (200 mL) y ácido clorhídrico acuoso 1N (75 mL). La capa orgánica separada se lavó con agua y salmuera y se secó sobre sulfato de magnesio. La evaporación al vacío dió un sólido de color blanco, que se suspendió en una pequeña cantidad de acetato de etilo y se filtró para dar (después del secado) 650 mg del compuesto del título, un compuesto de la presente invención, que funde a 248-251°C.

<sup>1</sup>H RMN (DMSO-D<sub>6</sub>): 10.3 (s, NH), 9.07 (s, 1H), 8.25 (d, NH), 7.43-7.25 (m, 3H), 4.03 (m, 1H), 2.73 (s, 3H), 2.32 (s, 3H), 1.12 (d, 6H) ppm.

### Ejemplo 6

#### Etapa A

#### *Preparación de 2-metil-1-fenil-4-(trifluorometil)-1H-pirazol*

Una solución de 1,1,1-trifluoropentano-2,4-diona (20.0 g, 0.130 moles) en ácido acético glacial (60 mL) se enfrió hasta 7°C utilizando un baño de hielo/agua. Se añadió fenilhidrazina (14.1 g, 0.130 mole) gota a gota durante un período de 60 minutos. La temperatura de la masa de reacción aumentó hasta 15°C durante la adición. La solución de color naranja resultante se mantuvo a condiciones ambiente durante 60 minutos. La masa de ácido acético se eliminó en un rotavapor con una temperatura del baño de 65°C. El residuo se disolvió en cloruro de metileno (150 mL). La solución se lavó con bicarbonato sódico acuoso (3 g en 50 mL de agua).

La capa orgánica de color rojo púrpura se separó, se trató con carbón activado (2 g) y MgSO<sub>4</sub>, y a continuación se filtró. Los volátiles se eliminaron en un rotavapor. El producto crudo consistió en 28.0 g de un aceite de color rosa, que contenía un ~89% del producto deseado y un 11% de 1-fenil-5-(trifluorometil)-3-metilpirazol.

<sup>1</sup>H RMN (DMSO-D<sub>6</sub>) δ 2.35 (s, 3H), 6.76 (s, 1H), 7.6-7.5 (m, 5H).

#### Etapa B

#### *Preparación de ácido 1-fenil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-carboxílico*

Una muestra del 1-fenil-3-(trifluorometil)-5-metilpirazol crudo (~89%, 50.0 g, 0.221 moles) se mezcló con agua (400 mL) y cloruro de cetiltrimetilamonio (4.00 g, 0.011 moles). La mezcla se calentó hasta 95°C. Se añadió permanganato de potasio en 10 porciones iguales, en intervalos de ~8 minutos. La masa de reacción se mantuvo a 95-100°C durante este período. Una vez se hubo añadido la última porción, la mezcla se mantuvo durante ~15 minutos a

## ES 2 278 738 T3

95-100°C, después de lo cual desapareció el color púrpura del permangantato. La masa de reacción se filtró en caliente (~75°C) a través de un lecho de Celite® de 1 cm de grosor en un filtro de virio poroso de 150 ml. El material filtrado se lavó con agua templada (~50°C) (3x100 mL).

5 Los filtrados y lavados combinados se extrajeron con éter (2x100 mL) para eliminar una pequeña cantidad de material insoluble de color amarillo. La capa acuosa se purgó con nitrógeno para eliminar el éter residual. La solución alcalina transparente e incolora se acidificó mediante la adición de ácido clorhídrico concentrado gota a gota hasta que el pH alcanzó un valor de ~1.3 (28 g, 0.28 moles). La formación de gas fue vigorosa durante los primeros dos tercios de la adición. El producto se recogió por filtración, se lavó con agua (3x40 mL), y a continuación se secó durante toda la noche a 55°C en vacío. El producto consistió en 11.7 g de un polvo cristalino de color blanco, que era esencialmente puro en base al <sup>1</sup>H RMN.

<sup>1</sup>H RMN (CDCl<sub>3</sub>) δ 7.33 (s, 1H), 7.4-7.5 (m, 5H).

15 Etapa C

### *Preparación de cloruro de 1-fenil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-carbonilo*

20 Una muestra de ácido 1-fenil-3-(trifluorometil)pirazol-5-carboxílico crudo (4.13 g, 16.1 mmol) se disolvió en cloruro de metileno (45 mL). La solución se trató con cloruro de oxalilo (1.80 mL, 20.6 mmol), seguido de N,N-dimetilformamida (0.010 mL, 0.13 mmol). Poco después de la adición del catalizador N,N-dimetilformamida empezó la formación de gas. La mezcla de reacción se agitó durante ~20 minutos bajo condiciones ambiente, seguidamente se calentó hasta reflujo durante un período de 35 minutos. Los volátiles se eliminaron de la mezcla de reacción en un rotavapor con una temperatura del baño de 55°C. El producto consistió en 4.43 g de un aceite de color amarillo claro.

25 La única impureza observada a través de <sup>1</sup>H RMN fue la N,N-dimetilformamida.

<sup>1</sup>H RMN (CDCl<sub>3</sub>) δ 7.40 (m, 1H), 7.42 (s, 1H), 7.50-7.53 (m, 4H).

Etapa D

30 *Preparación de N-[2-metil-6-[(1-metiletil)amino]carbonil]fenil]-1-fenil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-carboxamida*

35 Una muestra de anhídrido 3-metil isatoico (0.30 g, 1.7 mmol) parcialmente disuelto en piridina (4.0 mL) se trató con cloruro de 1-fenil-3-(trifluorometil)pirazol-5-carboxilo (0.55 g, 1.9 mmol). La mezcla se calentó hasta ~95°C durante un período de 2 horas. La solución de color naranja resultante se enfrió hasta 29°C, y seguidamente se trató con isopropilamina (1.00 g, 16.9 mmol). La masa de reacción se calentó por sí sola hasta 39°C. A continuación se calentó de forma adicional hasta 55°C durante un período de 30 minutos, después de lo cual se formó un abundante precipitado. La masa de reacción se disolvió en cloruro de metileno (150 mL). La solución se lavó con ácido acuoso (5 mL de HCl concentrado en 45 mL de agua), y a continuación con base acuosa (2 g de carbonato de sodio en 50 mL de agua). La capa orgánica se secó sobre MgSO<sub>4</sub>, se filtró, y a continuación se concentró en un rotavapor.

45 Después de su reducción hasta ~4 mL, se formaron cristales del producto. La pasta se disolvió con ~10 mL de éter, después de lo cual precipitó más producto. El producto se aisló por filtración, se lavó con éter (2x10 mL), y a continuación se lavó con agua (2x50 mL). La pasta húmeda se secó durante 30 minutos a 70°C al vacío. El producto consistió en 0.52 g de un polvo blanquecino que funde a 260-262°C.

<sup>1</sup>H RMN (DMSO-D<sub>6</sub>) δ 1.07 (d, 6H), 2.21 (s, 3H), 4.02 (octete, 1H), 7.2-7.4 (m, 3H), 7.45-7.6 (m, 6H), 8.10 (d, 1H), 10.31 (s, 1H).

50 Ejemplo 7

Etapa A

55 *Preparación de 3-trifluorometil-2-[3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]piridina*

Una mezcla de 2-cloro-3-trifluorometilpiridina (3.62 g., 21 mmol), trifluorometilpirazol (2.7 g., 20 mmol), y carbonato de potasio (6.0 g., 43 mmol) se calentó a 100°C durante 18 h. La mezcla de reacción enfriada se añadió a hielo/agua (100 mL).

60 La mezcla se extrajo dos veces con éter (100 mL) y los extractos de éter combinados se lavaron dos veces con agua (100 mL). La capa orgánica se secó con sulfato de magnesio y se concentró hasta obtener un aceite. Cromatografía sobre gel de sílice con hexanos:acetato de etilo de 8:1 a 4:1 como eluyente dió el compuesto del título (3.5 g) en la forma de un aceite.

65 <sup>1</sup>H RMN (CDCl<sub>3</sub>) δ 6.75 (m, 1H), 7.5 (m, 1H), 8.2 (m, 2H), 8.7 (m, 1H).

## ES 2 278 738 T3

### Paso B

#### Preparación de ácido 3-(trifluorometil)-1-[3-(trifluorometil)-2-piridinil]-1 pirazol-5-carboxílico

5 Una mezcla del compuesto del título del Ejemplo 5, Paso A (3.4 g, 13 mmol) se disolvió en tetrahidrofurano (30 mL) y se enfrió hasta  $-70^{\circ}\text{C}$ . Se añadió diisopropilamida de litio (2N en heptano/tetrahidrofurano, (Aldrich) 9.5 mL, 19 mmol) y la mezcla de color oscuro resultante se agitó durante 10 minutos. Se burbujeó dióxido de carbono seco a través de la mezcla durante 15 minutos. La mezcla se dejó calentar hasta  $23^{\circ}\text{C}$  y se trató con agua (50 mL) e hidróxido de sodio 1 N (10 mL). La mezcla acuosa se extrajo con éter (100 mL) y a continuación con acetato de etilo (100 mL).  
 10 La capa acuosa se acidificó con ácido clorhídrico 6N hasta un pH de 1-2 y se extrajo dos veces con diclorometano. La capa orgánica se secó con sulfato de magnesio y se concentró para dar el compuesto del título (1.5 g).  $^1\text{H RMN}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  7.6 (m, 1H), 7.95 (m, 1H), 8.56 (m, 1H), 8.9 (m, 1H), 14.2(br, 1H)

### Paso C

15 *Preparación de N-[2-metil-6-[(1-metiletil)amino]carbonil]fenil]-3-(trifluorometil)-1-[3-(trifluorometil)-2-piridinil]-1H-pirazol-5-carboxamida*

20 Una mezcla del compuesto del título del Ejemplo 5, Paso B (0.54 g, 1.1 mmol), el compuesto del título del Ejemplo 1, Paso B (0.44 g, 2.4 mmol) y cloruro de BOP (cloruro de bis(2-oxo-oxazolidinil)fosfinilo, 0.54 g, 2.1 mmol) en acetonitrilo (13 ml) se trató con trietilamina (0.9 ml). La mezcla se agitó en un vial de centelleo cerrado durante 18 h. La reacción se repartió entre acetato de etilo (100 mL) y ácido clorhídrico 1N. La capa de acetato de etilo se lavó de forma sucesiva con ácido clorhídrico 1N (50 mL), hidróxido sódico 1N (50 mL) y una solución saturada de cloruro sódico (50 mL). La capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio y se concentró. El residuo se sometió a cromatografía de columna sobre gel de sílice con hexanos/acetato de etilo (5:1 a 3:1) como eluyente. Se aisló el compuesto del título (0.43 g) en la forma de un sólido de color blanco de punto de fusión  $227-230^{\circ}\text{C}$ .  $^1\text{H RMN}$  ( $\text{CDCl}_3$ )  $\delta$  1.2 (m, 6H), 4.15 (m, 1H), 5.9 (br d, 1H), 7.1 (m, 1H), 7.2 (m, 2H), 7.4 (s, 1H), 7.6 (m, 1H), 8.15 (m, 1H), 8.74 (m, 1H), 10.4 (br, 1H).

30 Mediante los procedimientos aquí descritos, juntamente con los métodos conocidos en el campo de la técnica, se pueden preparar los siguientes compuestos de las Tablas 1 a 17. En las Tablas se utilizan las siguientes abreviaturas: t es terciario, s es secundario, n es normal, i es iso, c es ciclo, Me es metilo, Et es etilo, Pr es propilo, i-Pr es isopropilo, t-Bu es tert butilo, Ph es fenilo, OMe es metoxi, OEt es etoxi, SMe es metiltio, SEt es etiltio, CN es ciano,  $\text{NO}_2$  es nitro, TMS es trimetilsilil, S(O)Me es metilsulfinil, y S(O)<sub>2</sub>Me es metilsulfonil.

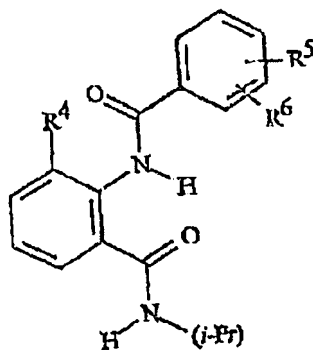
35

TABLA 1

40

45

50



55

60

65

R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup> y R <sup>6</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup> y R <sup>6</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup> y R <sup>6</sup>
Me	2-CF <sub>3</sub>	Me	3-CF <sub>3</sub>	Me	4-CF <sub>3</sub>
Me	2-OCF <sub>3</sub>	Me	3-OCF <sub>3</sub>	Me	4-OCF <sub>3</sub>
Me	2-OCF <sub>2</sub> H	Me	3-OCF <sub>2</sub> H	Me	4-OCF <sub>2</sub> H
Me	2-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me	3-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me	4-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H
Me	2-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me	3-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me	4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	2-SCF <sub>3</sub>	Me	3-SCF <sub>3</sub>	Me	4-SCF <sub>3</sub>
Me	2-SOCF <sub>3</sub>	Me	3-SOCF <sub>3</sub>	Me	4-SOCF <sub>3</sub>

ES 2 278 738 T3

	Me	2-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me	3-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me	4-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
5	Me	2-SCF <sub>2</sub> H	Me	3-SCF <sub>2</sub> H	Me	4-SCF <sub>2</sub> H
	Me	2-SOCF <sub>2</sub> H	Me	3-SOCF <sub>2</sub> H	Me	4-SOCF <sub>2</sub> H
	Me	2-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me	3-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me	4-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H
10	Cl	2-CF <sub>3</sub>	Cl	3-CF <sub>3</sub>	Cl	4-CF <sub>3</sub>
	Cl	2-OCF <sub>3</sub>	Cl	3-OCF <sub>3</sub>	Cl	4-OCF <sub>3</sub>
	Cl	2-OCF <sub>2</sub> H	Cl	3-OCF <sub>2</sub> H	Cl	4-OCF <sub>2</sub> H
15	Cl	2-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Cl	3-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Cl	4-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H
	Cl	2-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Cl	3-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Cl	4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
	Cl	2-SCF <sub>3</sub>	Cl	3-SCF <sub>3</sub>	Cl	4-SCF <sub>3</sub>
20	Cl	2-SOCF <sub>3</sub>	Cl	3-SOCF <sub>3</sub>	Cl	4-SOCF <sub>3</sub>
	Cl	2-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Cl	3-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Cl	4-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
	Cl	2-SCF <sub>2</sub> H	Cl	3-SCF <sub>2</sub> H	Cl	4-SCF <sub>2</sub> H
25	Cl	2-SOCF <sub>2</sub> H	Cl	3-SOCF <sub>2</sub> H	Cl	4-SOCF <sub>2</sub> H
	Cl	2-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Cl	3-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Cl	4-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H
30	F	2-CF <sub>3</sub>	F	3-CF <sub>3</sub>	F	4-CF <sub>3</sub>
	F	2-OCF <sub>3</sub>	F	3-OCF <sub>3</sub>	F	4-OCF <sub>3</sub>
	F	2-OCF <sub>2</sub> H	F	3-OCF <sub>2</sub> H	F	4-OCF <sub>2</sub> H
35	F	2-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	F	3-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	F	4-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H
	F	2-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	F	3-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	F	4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
	F	2-SCF <sub>3</sub>	F	3-SCF <sub>3</sub>	F	4-SCF <sub>3</sub>
40	F	2-SOCF <sub>3</sub>	F	3-SOCF <sub>3</sub>	F	4-SOCF <sub>3</sub>
	F	2-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	F	3-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	F	4-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
	F	2-SCF <sub>2</sub> H	F	3-SCF <sub>2</sub> H	F	4-SCF <sub>2</sub> H
45	F	2-SOCF <sub>2</sub> H	F	3-SOCF <sub>2</sub> H	F	4-SOCF <sub>2</sub> H
	F	2-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	F	3-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	F	4-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H
50	Br	2-CF <sub>3</sub>	Br	3-CF <sub>3</sub>	Br	4-CF <sub>3</sub>
	Br	2-OCF <sub>3</sub>	Br	3-OCF <sub>3</sub>	Br	4-OCF <sub>3</sub>
	Br	2-OCF <sub>2</sub> H	Br	3-OCF <sub>2</sub> H	Br	4-OCF <sub>2</sub> H
55	Br	2-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Br	3-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Br	4-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H
	Br	2-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Br	3-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Br	4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
	Br	2-SCF <sub>3</sub>	Br	3-SCF <sub>3</sub>	Br	4-SCF <sub>3</sub>
60	Br	2-SOCF <sub>3</sub>	Br	3-SOCF <sub>3</sub>	Br	4-SOCF <sub>3</sub>
	Br	2-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Br	3-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Br	4-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
	Br	2-SCF <sub>2</sub> H	Br	3-SCF <sub>2</sub> H	Br	4-SCF <sub>2</sub> H
65						



ES 2 278 738 T3

	Br	2-SOCF <sub>2</sub> H	Br	3-SOCF <sub>2</sub> H	Br	4-SOCF <sub>2</sub> H
5	Br	2-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Br	3-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Br	4-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H
	Br	2-CF <sub>3</sub>	I	3-CF <sub>3</sub>	I	4-CF <sub>3</sub>
	I	2-OCF <sub>3</sub>	I	3-OCF <sub>3</sub>	I	4-OCF <sub>3</sub>
10	I	2-OCF <sub>2</sub> H	I	3-OCF <sub>2</sub> H	I	4-OCF <sub>2</sub> H
	I	2-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	I	3-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	I	4-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H
	I	2-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	I	3-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	I	4-OCH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>
15	I	2-SCF <sub>3</sub>	I	3-SCF <sub>3</sub>	I	4-SCF <sub>3</sub>
	I	2-SOCF <sub>3</sub>	I	3-SOCF <sub>3</sub>	I	4-SOCF <sub>3</sub>
	I	2-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	I	3-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	I	4-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
20	I	2-SCF <sub>2</sub> H	I	3-SCF <sub>2</sub> H	I	4-SCF <sub>2</sub> H
	I	2-SOCF <sub>2</sub> H	I	3-SOCF <sub>2</sub> H	I	4-SOCF <sub>2</sub> H
	I	2-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	I	3-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	I	4-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H
25	OMe	2-CF <sub>3</sub>	OMe	3-CF <sub>3</sub>	OMe	4-CF <sub>3</sub>
	OMe	2-OCF <sub>3</sub>	OMe	3-OCF <sub>3</sub>	OMe	4-OCF <sub>3</sub>
	OMe	2-OCF <sub>2</sub> H	OMe	3-OCF <sub>2</sub> H	OMe	4-OCF <sub>2</sub> H
30	OMe	2-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	OMe	3-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	OMe	4-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H
	OMe	2-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	OMe	3-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	OMe	4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
35	OMe	2-SCF <sub>3</sub>	OMe	3-SCF <sub>3</sub>	OMe	4-SCF <sub>3</sub>
	OMe	2-SOCF <sub>3</sub>	OMe	3-SOCF <sub>3</sub>	OMe	4-SOCF <sub>3</sub>
	OMe	2-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	OMe	3-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	OMe	4-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
40	OMe	2-SCF <sub>2</sub> H	OMe	3-SCF <sub>2</sub> H	OMe	4-SCF <sub>2</sub> H
	OMe	2-SOCF <sub>2</sub> H	OMe	3-SOCF <sub>2</sub> H	OMe	4-SOCF <sub>2</sub> H
	OMe	2-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	OMe	3-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	OMe	4-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H
45	CF <sub>3</sub>	2-CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	3-CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub>
	CF <sub>3</sub>	2-OCF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	3-OCF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	4-OCF <sub>3</sub>
	CF <sub>3</sub>	2-OCF <sub>2</sub> H	CF <sub>3</sub>	3-OCF <sub>2</sub> H	CF <sub>3</sub>	4-OCF <sub>2</sub> H
50	CF <sub>3</sub>	2-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	CF <sub>3</sub>	3-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	CF <sub>3</sub>	4-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H
	CF <sub>3</sub>	2-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	3-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
55	CF <sub>3</sub>	2-SCF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	3-SCF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	4-SCF <sub>3</sub>
	CF <sub>3</sub>	2-SOCF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	3-SOCF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	4-SOCF <sub>3</sub>
	CF <sub>3</sub>	2-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	3-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	4-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
60	CF <sub>3</sub>	2-SCF <sub>2</sub> H	CF <sub>3</sub>	3-SCF <sub>2</sub> H	CF <sub>3</sub>	4-SCF <sub>2</sub> H
	CF <sub>3</sub>	2-SOCF <sub>2</sub> H	CF <sub>3</sub>	3-SOCF <sub>2</sub> H	CF <sub>3</sub>	4-SOCF <sub>2</sub> H
	CF <sub>3</sub>	2-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	CF <sub>3</sub>	3-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	CF <sub>3</sub>	4-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H

65

ES 2 278 738 T3

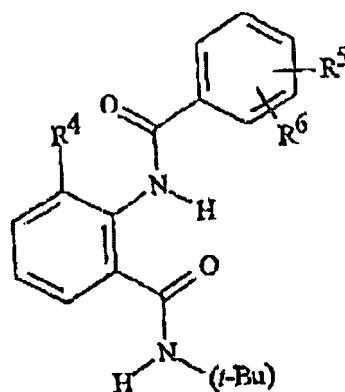
	OCF <sub>2</sub> H	2-CF <sub>3</sub>	OCF <sub>2</sub> H	3-CF <sub>3</sub>	OCF <sub>2</sub> H	4-CF <sub>3</sub>
5	OCF <sub>2</sub> H	2-OCF <sub>3</sub>	OCF <sub>2</sub> H	3-OCF <sub>3</sub>	OCF <sub>2</sub> H	4-OCF <sub>3</sub>
	OCF <sub>2</sub> H	2-OCF <sub>2</sub> H	OCF <sub>2</sub> H	3-OCF <sub>2</sub> H	OCF <sub>2</sub> H	4-OCF <sub>2</sub> H
	OCF <sub>2</sub> H	2-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	OCF <sub>2</sub> H	3-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	OCF <sub>2</sub> H	4-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H
10	OCF <sub>2</sub> H	2-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	OCF <sub>2</sub> H	3-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	OCF <sub>2</sub> H	4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
	OCF <sub>2</sub> H	2-SCF <sub>3</sub>	OCF <sub>2</sub> H	3-SCF <sub>3</sub>	OCF <sub>2</sub> H	4-SCF <sub>3</sub>
	OCF <sub>2</sub> H	2-SOCF <sub>3</sub>	OCFH	3-SOCF <sub>3</sub>	OCF <sub>2</sub> H	4-SOCF <sub>3</sub>
15	OCF <sub>2</sub> H	2-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	OCF <sub>2</sub> H	3-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	OCF <sub>2</sub> H	4-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
	OCF <sub>2</sub> H	2-SCF <sub>2</sub> H	OCF <sub>2</sub> H	3-SCF <sub>2</sub> H	OCF <sub>2</sub> H	4-SCF <sub>2</sub> H
	OCF <sub>2</sub> H	2-SOCF <sub>2</sub> H	OCF <sub>2</sub> H	3-SOCF <sub>2</sub> H	OCF <sub>2</sub> H	4-SOCF <sub>2</sub> H
20	OCF <sub>2</sub> H	2-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	OCF <sub>2</sub> H	3-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	OCF <sub>2</sub> H	4-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H
	Me	2-Me-4-CF <sub>3</sub>	F	2-Me-4-CF <sub>3</sub>	Cl	2-Me-4-CF <sub>3</sub>
	Me	2-Me-4-OCF <sub>3</sub>	F	2-Me-4-OCF <sub>3</sub>	Cl	2-Me-4-OCF <sub>3</sub>
25	Me	2-Me-4-OCF <sub>2</sub> H	F	2-Me-4-OCF <sub>2</sub> H	Cl	2-Me-4-OCF <sub>2</sub> H
	Me	2-Me-4- OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	F	2-Me-4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Cl	2-Me-4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
30	Me	2-Me-4-SCF <sub>3</sub>	F	2-Me-4-SCF <sub>3</sub>	Cl	2-Me-4-SCF <sub>3</sub>
	Me	2-Me-4-SOCF <sub>3</sub>	F	2-Me-4-SOCF <sub>3</sub>	Cl	2-Me-4-SOCF <sub>3</sub>
35	Me	2-Me-4-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	F	2-Me-4-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Cl	2-Me-4-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
	Me	2-Me-4-SCF <sub>2</sub> H	F	2-Me-4-SCF <sub>2</sub> H	Cl	2-Me-4-SCF <sub>2</sub> H
40	Me	2-Me-4- SOCF <sub>2</sub> H	F	2-Me-4-SOCF <sub>2</sub> H	Cl	2-Me-4-SOCF <sub>2</sub> H
	Me	2-Me-4- SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	F	2-Me-4-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Cl	2-Me-4-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H
45	Br	2-Me-4-CF <sub>3</sub>	I	2-Me-4-CF <sub>3</sub>	OMe	2-Me-4-CF <sub>3</sub>
	Br	2-Me-4-OCF <sub>3</sub>	I	2-Me-4-OCF <sub>3</sub>	OMe	2-Me-4-OCF <sub>3</sub>
	Br	2-Me-4-OCF <sub>2</sub> H	I	2-Me-4-OCF <sub>2</sub> H	OMe	2-Me-4-OCF <sub>2</sub> H
50	Br	2-Me-4- OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	I	2-Me-4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	OMe	2-Me-4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
	Br	2-Me-4-SCF <sub>3</sub>	I	2-Me-4-SCF <sub>3</sub>	OMe	2-Me-4-SCF <sub>3</sub>
55	Br	2-Me-4-SOCF <sub>3</sub>	I	2-Me-4-SOCF <sub>3</sub>	OMe	2-Me-4-SOCF <sub>3</sub>
	Br	2-Me-4-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	I	2-Me-4-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	OMe	2-Me-4-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
60	Br	2-Me-4-SCF <sub>2</sub> H	I	2-Me-4-SCF <sub>2</sub> H	OMe	2-Me-4-SCF <sub>2</sub> H
	Br	2-Me-4- SOCF <sub>2</sub> H	I	2-Me-4-SOCF <sub>2</sub> H	OMe	2-Me-4-SOCF <sub>2</sub> H

65

ES 2 278 738 T3

	2-Me-4-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	I	2-Me-4-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	OMe	2-Me-4-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H
5	CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	2-Me-4-CF <sub>3</sub>	SMe	2-Me-4-CF <sub>3</sub>
	2-Me-4-OCF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	2-Me-4-OCF <sub>3</sub>	SMe	2-Me-4-OCF <sub>3</sub>
	2-Me-4-OCF <sub>2</sub> H	NO <sub>2</sub>	2-Me-4-OCF <sub>2</sub> H	SMe	2-Me-4-OCF <sub>2</sub> H
10	2-Me-4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	2-Me-4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	SMe	2-Me-4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
	2-Me-4-SCF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	2-Me-4-SCF <sub>3</sub>	SMe	2-Me-4-SCF <sub>3</sub>
15	2-Me-4-SOCF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	2-Me-4-SOCF <sub>3</sub>	SMe	2-Me-4-SOCF <sub>3</sub>
	2-Me-4-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	2-Me-4-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	SMe	2-Me-4-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
	2-Me-4-SCF <sub>2</sub> H	NO <sub>2</sub>	2-Me-4-SCF <sub>2</sub> H	SMe	2-Me-4-SCF <sub>2</sub> H
20	2-Me-4-SOCF <sub>2</sub> H	NO <sub>2</sub>	2-Me-4-SOCF <sub>2</sub> H	SMe	2-Me-4-SOCF <sub>2</sub> H
	2-Me-4-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	NO <sub>2</sub>	2-Me-4-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	SMe	2-Me-4-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H
25	2-Me-4-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	NO <sub>2</sub>	2-Me-4-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	SMe	2-Me-4-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H

TABLA 2



R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup> y R <sup>6</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup> y R <sup>6</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup> y R <sup>6</sup>
Me	2-CF <sub>3</sub>	Me	3-CF <sub>3</sub>	Me	4-CF <sub>3</sub>
Me	2-OCF <sub>3</sub>	Me	3-OCF <sub>3</sub>	Me	4-OCF <sub>3</sub>
Me	2-OCF <sub>2</sub> H	Me	3-OCF <sub>2</sub> H	Me	4-OCF <sub>2</sub> H
Me	2-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me	3-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me	4-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H
Me	2-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me	3-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me	4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	2-SCF <sub>3</sub>	Me	3-SCF <sub>3</sub>	Me	4-SCF <sub>3</sub>
Me	2-SOCF <sub>3</sub>	Me	3-SOCF <sub>3</sub>	Me	4-SOCF <sub>3</sub>
Me	2-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me	3-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me	4-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	2-SCF <sub>2</sub> H	Me	3-SCF <sub>2</sub> H	Me	4-SCF <sub>2</sub> H
Me	2-SOCF <sub>2</sub> H	Me	3-SOCF <sub>2</sub> H	Me	4-SOCF <sub>2</sub> H

## ES 2 278 738 T3

	Me	2-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me	3-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me	4-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H
5	Cl	2-CF <sub>3</sub>	Cl	3-CF <sub>3</sub>	Cl	4-CF <sub>3</sub>
	Cl	2-OCF <sub>3</sub>	Cl	3-OCF <sub>3</sub>	Cl	4-OCF <sub>3</sub>
	Cl	2-OCF <sub>2</sub> H	Cl	3-OCF <sub>2</sub> H	Cl	4-OCF <sub>2</sub> H
10	Cl	2-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Cl	3-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Cl	4-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H
	Cl	2-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Cl	3-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Cl	4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
	Cl	2-SCF <sub>3</sub>	Cl	3-SCF <sub>3</sub>	Cl	4-SCF <sub>3</sub>
15	Cl	2-SOCF <sub>3</sub>	Cl	3-SOCF <sub>3</sub>	Cl	4-SOCF <sub>3</sub>
	Cl	2-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Cl	3-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Cl	4-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
20	Cl	2-SCF <sub>2</sub> H	Cl	3-SCF <sub>2</sub> H	Cl	4-SCF <sub>2</sub> H
	Cl	2-SOCF <sub>2</sub> H	Cl	3-SOCF <sub>2</sub> H	Cl	4-SOCF <sub>2</sub> H
	Cl	2-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Cl	3-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Cl	4-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H
25	F	2-CF <sub>3</sub>	F	3-CF <sub>3</sub>	F	4-CF <sub>3</sub>
	F	2-OCF <sub>3</sub>	F	3-OCF <sub>3</sub>	F	4-OCF <sub>3</sub>
	F	2-OCF <sub>2</sub> H	F	3-OCF <sub>2</sub> H	F	4-OCF <sub>2</sub> H
30	F	2-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	F	3-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	F	4-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H
	F	2-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	F	3-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	F	4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
	F	2-SCF <sub>3</sub>	F	3-SCF <sub>3</sub>	F	4-SCF <sub>3</sub>
35	F	2-SOCF <sub>3</sub>	F	3-SOCF <sub>3</sub>	F	4-SOCF <sub>4</sub>
	F	2-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	F	3-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	F	4-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
40	F	2-SCF <sub>2</sub> H	F	3-SCF <sub>2</sub> H	F	4-SCF <sub>2</sub> H
	F	2-SOCF <sub>2</sub> H	F	3-SOCF <sub>2</sub> H	F	4-SOCF <sub>2</sub> H
	F	2-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	F	3-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	F	4-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H
45	Br	2-CF <sub>3</sub>	Br	3-CF <sub>3</sub>	Br	4-CF <sub>3</sub>
	Br	2-OCF <sub>3</sub>	Br	3-OCF <sub>3</sub>	Br	4-OCF <sub>3</sub>
	Br	2-OCF <sub>2</sub> H	Br	3-OCF <sub>2</sub> H	Br	4-OCF <sub>2</sub> H
50	Br	2-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Br	3-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Br	4-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H
	Br	2-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Br	3-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Br	4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
	Br	2-SCF <sub>3</sub>	Br	3-SCF <sub>3</sub>	Br	4-SCF <sub>3</sub>
	Br	2-SOCF <sub>3</sub>	Br	3-SOCF <sub>3</sub>	Br	4-SOCF <sub>3</sub>
	Br	2-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Br	3-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Br	4-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
60	Br	2-SCF <sub>2</sub> H	Br	3-SCF <sub>2</sub> H	Br	4-SCF <sub>2</sub> H
	Br	2-SOCF <sub>2</sub> H	Br	3-SOCF <sub>2</sub> H	Br	4-SOCF <sub>2</sub> H
	Br	2-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Br	3-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Br	4-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H
65	I	2-CF <sub>3</sub>	I	3-CF <sub>3</sub>	I	4-CF <sub>3</sub>

ES 2 278 738 T3

5	I	2-OCF <sub>3</sub>	I	3-OCF <sub>3</sub>	I	4-OCF <sub>3</sub>
	I	2-OCF <sub>2</sub> H	I	3-OCF <sub>2</sub> H	I	4-OCF <sub>2</sub> H
	I	2-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	I	3-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	I	4-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H
	I	2-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	I	3-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	I	4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
10	I	2-SCF <sub>3</sub>	I	3-SCF <sub>3</sub>	I	4-SCF <sub>3</sub>
	I	2-SOCF <sub>3</sub>	I	3-SOCF <sub>3</sub>	I	4-SOCF <sub>3</sub>
	I	2-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	I	3-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	I	4-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
15	I	2-SCF <sub>2</sub> H	I	3-SCF <sub>2</sub> H	I	4-SCF <sub>2</sub> H
	I	2-SOCF <sub>2</sub> H	I	3-SOCF <sub>2</sub> H	I	4-SOCF <sub>2</sub> H
	I	2-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	I	3-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	I	4-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H
20	OMe	2-CF <sub>3</sub>	OMe	3-CF <sub>3</sub>	OMe	4-CF <sub>3</sub>
	OMe	2-OCF <sub>3</sub>	OMe	3-OCF <sub>3</sub>	OMe	4-OCF <sub>3</sub>
25	OMe	2-OCF <sub>2</sub> H	OMe	3-OCF <sub>2</sub> H	OMe	4-OCF <sub>2</sub> H
	OMe	2-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	OMe	3-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	OMe	4-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H
	OMe	2-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	OMe	3-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	OMe	4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
30	OMe	2-SCF <sub>3</sub>	OMe	3-SCF <sub>3</sub>	OMe	4-SCF <sub>3</sub>
	OMe	2-SOCF <sub>3</sub>	OMe	3-SOCF <sub>3</sub>	OMe	4-SOCF <sub>3</sub>
	OMe	2-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	OMe	3-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	OMe	4-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
35	OMe	2-SCF <sub>2</sub> H	OMe	3-SCF <sub>2</sub> H	OMe	4-SCF <sub>2</sub> H
	OMe	2-SOCF <sub>2</sub> H	OMe	3-SOCF <sub>2</sub> H	OMe	4-SOCF <sub>2</sub> H
40	OMe	2-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	OMe	3-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	OMe	4-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H
	CF <sub>3</sub>	2-CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	3-CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub>
	CF <sub>3</sub>	2-OCF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	3-OCF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	4-OCF <sub>3</sub>
45	CF <sub>3</sub>	2-OCF <sub>2</sub> H	CF <sub>3</sub>	3-OCF <sub>2</sub> H	CF <sub>3</sub>	4-OCF <sub>2</sub> H
	CF <sub>3</sub>	2-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	CF <sub>3</sub>	3-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	CF <sub>3</sub>	4-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H
	CF <sub>3</sub>	2-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	3-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
50	CF <sub>3</sub>	2-SCF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	3-SCF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	4-SCF <sub>3</sub>
	CF <sub>3</sub>	2-SOCF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	3-SOCF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	4-SOCF <sub>3</sub>
	CF <sub>3</sub>	2-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	3-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	4-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
55	CF <sub>3</sub>	2-SCF <sub>2</sub> H	CF <sub>3</sub>	3-SCF <sub>2</sub> H	CF <sub>3</sub>	4-SCF <sub>2</sub> H
	CF <sub>3</sub>	2-SOCH <sub>2</sub> H	CF <sub>3</sub>	3-SOCF <sub>2</sub> H	CF <sub>3</sub>	4-SOCF <sub>2</sub> H
60	CF <sub>3</sub>	2-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	CF <sub>3</sub>	3-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	CF <sub>3</sub>	4-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H
	OCF <sub>2</sub> H	2-CF <sub>3</sub>	OCF <sub>2</sub> H	3-CF <sub>3</sub>	OCF <sub>2</sub> H	4-CF <sub>3</sub>
	OCF <sub>2</sub> H	2-OCF <sub>3</sub>	OCF <sub>2</sub> H	3-OCF <sub>3</sub>	OCF <sub>2</sub> H	4-OCF <sub>3</sub>
65	OCF <sub>2</sub> H	2-OCF <sub>2</sub> H	OCF <sub>2</sub> H	3-OCF <sub>2</sub> H	OCF <sub>2</sub> H	4-OCF <sub>2</sub> H

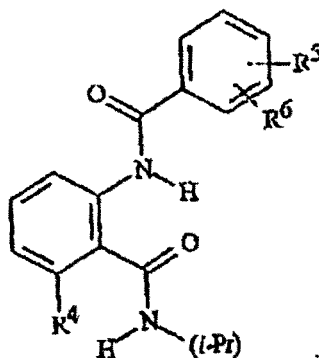
## ES 2 278 738 T3

	OCF <sub>2</sub> H	2-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	OCF <sub>2</sub> H	3-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	OCF <sub>2</sub> H	4-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H
5	OCF <sub>2</sub> H	2-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	OCF <sub>2</sub> H	3-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	OCF <sub>2</sub> H	4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
	OCF <sub>2</sub> H	2-SCF <sub>3</sub>	OCF <sub>2</sub> H	3-SCF <sub>3</sub>	OCF <sub>2</sub> H	4-SCF <sub>3</sub>
	OCF <sub>2</sub> H	2-SOCF <sub>3</sub>	OCF <sub>2</sub> H	3-SOCF <sub>3</sub>	OCF <sub>2</sub> H	4-SOCF <sub>3</sub>
10	OCF <sub>2</sub> H	2-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	OCF <sub>2</sub> H	3-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	OCF <sub>2</sub> H	4-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
	OCF <sub>2</sub> H	2-SCF <sub>2</sub> H	OCF <sub>2</sub> H	3-SCF <sub>2</sub> H	OCF <sub>2</sub> H	4-SCF <sub>2</sub> H
	OCF <sub>2</sub> H	2-SOCF <sub>2</sub> H	OCF <sub>2</sub> H	3-SOCF <sub>2</sub> H	OCF <sub>2</sub> H	4-SOCF <sub>2</sub> H
15	OCF <sub>2</sub> H	2-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	OCF <sub>2</sub> H	3-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	OCF <sub>2</sub> H	4-SO <sub>2</sub> -CF <sub>2</sub> H
	Me	2-Me-4-CF <sub>3</sub>	F	2-Me-4-CF <sub>3</sub>	Cl	2-Me-4-CF <sub>3</sub>
	Me	2-Me-4-OCF <sub>3</sub>	F	2-Me-4-OCF <sub>3</sub>	Cl	2-Me-4-OCF <sub>3</sub>
20	Me	2-Me-4-OCF <sub>2</sub> H	F	2-Me-4-OCF <sub>2</sub> H	Cl	2-Me-4-OCF <sub>2</sub> H
	Me	2-Me-4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	F	2-Me-4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Cl	2-Me-4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
25	Me	2-Me-4-SCF <sub>3</sub>	F	2-Me-4-SCF <sub>3</sub>	Cl	2-Me-4-SCF <sub>3</sub>
	Me	2-Me-4-SOCF <sub>3</sub>	F	2-Me-4-SOCF <sub>3</sub>	Cl	2-Me-4-SOCF <sub>3</sub>
	Me	2-Me-4-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	F	2-Me-4-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Cl	2-Me-4-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
30	Me	2-Me-4-SCF <sub>2</sub> H	F	2-Me-4-SCF <sub>2</sub> H	Cl	2-Me-4-SCF <sub>2</sub> H
	Me	2-Me-4-SOCF <sub>2</sub> H	F	2-Me-4-SOCF <sub>2</sub> H	Cl	2-Me-4-SOCF <sub>2</sub> H
	Me	2-Me-4-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	F	2-Me-4-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Cl	2-Me-4-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H
35	Br	2-Me-4-CF <sub>3</sub>	I	2-Me-4-CF <sub>3</sub>	OMe	2-Me-4-CF <sub>3</sub>
	Br	2-Me-4-OCF <sub>3</sub>	I	2-Me-4-OCF <sub>3</sub>	OMe	2-Me-4-OCF <sub>3</sub>
40	Br	2-Me-4-OCF <sub>2</sub> H	I	2-Me-4-OCF <sub>2</sub> H	OMe	2-Me-4-OCF <sub>2</sub> H
	Br	2-Me-4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	I	2-Me-4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	OMe	2-Me-4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
	Br	2-Me-4-SCF <sub>3</sub>	I	2-Me-4-SCF <sub>3</sub>	OMe	2-Me-4-SCF <sub>3</sub>
45	Br	2-Me-4-SOCF <sub>3</sub>	I	2-Me-4-SOCF <sub>3</sub>	OMe	2-Me-4-SOCF <sub>3</sub>
	Br	2-Me-4-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	I	2-Me-4-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	OMe	3-Me-4-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
	Br	2-Me-4-SCF <sub>2</sub> H	I	2-Me-4-SCF <sub>2</sub> H	OMe	3-Me-4-SCF <sub>2</sub> H
50	Br	2-Me-4-SOCF <sub>2</sub> H	I	2-Me-4-SOCF <sub>2</sub> H	OMe	2-Me-4-SOCF <sub>2</sub> H
	Br	2-Me-4-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	I	2-Me-4-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	OMe	2-Me-4-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H
55	CF <sub>3</sub>	2-Me-4-CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	2-Me-4-CF <sub>3</sub>	SMe	2-Me-4-CF <sub>3</sub>
	CF <sub>3</sub>	2-Me-4-OCF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	2-Me-4-OCF <sub>3</sub>	SMe	2-Me-4-OCF <sub>3</sub>
	CF <sub>3</sub>	2-Me-4-OCF <sub>2</sub> H	NO <sub>2</sub>	2-Me-4-OCF <sub>2</sub> H	SMe	2-Me-4-OCF <sub>2</sub> H
60	CF <sub>3</sub>	2-Me-4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	2-Me-4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	SMe	2-Me-4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
	CF <sub>3</sub>	2-Me-4-SCF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	2-Me-4-SCF <sub>3</sub>	SMe	2-Me-4-SCF <sub>3</sub>
	CF <sub>3</sub>	2-Me-4-SOCF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	2-Me-4-SOCF <sub>3</sub>	SMe	2-Me-4-SOCF <sub>3</sub>
65	CF <sub>3</sub>	2-Me-4-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	2-Me-4-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	SMe	2-Me-4-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>

ES 2 278 738 T3

CF <sub>3</sub>	2-Me-4-SCF <sub>2</sub> H	NO <sub>2</sub>	2-Me-4-SCF <sub>2</sub> H	SMe	2-Me-4-SCF <sub>2</sub> H
CF <sub>3</sub>	2-Me-4-SOCF <sub>2</sub> H	NO <sub>2</sub>	2-Me-4-SOCF <sub>2</sub> H	SMe	2-Me-4-SOCF <sub>2</sub> H
CF <sub>3</sub>	2-Me-4-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	NO <sub>2</sub>	2-Me-4-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	SMe	2-Me-4-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H

TABLA 3



R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup> y R <sup>6</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup> y R <sup>6</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup> y R <sup>6</sup>
Me	2-CF <sub>3</sub>	Me	3-CF <sub>3</sub>	Me	4-CF <sub>3</sub>
Me	2-OCF <sub>3</sub>	Me	3-OCF <sub>3</sub>	Me	4-OCF <sub>3</sub>
Me	2-OCF <sub>2</sub> H	Me	3-OCF <sub>2</sub> H	Me	4-OCF <sub>2</sub> H
Me	2-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me	3-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me	4-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H
Me	2-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me	3-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me	4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	2-SCF <sub>3</sub>	Me	3-SCF <sub>3</sub>	Me	4-SCF <sub>3</sub>
Me	2-SOCF <sub>3</sub>	Me	3-SOCF <sub>3</sub>	Me	4-SOCF <sub>3</sub>
Me	2-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me	3-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me	4-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	2-SCF <sub>2</sub> H	Me	3-SCF <sub>2</sub> H	Me	4-SCF <sub>2</sub> H
Me	2-SOCF <sub>2</sub> H	Me	3-SOCF <sub>2</sub> H	Me	4-SOCF <sub>2</sub> H
Me	2-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me	3-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me	4-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H
Cl	2-CF <sub>3</sub>	Cl	3-CF <sub>3</sub>	Cl	4-CF <sub>3</sub>
Cl	2-OCF <sub>3</sub>	Cl	3-OCF <sub>3</sub>	Cl	4-OCF <sub>3</sub>
Cl	2-OCF <sub>2</sub> H	Cl	3-OCF <sub>2</sub> H	Cl	4-OCF <sub>2</sub> H
Cl	2-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Cl	3-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Cl	4-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H
Cl	2-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Cl	3-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Cl	4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Cl	2-SCF <sub>3</sub>	Cl	3-SCF <sub>3</sub>	Cl	4-SCF <sub>3</sub>
Cl	2-SOCF <sub>3</sub>	Cl	3-SOCF <sub>3</sub>	Cl	4-SOCF <sub>3</sub>
Cl	2-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Cl	3-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Cl	4-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Cl	2-SCF <sub>2</sub> H	Cl	3-SCF <sub>2</sub> H	Cl	4-SCF <sub>2</sub> H
Cl	2-SOCF <sub>2</sub> H	Cl	3-SOCF <sub>2</sub> H	Cl	4-SOCF <sub>2</sub> H
Cl	2-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Cl	3-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Cl	4-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H
F	2-CF <sub>3</sub>	F	3-CF <sub>3</sub>	F	4-CF <sub>3</sub>

ES 2 278 738 T3

	F	2-OCF <sub>3</sub>	F	3-OCF <sub>3</sub>	F	4-OCF <sub>3</sub>
	F	2-OCF <sub>2</sub> H	F	3-OCF <sub>2</sub> H	F	4-OCF <sub>2</sub> H
5	F	2-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	F	3-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	F	4-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H
	F	2-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	F	3-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	F	4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
10	F	2-SCF <sub>3</sub>	F	3-SCF <sub>3</sub>	F	4-SCF <sub>3</sub>
	F	2-SOCF <sub>3</sub>	F	3-SOCF <sub>3</sub>	F	4-SOCF <sub>3</sub>
	F	2-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	F	3-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	F	4-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
15	F	2-SCF <sub>2</sub> H	F	3-SCF <sub>2</sub> H	F	4-SCF <sub>2</sub> H
	F	2-SOCF <sub>2</sub> H	F	3-SOCF <sub>2</sub> H	F	4-SOCF <sub>2</sub> H
	F	2-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	F	3-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	F	4-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H
20	Br	2-CF <sub>3</sub>	Br	3-CF <sub>3</sub>	Br	4-CF <sub>3</sub>
	Br	2-OCF <sub>3</sub>	Br	3-OCF <sub>3</sub>	Br	4-OCF <sub>3</sub>
	Br	2-OCF <sub>2</sub> H	Br	3-OCF <sub>2</sub> H	Br	4-OCF <sub>2</sub> H
25	Br	2-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Br	3-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Br	4-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H
	Br	2-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Br	3-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Br	4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
30	Br	2-SCF <sub>3</sub>	Br	3-SCF <sub>3</sub>	Br	4-SCF <sub>3</sub>
	Br	2-SOCF <sub>3</sub>	Br	3-SOCF <sub>3</sub>	Br	4-SOCF <sub>3</sub>
	Br	2-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Br	3-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Br	4-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
35	Br	2-SCF <sub>2</sub> H	Br	3-SCF <sub>2</sub> H	Br	4-SCF <sub>2</sub> H
	Br	2-SOCF <sub>2</sub> H	Br	3-SOCF <sub>2</sub> H	Br	4-SOCF <sub>2</sub> H
	Br	2-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Br	3-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Br	4-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H
40	I	2-CF <sub>3</sub>	I	3-CF <sub>3</sub>	I	4-CF <sub>3</sub>
	I	2-OCF <sub>3</sub>	I	3-OCF <sub>3</sub>	I	4-OCF <sub>3</sub>
	I	2-OCF <sub>2</sub> H	I	3-OCF <sub>2</sub> H	I	4-OCF <sub>2</sub> H
45	I	2-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	I	3-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	I	4-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H
	I	2-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	I	3-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	I	4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
50		2-SCF <sub>3</sub>	I	3-SCF <sub>3</sub>	I	4-SCF <sub>3</sub>
	I	2-SOCF <sub>3</sub>	I	3-SOCF <sub>3</sub>	I	4-SOCF <sub>3</sub>
	I	2-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	I	3-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	I	4-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
55	I	2-SCF <sub>2</sub> H	I	3-SCF <sub>2</sub> H	I	4-SCF <sub>2</sub> H
	I	2-SOCF <sub>2</sub> H	I	3-SOCF <sub>2</sub> H	I	4-SOCF <sub>2</sub> H
	I	2-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	I	3SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	I	4-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H
60	OMe	2-CF <sub>3</sub>	OMe	3-CF <sub>3</sub>	OMe	4-CF <sub>3</sub>
	OMe	2-OCF <sub>3</sub>	OMe	3-OCF <sub>3</sub>	OMe	4-OCF <sub>3</sub>
65	OMe	2-OCF <sub>2</sub> H	OMe	3-OCF <sub>2</sub> H	OMe	4-OCF <sub>2</sub> H



ES 2 278 738 T3

	OMe	2-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	OMe	3-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	OMe	4-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H
5	OMe	2-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	OMe	3-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	OMe	4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
	OMe	2-SCF <sub>3</sub>	OMe	3-SCF <sub>3</sub>	OMe	4-SCF <sub>3</sub>
	OMe	2-SOCF <sub>3</sub>	OMe	3-SOCF <sub>3</sub>	OMe	4-SOCF <sub>3</sub>
10	OMe	2-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	OMe	3-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	OMe	4-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
	OMe	2-SCF <sub>2</sub> H	OMe	3-SCF <sub>2</sub> H	OMe	4-SCF <sub>2</sub> H
	OMe	2-SOCF <sub>2</sub> H	OMe	3-SOCF <sub>2</sub> H	OMe	4-SOCF <sub>2</sub> H
15	OMe	2-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	OMe	3-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	OMe	4-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H
	CF <sub>3</sub>	2-CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	3-CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub>
	CF <sub>3</sub>	2-OCF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	3-OCF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	4-OCF <sub>3</sub>
20	CF <sub>3</sub>	2-OCF <sub>2</sub> H	CF <sub>3</sub>	3-OCF <sub>2</sub> H	CF <sub>3</sub>	4-OCF <sub>2</sub> H
	CF <sub>3</sub>	2-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	CF <sub>3</sub>	3-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	CF <sub>3</sub>	4-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H
	CF <sub>3</sub>	2-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	3-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
25	CF <sub>3</sub>	2-SCF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	3-SCF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	4-SCF <sub>3</sub>
	CF <sub>3</sub>	2-SOCF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	3-SOCF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	4-SOCF <sub>3</sub>
	CF <sub>3</sub>	2-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	3-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	4-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
30	CF <sub>3</sub>	2-SCF <sub>2</sub> H	CF <sub>3</sub>	3-SCF <sub>2</sub> H	CF <sub>3</sub>	4-SCF <sub>2</sub> H
	CF <sub>3</sub>	2-SOCF <sub>2</sub> H	CF <sub>3</sub>	3-SOCF <sub>2</sub> H	CF <sub>3</sub>	4-SOCF <sub>2</sub> H
35	CF <sub>3</sub>	2-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	CF <sub>3</sub>	3-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	CF <sub>3</sub>	4-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H
	OCF <sub>2</sub> H	2-CF <sub>3</sub>	OCF <sub>2</sub> H	3-CF <sub>3</sub>	OCF <sub>2</sub> H	4-CF <sub>3</sub>
	OCF <sub>2</sub> H	2-OCF <sub>3</sub>	OCF <sub>2</sub> H	3-OCF <sub>3</sub>	OCF <sub>2</sub> H	4-OCF <sub>3</sub>
40	OCF <sub>2</sub> H	2-OCF <sub>2</sub> H	OCF <sub>2</sub> H	3-OCF <sub>2</sub> H	OCF <sub>2</sub> H	4-OCF <sub>2</sub> H
	OCF <sub>2</sub> H	2-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	OCF <sub>2</sub> H	3-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	OCF <sub>2</sub> H	4-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H
45	OCF <sub>2</sub> H	2-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	OCF <sub>2</sub> H	3-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	OCF <sub>2</sub> H	4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
	OCF <sub>2</sub> H	2-SCF <sub>3</sub>	OCF <sub>2</sub> H	3-SCF <sub>3</sub>	OCF <sub>2</sub> H	4-SCF <sub>3</sub>
	OCF <sub>2</sub> H	2-SOCF <sub>3</sub>	OCF <sub>2</sub> H	3-SOCF <sub>3</sub>	OCF <sub>2</sub> H	4-SOCF <sub>3</sub>
50	OCF <sub>2</sub> H	2-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	OCF <sub>2</sub> H	3-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	OCF <sub>2</sub> H	4-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
	OCF <sub>2</sub> H	2-SCF <sub>2</sub> H	OCF <sub>2</sub> H	3-SCF <sub>2</sub> H	OCF <sub>2</sub> H	4-SCF <sub>2</sub> H
	OCF <sub>2</sub> H	2-SOCF <sub>2</sub> H	OCF <sub>2</sub> H	3-SOCF <sub>2</sub> H	OCF <sub>2</sub> H	4-SOCF <sub>2</sub> H
55	OCF <sub>2</sub> H	2-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	OCF <sub>2</sub> H	3-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	OCF <sub>2</sub> H	4-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H
	Me	2-Me-4-CF <sub>3</sub>	F	2-Me-4-CF <sub>3</sub>	Cl	2-Me-4-CF <sub>3</sub>
60	Me	2-Me-4-OCF <sub>3</sub>	F	2-Me-4-OCF <sub>3</sub>	Cl	2-Me-4-OCF <sub>3</sub>
	Me	2-Me-4-OCF <sub>2</sub> H	F	2-Me-4-OCF <sub>2</sub> H	Cl	2-Me-4-OCF <sub>2</sub> H
65	Me	2-Me-4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	F	2-Me-4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Cl	2-Me-4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>

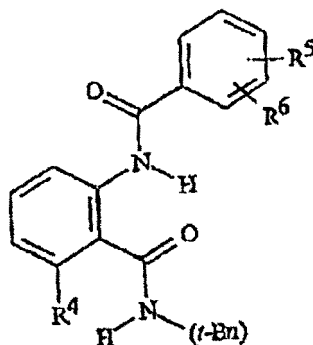
## ES 2 278 738 T3

	Me	2-Me-4-SCF <sub>3</sub>	F	2-Me-4-SCF <sub>3</sub>	Cl	2-Me-4-SCF <sub>3</sub>
5	Me	2-Me-4-SOCF <sub>3</sub>	F	2-Me-4-SOCF <sub>3</sub>	Cl	2-Me-4-SOCF <sub>3</sub>
	Me	2-Me-4-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	F	2-Me-4-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Cl	2-Me-4-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
	Me	2-Me-4-SCF <sub>2</sub> H	F	2-Me-4-SCF <sub>2</sub> H	Cl	2-Me-4-SCF <sub>2</sub> H
10	Me	2-Me-4-SOCF <sub>2</sub> H	F	2-Me-4-SOCF <sub>2</sub> H	Cl	2-Me-4-SOCF <sub>2</sub> H
15	Me	2-Me-4-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	F	2-Me-4-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Cl	2-Me-4-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H
	Br	2-Me-4-CF <sub>3</sub>	I	2-Me-4-CF <sub>3</sub>	OMe	2-Me-4-CF <sub>3</sub>
	Br	2-Me-4-OCF <sub>3</sub>	I	2-Me-4-OCF <sub>3</sub>	OMe	2-Me-4-OCF <sub>3</sub>
20	Br	2-Me-4-OCF <sub>2</sub> H	I	2-Me-4-OCF <sub>2</sub> H	OMe	2-Me-4-OCF <sub>2</sub> H
	Br	2-Me-4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	I	2-Me-4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	OMe	2-Me-4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
25	Br	2-Me-4-SCF <sub>3</sub>	I	2-Me-4-SCF <sub>3</sub>	OMe	2-Me-4-SCF <sub>3</sub>
	Br	2-Me-4-SOCF <sub>3</sub>	I	2-Me-4-SOCF <sub>3</sub>	OMe	2-Me-4-SOCF <sub>3</sub>
	Br	2-Me-4-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	I	2-Me-4-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	OMe	2-Me-4-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
30	Br	2-Me-4-SCF <sub>2</sub> H	I	2-Me-4-SCF <sub>2</sub> H	OMe	2-Me-4-SCF <sub>2</sub> H
	Br	2-Me-4-SOCF <sub>2</sub> H	I	2-Me-4-SOCF <sub>2</sub> H	OMe	2-Me-4-SOCF <sub>2</sub> H
35	Br	2-Me-4-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	I	2-Me-4-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	OMe	2-Me-4-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H
40	CF <sub>3</sub>	2-Me-4-CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	2-Me-4-CF <sub>3</sub>	SMe	2-Me-4-CF <sub>3</sub>
	CF <sub>3</sub>	2-Me-4-OCF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	2-Me-4-OCF <sub>3</sub>	SMe	2-Me-4-OCF <sub>3</sub>
	CF <sub>3</sub>	2-Me-4-OCF <sub>2</sub> H	NO <sub>2</sub>	2-Me-4-OCF <sub>2</sub> H	SMe	2-Me-4-OCF <sub>2</sub> H
45	CF <sub>3</sub>	2-Me-4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	2-Me-4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	SMe	2-Me-4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
	CF <sub>3</sub>	2-Me-4-SCF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	2-Me-4-SCF <sub>3</sub>	SMe	2-Me-4-SCF <sub>3</sub>
50	CF <sub>3</sub>	2-Me-4-SOCF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	2-Me-4-SOCF <sub>3</sub>	SMe	2-Me-4-SOCF <sub>3</sub>
	CF <sub>3</sub>	2-Me-4-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	2-Me-4-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	SMe	2-Me-4-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
55	CF <sub>3</sub>	2-Me-4-SCF <sub>2</sub> H	NO <sub>2</sub>	2-Me-4-SCF <sub>2</sub> H	SMe	2-Me-4-SCF <sub>2</sub> H
	CF <sub>3</sub>	2-Me-4-SOCF <sub>2</sub> H	NO <sub>2</sub>	2-Me-4-SOCF <sub>2</sub> H	SMe	2-Me-4-SOCF <sub>2</sub> H
60	CF <sub>3</sub>	2-Me-4-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	NO <sub>2</sub>	2-Me-4-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	SMe	2-Me-4-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H

65

ES 2 278 738 T3

TABLA 4



R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup> y R <sup>6</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup> y R <sup>6</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup> y R <sup>6</sup>
Me	2-CF <sub>3</sub>	Me	3-CF <sub>3</sub>	Me	4-CF <sub>3</sub>
Me	2-OCF <sub>3</sub>	Me	3-OCF <sub>3</sub>	Me	4-OCF <sub>3</sub>
Me	2-OCF <sub>2</sub> H	Me	3-OCF <sub>2</sub> H	Me	4-OCF <sub>2</sub> H
Me	2-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me	3-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me	4-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H
Me	2-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me	3-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me	4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	2-SCF <sub>3</sub>	Me	3-SCF <sub>3</sub>	Me	4-SCF <sub>3</sub>
Me	2-SOCF <sub>3</sub>	Me	3-SOCF <sub>3</sub>	Me	4-SOCF <sub>3</sub>
Me	2-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me	3-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Me	4-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Me	2-SCF <sub>2</sub> H	Me	3-SCF <sub>2</sub> H	Me	4-SCF <sub>2</sub> H
Me	2-SOCF <sub>2</sub> H	Me	3-SOCF <sub>2</sub> H	Me	4-SOCF <sub>2</sub> H
Me	2-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me	3-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Me	4-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H
Cl	2-CF <sub>3</sub>	Cl	3-CF <sub>3</sub>	Cl	4-CF <sub>3</sub>
Cl	2-OCF <sub>3</sub>	Cl	3-OCF <sub>3</sub>	Cl	4-OCF <sub>3</sub>
Cl	2-OCF <sub>2</sub> H	Cl	3-OCF <sub>2</sub> H	Cl	4-OCF <sub>2</sub> H
Cl	2-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Cl	3-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Cl	4-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H
Cl	2-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Cl	3-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Cl	4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Cl	2-SCF <sub>3</sub>	Cl	3-SCF <sub>3</sub>	Cl	4-SCF <sub>3</sub>
Cl	2-SOCF <sub>3</sub>	Cl	3-SOCF <sub>3</sub>	Cl	4-SOCF <sub>3</sub>
Cl	2-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Cl	3-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Cl	4-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
Cl	2-SCF <sub>2</sub> H	Cl	3-SCF <sub>2</sub> H	Cl	4-SCF <sub>2</sub> H
Cl	2-SOCF <sub>2</sub> H	Cl	3-SOCF <sub>2</sub> H	Cl	4-SOCF <sub>2</sub> H
Cl	2-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Cl	3-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Cl	4-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H
F	2-CF <sub>3</sub>	F	3-CF <sub>3</sub>	F	4-CF <sub>3</sub>
F	2-OCF <sub>3</sub>	F	3-OCF <sub>3</sub>	F	4-OCF <sub>3</sub>
F	2-OCF <sub>2</sub> H	F	3-OCF <sub>2</sub> H	F	4-OCF <sub>2</sub> H
F	2-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	F	3-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	F	4-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H
F	2-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	F	3-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	F	4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>

## ES 2 278 738 T3

	F	2-SCF <sub>3</sub>	F	3-SCF <sub>3</sub>	F	4-SCF <sub>3</sub>
5	F	2-SOCF <sub>3</sub>	F	3-SOCF <sub>3</sub>	F	4-SOCF <sub>3</sub>
	F	2-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	F	3-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	F	4-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
	F	2-SCF <sub>2</sub> H	F	3-SCF <sub>2</sub> H	F	4-SCF <sub>2</sub> H
10	F	2-SOCF <sub>2</sub> H	F	3-SOCF <sub>2</sub> H	F	4-SOCF <sub>2</sub> H
	F	2-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	F	3-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	F	4-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H
	Br	2-CF <sub>3</sub>	Br	3-CF <sub>3</sub>	Br	4-CF <sub>3</sub>
15	Br	2-OCF <sub>3</sub>	Br	3-OCF <sub>3</sub>	Br	4-OCF <sub>3</sub>
	Br	2-OCF <sub>2</sub> H	Br	3-OCF <sub>2</sub> H	Br	4-OCF <sub>2</sub> H
	Br	2-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Br	3-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Br	4-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H
20	Br	2-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Br	3-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Br	4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
	Br	2-SCF <sub>3</sub>	Br	3-SCF <sub>3</sub>	Br	4-SCF <sub>3</sub>
25	Br	2-SOCF <sub>3</sub>	Br	3-SOCF <sub>3</sub>	Br	4-SOCF <sub>3</sub>
	Br	2-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Br	3-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Br	4-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
	Br	2-SCF <sub>2</sub> H	Br	3-SCF <sub>2</sub> H	Br	4-SCF <sub>2</sub> H
30	Br	2-SOCF <sub>2</sub> H	Br	3-SOCF <sub>2</sub> H	Br	4-SOCF <sub>2</sub> H
	Br	2-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Br	3-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Br	4-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H
35	I	2-CF <sub>3</sub>	I	3-CF <sub>3</sub>	I	4-CF <sub>3</sub>
	I	2-OCF <sub>3</sub>	I	3-OCF <sub>3</sub>	I	4-OCF <sub>3</sub>
	I	2-OCF <sub>2</sub> H	I	3-OCF <sub>2</sub> H	I	4-OCF <sub>2</sub> H
40	I	2-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	I	3-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	I	4-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H
	I	2-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	I	3-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	I	4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
	I	2-SCF <sub>3</sub>	I	3-SCF <sub>3</sub>	I	4-SCF <sub>3</sub>
45	I	2-SOCF <sub>3</sub>	I	3-SOCF <sub>3</sub>	I	4-SOCF <sub>3</sub>
	I	2-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	I	3-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	I	4-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
	I	2-SCF <sub>2</sub> H	I	3-SCF <sub>2</sub> H	I	4-SCF <sub>2</sub> H
50	I	2-SOCF <sub>2</sub> H	I	3-SOCF <sub>2</sub> H	I	4-SOCF <sub>2</sub> H
	I	2-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	I	3-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	I	4-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H
55	OMe	2-CF <sub>3</sub>	OMe	3-CF <sub>3</sub>	OMe	4-CF <sub>3</sub>
	OMe	2-OCF <sub>2</sub>	OMe	3-OCF <sub>3</sub>	OMe	4-OCF <sub>3</sub>
	OMe	2-OCF <sub>2</sub> H	OMe	3-OCF <sub>2</sub> H	OMe	4-OCF <sub>2</sub> H
60	OMe	2-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	OMe	3-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	OMe	4-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H
	OMe	2-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	OMe	3-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	OMe	4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
	OMe	2-SCF <sub>3</sub>	OMe	3-SCF <sub>3</sub>	OMe	4-SCF <sub>3</sub>
65	OMe	2-SOCF <sub>3</sub>	OMe	3-SOCF <sub>3</sub>	OMe	4-SOCF <sub>3</sub>

ES 2 278 738 T3

	OMe	2-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	OMe	3-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	OMe	4-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
5	OMe	2-SCF <sub>2</sub> H	OMe	3-SCF <sub>2</sub> H	OMe	4-SCF <sub>2</sub> H
	OMe	2-SOCF <sub>2</sub> H	OMe	3-SOCF <sub>2</sub> H	OMe	4-SOCF <sub>2</sub> H
	OMe	2-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	OMe	3-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	OMe	4-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H
10	CF <sub>3</sub>	2-CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	3-CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub>
	CF <sub>3</sub>	2-OCF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	3-OCF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	4-OCF <sub>3</sub>
	CF <sub>3</sub>	2-OCF <sub>2</sub> H	CF <sub>3</sub>	3-OCF <sub>2</sub> H	CF <sub>3</sub>	4-OCF <sub>2</sub> H
15	CF <sub>3</sub>	2-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	CF <sub>3</sub>	3-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	CF <sub>3</sub>	4-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H
	CF <sub>3</sub>	2-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	3-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
20	CF <sub>3</sub>	2-SCF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	3-SCF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	4-SCF <sub>3</sub>
	CF <sub>3</sub>	2-SOCF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	3-SOCF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	4-SOCF <sub>3</sub>
	CF <sub>3</sub>	2-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	3-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	4-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
25	CF <sub>3</sub>	2-SCF <sub>2</sub> H	CF <sub>3</sub>	3-SCF <sub>2</sub> H	CF <sub>3</sub>	4-SCF <sub>2</sub> H
	CF <sub>3</sub>	2-SOCF <sub>2</sub> H	CF <sub>3</sub>	3-SOCF <sub>2</sub> H	CF <sub>3</sub>	4-SOCF <sub>2</sub> H
	CF <sub>3</sub>	2-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	CF <sub>3</sub>	3-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	CF <sub>3</sub>	4-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H
30	OCF <sub>2</sub> H	2-CF <sub>3</sub>	OCF <sub>2</sub> H	3-CF <sub>3</sub>	OCF <sub>2</sub> H	4-CF <sub>3</sub>
	OCF <sub>2</sub> H	2-OCF <sub>3</sub>	OCF <sub>2</sub> H	3-OCF <sub>3</sub>	OCF <sub>2</sub> H	4-OCF <sub>3</sub>
	OCF <sub>2</sub> H	2-OCF <sub>2</sub> H	OCF <sub>2</sub> H	3-OCF <sub>2</sub> H	OCF <sub>2</sub> H	4-OCF <sub>2</sub> H
35	OCF <sub>2</sub> H	2-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	OCF <sub>2</sub> H	3-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	OCF <sub>2</sub> H	4-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H
	OCF <sub>2</sub> H	2-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	OCF <sub>2</sub> H	3-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	OCF <sub>2</sub> H	4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
40	OCF <sub>2</sub> H	2-SCF <sub>3</sub>	OCF <sub>2</sub> H	3-SCF <sub>3</sub>	OCF <sub>2</sub> H	4-SCF <sub>3</sub>
	OCF <sub>2</sub> H	2-SOCF <sub>3</sub>	OCF <sub>2</sub> H	3-SOCF <sub>3</sub>	OCF <sub>2</sub> H	4-SOCF <sub>3</sub>
	OCF <sub>2</sub> H	2-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	OCF <sub>2</sub> H	3-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	OCF <sub>2</sub> H	4-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
45	OCF <sub>2</sub> H	2-SCF <sub>2</sub> H	OCF <sub>2</sub> H	3-SCF <sub>2</sub> H	OCF <sub>2</sub> H	4-SCF <sub>2</sub> H
	OCF <sub>2</sub> H	2-SOCF <sub>2</sub> H	OCF <sub>2</sub> H	3-SOCF <sub>2</sub> H	OCF <sub>2</sub> H	4-SOCF <sub>2</sub> H
	OCF <sub>2</sub> H	2-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	OCF <sub>2</sub> H	3-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	OCF <sub>2</sub> H	4-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H
50	Me	2-Me-4-CF <sub>3</sub>	F	2-Me-4-CF <sub>3</sub>	Cl	2-Me-4-CF <sub>3</sub>
	Me	2-Me-4-OCF <sub>3</sub>	F	2-Me-4-OCF <sub>3</sub>	Cl	2-Me-4-OCF <sub>3</sub>
55	Me	2-Me-4-OCF <sub>2</sub> H	F	2-Me-4-OCF <sub>2</sub> H	Cl	2-Me-4-OCF <sub>2</sub> H
	Me	2-Me-4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	F	2-Me-4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Cl	2-Me-4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
60	Me	2-Me-4-SCF <sub>3</sub>	F	2-Me-4-SCF <sub>3</sub>	Cl	2-Me-4-SCF <sub>3</sub>
	Me	2-Me-4-SOCF <sub>3</sub>	F	2-Me-4-SOCF <sub>3</sub>	Cl	2-Me-4-SOCF <sub>3</sub>
65	Me	2-Me-4-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	F	2-Me-4-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Cl	2-Me-4-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
	Me	2-Me-4-SCF <sub>2</sub> H	F	2-Me-4-SCF <sub>2</sub> H	Cl	2-Me-4-SCF <sub>2</sub> H
	Me	2-Me-4-SOCF <sub>2</sub> H	F	2-Me-4-SOCF <sub>2</sub> H	Cl	2-Me-4-SOCF <sub>2</sub> H
	Me	2-Me-4-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	F	2-Me-4-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Cl	2-Me-4-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H

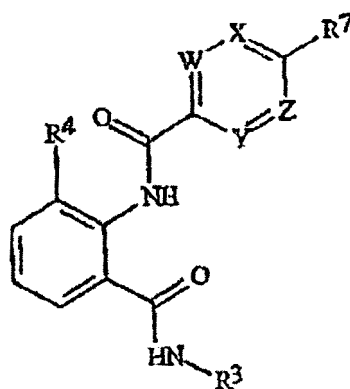
## ES 2 278 738 T3

			SOCF <sub>3</sub>		SOCF <sub>3</sub>	
5	Me	2-Me-4-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	F	2-Me-4-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Cl	2-Me-4-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
10	Me	2-Me-4-SCF <sub>2</sub> H	F	2-Me-4-SCF <sub>2</sub> H	Cl	2-Me-4-SCF <sub>2</sub> H
15	Me	2-Me-4-SOCF <sub>2</sub> H	F	2-Me-4-SOCF <sub>2</sub> H	Cl	2-Me-4-SOCF <sub>2</sub> H
20	Me	2-Me-4-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	F	2-Me-4-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	Cl	2-Me-4-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H
25	Br	2-Me-4-CF <sub>3</sub>	I	2-Me-4-CF <sub>3</sub>	OMe	2-Me-4-CF <sub>3</sub>
30	Br	2-Me-4-OCF <sub>3</sub>	I	2-Me-4-OCF <sub>3</sub>	OMe	2-Me-4-OCF <sub>3</sub>
35	Br	2-Me-4-OCF <sub>2</sub> H	I	2-Me-4-OCF <sub>2</sub> H	OMe	2-Me-4-OCF <sub>2</sub> H
40	Br	2-Me-4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	I	2-Me-4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	OMe	2-Me-4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
45	Br	2-Me-4-SCF <sub>3</sub>	I	2-Me-4-SCF <sub>3</sub>	OMe	2-Me-4-SCF <sub>3</sub>
50	Br	2-Me-4-SOCF <sub>3</sub>	I	2-Me-4-SOCF <sub>3</sub>	OMe	2-Me-4-SOCF <sub>3</sub>
55	Br	2-Me-4-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	I	2-Me-4-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	OMe	2-Me-4-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
60	Br	2-Me-4-SCF <sub>2</sub> H	I	2-Me-4-SCF <sub>2</sub> H	OMe	2-Me-4-SCF <sub>2</sub> H
65	Br	2-Me-4-SOCF <sub>2</sub> H	I	2-Me-4-SOCF <sub>2</sub> H	OMe	2-Me-4-SOCF <sub>2</sub> H
	Br	2-Me-4-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	I	2-Me-4-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	OMe	2-Me-4-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H
	CF <sub>3</sub>	2-Me-4-CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	2-Me-4-CF <sub>3</sub>	SMe	2-Me-4-CF <sub>3</sub>
	CF <sub>3</sub>	2-Me-4-OCF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	2-Me-4-OCF <sub>3</sub>	SMe	2-Me-4-OCF <sub>3</sub>
	CF <sub>3</sub>	2-Me-4-OCF <sub>2</sub> H	NO <sub>2</sub>	2-Me-4-OCF <sub>2</sub> H	SMe	2-Me-4-OCF <sub>2</sub> H
	CF <sub>3</sub>	2-Me-4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	2-Me-4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	SMe	2-Me-4-OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
	CF <sub>3</sub>	2-Me-4-SCF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	2-Me-4-SCF <sub>3</sub>	SMe	2-Me-4-SCF <sub>3</sub>
	CF <sub>3</sub>	2-Me-4-SOCF <sub>3</sub>	NO <sub>2</sub>	2-Me-4-	SMe	2-Me-4-

ES 2 278 738 T3

			SOCF <sub>3</sub>		SOCF <sub>3</sub>
5	CF <sub>3</sub>	2-Me-4-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	2-Me-4-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	SMe	2-Me-4-SO <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>
	CF <sub>3</sub>	2-Me-4-SCF <sub>2</sub> H	2-Me-4-SCF <sub>2</sub> H	SMe	2-Me-4-SCF <sub>2</sub> H
10	CF <sub>3</sub>	2-Me-4-SOCF <sub>2</sub> H	2-Me-4-SOCF <sub>2</sub> H	SMe	2-Me-4-SOCF <sub>2</sub> H
15	CF <sub>3</sub>	2-Me-4-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	2-Me-4-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H	SMe	2-Me-4-SO <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> H

TABLA 5



R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>7</sup>	W	X	Y	Z	
40	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CMe	N	CH	CH
	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CMe	N	CH	CH
	i-Pr	Br	CF <sub>3</sub>	CMe	N	CH	CH
45	i-Pr	I	CF <sub>3</sub>	CMe	N	CH	CH
	i-Pr	F	CF <sub>3</sub>	CMe	N	CH	CH
	i-Pr	H	CF <sub>3</sub>	CMe	N	CH	CH
50	i-Pr	Et	CF <sub>3</sub>	CMe	N	CH	CH
	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CMe	CH	N	CH
	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CMe	CH	N	CH
55	i-Pr	Br	CF <sub>3</sub>	CMe	CH	N	CH
	i-Pr	I	CF <sub>3</sub>	CMe	CH	N	CH
60	i-Pr	F	CF	CMe	CH	N	CH
	i-Pr	H	CF <sub>3</sub>	CMe	CH	N	CH
	i-Pr	Et	CF <sub>3</sub>	CMe	CH	N	CH
65	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CMe	CH	CH	N
	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CMe	CH	CH	N

## ES 2 278 738 T3

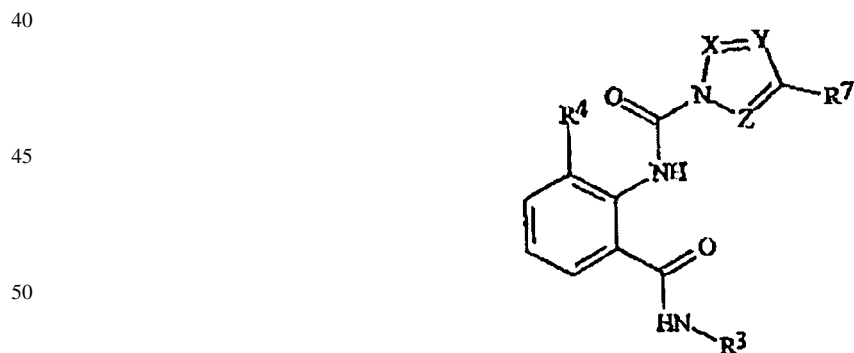
	i-Pr	Br	CF <sub>3</sub>	CMe	CH	CH	N
5	i-Pr	I	CF <sub>3</sub>	CMe	CH	CH	N
	i-Pr	F	CF <sub>3</sub>	CMe	CH	CH	N
	i-Pr	H	CF <sub>3</sub>	CMe	CH	CH	N
10	i-Pr	Et	CF <sub>3</sub>	CMe	CH	CH	N
	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CMe	N	CH	N
	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CMe	N	CH	N
15	i-Pr	Br	CF <sub>3</sub>	CMe	N	CH	N
	i-Pr	I	CF <sub>3</sub>	CMe	N	CH	N
	i-Pr	F	CF <sub>3</sub>	CMe	N	CH	N
20	i-Pr	H	CF <sub>3</sub>	CMe	N	CH	N
	i-Pr	Et	CF <sub>3</sub>	CMe	N	CH	N
25	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CMe	N	CH	CH
	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CMe	N	CH	CH
	t-Bu	Br	CF <sub>3</sub>	CMe	N	CH	CH
30	t-Bu	I	CF <sub>3</sub>	CMe	N	CH	CH
	t-Bu	F	CF <sub>3</sub>	CMe	N	CH	CH
	t-Bu	H	CF <sub>3</sub>	CMe	N	CH	CH
35	t-Bu	Et	CF <sub>3</sub>	CMe	N	CH	CH
	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CMe	CH	CH	N
40	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CMe	CH	CH	N
	t-Bu	Br	CF <sub>3</sub>	CMe	CH	CH	N
	t-Bu	I	CF <sub>3</sub>	CMe	CH	CH	N
45	t-Bu	F	CF <sub>3</sub>	CMe	CH	CH	N
	t-Bu	H	CF <sub>3</sub>	CMe	CH	CH	N
	t-Bu	Et	CF <sub>3</sub>	CMe	CH	CH	N
50	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CMe	CH	CH	N
	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CMe	CH	CH	N
	t-Bu	Br	CF <sub>3</sub>	CMe	CH	CH	N
55	t-Bu	I	CF <sub>3</sub>	CMe	CH	CH	N
	t-Bu	F	CF <sub>3</sub>	CMe	CH	CH	N
60	t-Bu	H	CF <sub>3</sub>	CMe	CH	CH	N
	t-Bu	Et	CF <sub>3</sub>	CMe	CH	CH	N
	i-Pr	Me	OCF <sub>3</sub>	CMe	N	CH	CH
65	i-Pr	Cl	OCF <sub>3</sub>	CMe	N	CH	CH



ES 2 278 738 T3

5	i-Pr	Br	OCF <sub>3</sub>	CMe	N	CH	CH
	i-Pr	I	OCF <sub>3</sub>	CMe	N	CH	CH
	i-Pr	F	OCF <sub>3</sub>	CMe	N	CH	CH
	i-Pr	H	OCF <sub>3</sub>	CMe	N	CH	CH
10	i-Pr	Et	OCF <sub>3</sub>	CMe	N	CH	CH
	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CH	N	CH	CH
	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CH	N	CH	CH
15	i-Pr	Br	CF <sub>3</sub>	CH	N	CH	CH
	i-Pr	I	CF <sub>3</sub>	CH	N	CH	CH
	i-Pr	F	CF <sub>3</sub>	CH	N	CH	CH
20	i-Pr	H	CF <sub>3</sub>	CH	N	CH	CH
	i-Pr	Et	CF <sub>3</sub>	CH	N	CH	CH
	i-Pr	Me	Cl	CMe	CH	CH	N
25	i-Pr	Cl	Cl	CMe	CH	CH	N
	i-Pr	Br	Cl	CMe	CH	CH	N
	i-Pr	I	Cl	CMe	CH	CH	N
30	i-Pr	F	Cl	CMe	CH	CH	N
	i-Pr	H	Cl	CMe	CH	CH	N
35	i-Pr	Et	Cl	CMe	CH	CH	N

TABLA 6



55

60

65

R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>7</sup>	X	Y	Z
i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CMe	N	CH
i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CMe	N	CH
i-Pr	Br	CF <sub>3</sub>	CMe	N	CH
i-Pr	I	CF <sub>3</sub>	CMe	N	CH
i-Pr	F	CF <sub>3</sub>	CMe	N	CH
i-Pr	H	CF <sub>3</sub>	CMe	N	CH

## ES 2 278 738 T3

	i-Pr	Et	CF <sub>3</sub>	CMe	N	CH
5	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CMe	CH	N
	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CMe	CH	N
	i-Pr	Br	CF <sub>3</sub>	CMe	CH	N
10	i-Pr	I	CF <sub>3</sub>	CMe	CH	N
	i-Pr	F	CF	CMe	CH	N
	i-Pr	H	CF <sub>3</sub>	CMe	CH	N
15	i-Pr	Et	CF <sub>3</sub>	CMe	CH	N
	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CMe	N	N
	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CMe	N	N
20	i-Pr	Br	CF <sub>3</sub>	CMe	N	N
	i-Pr	I	CF <sub>3</sub>	CMe	N	N
25	i-Pr	F	CF <sub>3</sub>	CMe	N	N
	i-Pr	H	CF <sub>3</sub>	CMe	N	N
	i-Pr	Et	CF <sub>3</sub>	CMe	N	N
30	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CEt	CH	N
	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CEt	CH	N
	i-Pr	Br	CF <sub>3</sub>	CEt	CH	N
35	i-Pr	I	CF <sub>3</sub>	CEt	CH	N
	i-Pr	F	CF <sub>3</sub>	CEt	CH	N
40	i-Pr	H	CF <sub>3</sub>	CEt	CH	N
	i-Pr	Et	CF <sub>3</sub>	CEt	CH	N
	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CMe	N	CH
45	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CMe	N	CH
	t-Bu	Br	CF <sub>3</sub>	CMe	N	CH
	t-Bu	I	CF <sub>3</sub>	CMe	N	CH
50	t-Bu	F	CF <sub>3</sub>	CMe	N	CH
	t-Bu	H	CF <sub>3</sub>	CMe	N	CH
55	t-Bu	Et	CF <sub>3</sub>	CMe	N	CH
	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CMe	CH	N
	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CMe	CH	N
60	t-Bu	Br	CF <sub>3</sub>	CMe	CH	N
	t-Bu	I	CF <sub>3</sub>	CMe	CH	N
	t-Bu	F	CF <sub>3</sub>	CMe	CH	N
65	t-Bu	H	CF <sub>3</sub>	CMe	CH	N

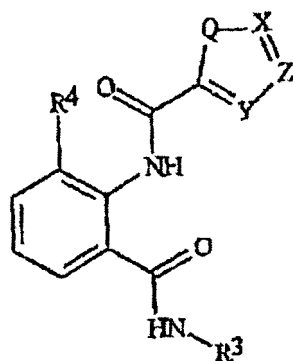
## ES 2 278 738 T3

	t-Bu	Et	CF <sub>3</sub>	CMe	CH	N
5	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CMe	N	N
	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CMe	N	N
	t-Bu	Br	CF <sub>3</sub>	CMe	N	N
10	t-Bu	I	CF <sub>3</sub>	CMe	N	N
	t-Bu	F	CF <sub>3</sub>	CMe	N	N
	t-Bu	H	CF <sub>3</sub>	CMe	N	N
15	t-Bu	Et	CF <sub>3</sub>	CMe	N	N
	i-Pr	Me	OCF <sub>3</sub>	CMe	CH	N
20	i-Pr	Cl	OCF <sub>3</sub>	CMe	CH	N
	i-Pr	Br	OCF <sub>3</sub>	CMe	CH	N
	i-Pr	I	OCF <sub>3</sub>	CMe	CH	N
25	i-Pr	F	OCF <sub>3</sub>	CMe	CH	N
	i-Pr	H	OCF <sub>3</sub>	CMe	CH	N
	i-Pr	Et	OCF <sub>3</sub>	CMe	CH	N
30	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CH	CH	N
	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CH	CH	N
	i-Pr	Br	CF <sub>3</sub>	CH	CH	N
35	i-Pr	I	CF <sub>3</sub>	CH	CH	N
	i-Pr	F	CF <sub>3</sub>	CH	CH	N
40	i-Pr	H	CF <sub>3</sub>	CH	CH	N
	i-Pr	Et	CF <sub>3</sub>	CH	CH	N
	i-Pr	Me	Cl	CMe	CH	N
45	i-Pr	Cl	Cl	CMe	CH	N
	i-Pr	Br	Cl	CMe	CH	N
	i-Pr	I	Cl	CMe	CH	N
50	i-Pr	F	Cl	CMe	CH	N
	i-Pr	H	Cl	CMe	CH	N
55	i-Pr	Et	Cl	CMe	CH	N

60

65

TABLA 7



R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	Q	X	Y	Z
i-Pr	Me	S	CCF <sub>3</sub>	CH	CH
i-Pr	Cl	S	CCF <sub>3</sub>	CH	CH
i-Pr	Br	S	CCF <sub>3</sub>	CH	CH
i-Pr	I	S	CCF <sub>3</sub>	CH	CH
i-Pr	F	S	CCF <sub>3</sub>	CH	CH
i-Pr	H	S	CCF <sub>3</sub>	CH	CH
i-Pr	Et	S	CCF <sub>3</sub>	CH	CH
i-Pr	Me	S	CCF <sub>3</sub>	CMe	CH
i-Pr	Cl	S	CCF <sub>3</sub>	CMe	CH
i-Pr	Br	S	CCF <sub>3</sub>	CMe	CH
i-Pr	I	S	CCF <sub>3</sub>	CMe	CH
i-Pr	F	S	CCF <sub>3</sub>	CMe	CH
i-Pr	H	S	CCF <sub>3</sub>	CMe	CH
i-Pr	Et	S	CCF <sub>3</sub>	CMe	CH
t-Bu	Me	S	CCF <sub>3</sub>	CMe	CH
t-Bu	Cl	S	CCF <sub>3</sub>	CMe	CH
t-Bu	Br	S	CCF <sub>3</sub>	CMe	CH
t-Bu	I	S	CCF <sub>3</sub>	CMe	CH
t-Bu	F	S	CCF <sub>3</sub>	CMe	CH
t-Bu	H	S	CCF <sub>3</sub>	CMe	CH
t-Bu	Et	S	CCF <sub>3</sub>	CMe	CH
i-Pr	Me	S	CCF <sub>3</sub>	CMe	N
i-Pr	Cl	S	CCF <sub>3</sub>	CMe	N
i-Pr	Br	S	CCF <sub>3</sub>	CMe	N
i-Pr	I	S	CCF <sub>3</sub>	CMe	N
i-Pr	F	S	CCF <sub>3</sub>	CMe	N

## ES 2 278 738 T3

	i-Pr	H	S	CCF <sub>3</sub>	CMe	N
5	i-Pr	Et	S	CCF <sub>3</sub>	CMe	N
	i-Pr	Me	S	COCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CMe	N
	i-Pr	Cl	S	COCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CMe	N
10	i-Pr	Br	S	COCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CMe	N
	i-Pr	I	S	COCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CMe	N
	i-Pr	F	S	COCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CMe	N
15	i-Pr	H	S	COCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CMe	N
	i-Pr	Et	S	COCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CMe	N
	i-Pr	Me	S	COCHF <sub>2</sub>	CMe	N
20	i-Pr	Cl	S	COCHF <sub>2</sub>	CMe	N
	i-Pr	Br	S	COCHF <sub>2</sub>	CMe	N
25	i-Pr	I	S	COCHF <sub>2</sub>	CMe	N
	i-Pr	F	S	COCHF <sub>2</sub>	CMe	N
	i-Pr	H	S	COCHF <sub>2</sub>	CMe	N
30	i-Pr	Et	S	COCHF <sub>2</sub>	CMe	N
	i-Pr	Me	O	CCF <sub>3</sub>	CMe	N
	i-Pr	Cl	O	CCF <sub>3</sub>	CMe	N
35	i-Pr	Br	O	CCF <sub>3</sub>	CMe	N
	i-Pr	I	O	CCF <sub>3</sub>	CMe	N
40	i-Pr	F	O	CCF <sub>3</sub>	CMe	N
	i-Pr	H	O	CCF <sub>3</sub>	CMe	N
	i-Pr	Et	O	CCF <sub>3</sub>	CMe	N
45	i-Pr	Me	NMe	N	CH	CCF <sub>3</sub>
	i-Pr	Cl	NMe	N	CH	CCF <sub>3</sub>
	i-Pr	Br	NMe	N	CH	CCF <sub>3</sub>
50	i-Pr	I	NMe	N	CH	CCF <sub>3</sub>
	i-Pr	F	NMe	N	CH	CCF <sub>3</sub>
55	i-Pr	H	NMe	N	CH	CCF <sub>3</sub>
	i-Pr	Et	NMe	N	CH	CCF <sub>3</sub>
	i-Pr	Me	NEt	N	CH	CCF <sub>3</sub>
60	i-Pr	Cl	NEt	N	CH	CCF <sub>3</sub>
	i-Pr	Br	NEt	N	CH	CCF <sub>3</sub>
	i-Pr	I	NEt	N	CH	CCF <sub>3</sub>
65	i-Pr	F	NEt	N	CH	CCF <sub>3</sub>

## ES 2 278 738 T3

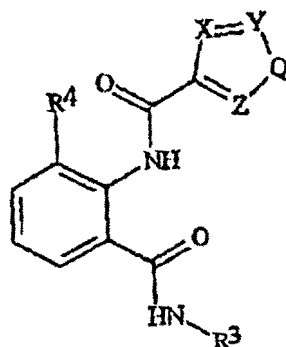
	i-Pr	H	NEt	N	CH	CCF <sub>3</sub>
5	i-Pr	Et	NEt	N	CH	CCF <sub>3</sub>
	i-Pr	Me	NMe	N	CH	CCF <sub>3</sub>
	i-Pr	Cl	NMe	N	CH	CCF <sub>3</sub>
10	i-Pr	Br	NMe	N	CH	CCF <sub>3</sub>
	i-Pr	I	NMe	N	CH	CCF <sub>3</sub>
15	i-Pr	F	NMe	N	CH	CCF <sub>3</sub>
	i-Pr	H	NMe	N	CH	CCF <sub>3</sub>
	i-Pr	Et	NMe	N	CH	CCF <sub>3</sub>
20	t-Bu	Me	NMe	N	CH	CCF <sub>3</sub>
	t-Bu	Cl	NMe	N	CH	CCF <sub>3</sub>
	t-Bu	Br	NMe	N	CH	CCF <sub>3</sub>
25	t-Bu	I	NMe	N	CH	CCF <sub>3</sub>
	t-Bu	F	NMe	N	CH	CCF <sub>3</sub>
	t-Bu	H	NMe	N	CH	CCF <sub>3</sub>
30	t-Bu	Et	NMe	N	CH	CCF <sub>3</sub>
	i-Pr	Me	NMe	CH	N	CCF <sub>3</sub>
35	i-Pr	Cl	NMe	CH	N	CCF <sub>3</sub>
	i-Pr	Br	NMe	CH	N	CCF <sub>3</sub>
	i-Pr	I	NMe	CH	N	CCF <sub>3</sub>
40	i-Pr	F	NMe	CH	N	CCF <sub>3</sub>
	i-Pr	H	NMe	CH	N	CCF <sub>3</sub>
	i-Pr	Et	NMe	CH	N	CCF <sub>3</sub>
45	i-Pr	Me	NMe	N	N	CCF <sub>3</sub>
	i-Pr	Cl	NMe	N	N	CCF <sub>3</sub>
50	i-Pr	Br	NMe	N	N	CCF <sub>3</sub>
	i-Pr	I	NMe	N	N	CCF <sub>3</sub>
	i-Pr	F	NMe	N	N	CCF <sub>3</sub>
55	i-Pr	H	NMe	N	N	CCF <sub>3</sub>
	i-Pr	Et	NMe	N	N	CCF <sub>3</sub>

60

65

## ES 2 278 738 T3

TABLA 8



R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	Q	X	Y	Z
i-Pr	Me	NCHF <sub>2</sub>	CMe	N	CH
i-Pr	Cl	NCHF <sub>2</sub>	CMe	N	CH
i-Pr	Br	NCHF <sub>2</sub>	CMe	N	CH
i-Pr	I	NCHF <sub>2</sub>	CMe	N	CH
i-Pr	F	NCHF <sub>2</sub>	CMe	N	CH
i-Pr	H	NCHF <sub>2</sub>	CMe	N	CH
i-Pr	Et	NCHF <sub>2</sub>	CMe	N	CH
i-Pr	Me	NCHF <sub>2</sub>	CH	N	CMe
i-Pr	Cl	NCHF <sub>2</sub>	CH	N	CMe
i-Pr	Br	NCHF <sub>2</sub>	CH	N	CMe
i-Pr	I	NCHF <sub>2</sub>	CH	N	CMe
i-Pr	F	NCHF <sub>2</sub>	CH	N	CMe
i-Pr	H	NCHF <sub>2</sub>	CH	N	CMe
i-Pr	Et	NCHF <sub>2</sub>	CH	N	CMe
t-Bu	Me	NCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	CMe	N	CH
t-Bu	Cl	NCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	CMe	N	CH
t-Bu	Br	NCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	CMe	N	CH
t-Bu	I	NCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	CMe	N	CH
t-Bu	F	NCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	CMe	N	CH
t-Bu	H	NCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	CMe	N	CH
t-Bu	Et	NCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	CMe	N	CH
i-Pr	Me	NCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	CH	N	CMe
i-Pr	Cl	NCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	CH	N	CMe
i-Pr	Br	NCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	CH	N	CMe
i-Pr	I	NCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	CH	N	CMe
i-Pr	F	NCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	CH	N	CMe

ES 2 278 738 T3

	i-Pr	H	NCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	CH	N	CMe
	i-Pr	Et	NCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	CH	N	CMe
5	i-Pr	Me	NCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CMe	N	CH
	i-Pr	Cl	NCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CMe	N	CH
	i-Pr	Br	NCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CMe	N	CH
10	i-Pr	I	NCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CMe	N	CH
	i-Pr	F	NCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CMe	N	CH
	i-Pr	H	NCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CMe	N	CH
15	i-Pr	Et	NCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CMe	N	CH
	i-Pr	Me	NCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH	N	CMe
20	i-Pr	Cl	NCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH	N	CMe
	i-Pr	Br	NCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH	N	CMe
	i-Pr	I	NCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH	N	CMe
25	i-Pr	F	NCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH	N	CMe
	i-Pr	H	NCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH	N	CMe
	i-Pr	Et	NCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH	N	CMe
30	i-Pr	Me	NCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	N	CH	CMe
	i-Pr	Cl	NCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	N	CH	CMe
35	i-Pr	Br	NCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	N	CH	CMe
	i-Pr	I	NCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	N	CH	CMe
	i-Pr	F	NCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	N	CH	CMe
40	i-Pr	H	NCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	N	CH	CMe
	i-Pr	Et	NCF <sub>2</sub> CHF <sub>2</sub>	N	CH	CMe

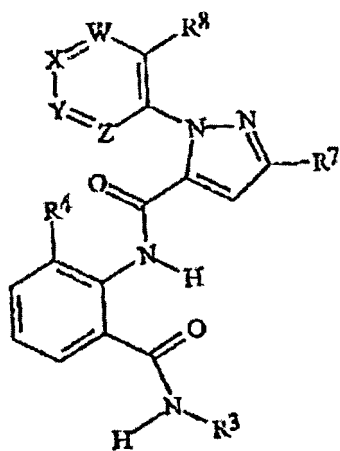
TABLE 9

45

50

55

60



65

W	X	Y	Z	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Me



## ES 2 278 738 T3

	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Me
5	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Br	CF <sub>3</sub>	Me
10	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Br	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	Cl	Me
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	Cl	Me
15	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	Cl	Me
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	Cl	Me
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Br	Cl	Me
20	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Br	Cl	Me
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	Br	Me
25	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	Br	Me
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	Br	Me
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	Br	Me
30	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Br	Br	Me
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Br	Br	Me
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CN	Me
35	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CN	Me
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CN	Me
40	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CN	Me
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Br	CN	Me
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Br	CN	Me
45	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	F
50	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Br	CF <sub>3</sub>	F
55	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Br	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	Cl	F
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	Cl	F
60	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	Cl	F
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	Cl	F
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Br	Cl	F
65	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Br	Cl	F

## ES 2 278 738 T3

	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	Br	F
5	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	Br	F
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	Br	F
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	Br	F
10	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Br	Br	F
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Br	Br	F
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CN	F
15	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CN	F
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CN	F
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CN	F
20	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Br	CN	F
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Br	CN	F
25	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
30	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Br	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Br	CF <sub>3</sub>	Cl
35	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	Cl	Cl
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	Cl	Cl
40	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	Cl	Cl
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	Cl	Cl
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Br	Cl	Cl
45	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Br	Cl	Cl
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	Br	Cl
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	Br	Cl
50	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	Br	Cl
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	Br	Cl
55	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Br	Br	Cl
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Br	Br	Cl
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CN	Cl
60	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CN	Cl
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CN	Cl
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CN	Cl
65	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Br	CN	Cl

## ES 2 278 738 T3

	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Br	CN	Cl
5	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
10	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Br	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Br	CF <sub>3</sub>	Br
15	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	Cl	Br
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	Cl	Br
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	Cl	Br
20	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	Cl	Br
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Br	Cl	Br
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Br	Cl	Br
25	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	Br	Br
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	Br	Br
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	Br	Br
30	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	Br	Br
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Br	Br	Br
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Br	Br	Br
35	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CN	Br
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CN	Br
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CN	Br
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CN	Br
45	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Br	CN	Br
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Br	CN	Br
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CN
50	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
55	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Br	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Br	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	Cl	CN
60	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	Cl	CN
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	Cl	CN
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	Cl	CN
65	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	Cl	CN
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	Cl	CN

## ES 2 278 738 T3

	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Br	Cl	CN
5	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Br	Cl	CN
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	Br	CN
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	Br	CN
10	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	Br	CN
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	Br	CN
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Br	Br	CN
15	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Br	Br	CN
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CN	CN
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CN	CN
20	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CN	CN
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CN	CN
25	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Br	CN	CN
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Br	CN	CN
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Me
30	CH	CH	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
35	CH	CH	CH	N	i-Pr	Br	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Br	CF <sub>3</sub>	Me
40	CH	CH	CH	N	i-Pr	Me	Cl	Me
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Me	Cl	Me
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Cl	Cl	Me
45	CH	CH	CH	N	t-Bu	Cl	Cl	Me
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Br	Cl	Me
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Br	Cl	Me
50	CH	CH	CH	N	i-Pr	Me	Br	Me
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Me	Br	Me
55	CH	CH	CH	N	i-Pr	Cl	Br	Me
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Cl	Br	Me
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Br	Br	Me
60	CH	CH	CH	N	t-Bu	Br	Br	Me
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Me	CN	Me
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Me	CN	Me
65	CH	CH	CH	N	i-Pr	Cl	CN	Me

## ES 2 278 738 T3

	CH	CH	CH	N	t-Bu	Cl	CN	Me
5	CH	CH	CH	N	i-Pr	Br	CN	Me
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Br	CN	Me
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	F
10	CH	CH	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	F
15	CH	CH	CH	N	i-Pr	Br	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Br	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Me	Cl	F
20	CH	CH	CH	N	t-Bu	Me	Cl	F
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Cl	Cl	F
25	CH	CH	CH	N	t-Bu	Cl	Cl	F
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Br	Cl	F
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Br	Cl	F
30	CH	CH	CH	N	i-Pr	Me	Br	F
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Me	Br	F
35	CH	CH	CH	N	i-Pr	Cl	Br	F
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Cl	Br	F
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Br	Br	F
40	CH	CH	CH	N	t-Bu	Br	Br	F
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Me	CN	F
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Me	CN	F
45	CH	CH	CH	N	i-Pr	Cl	CN	F
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Cl	CN	F
50	CH	CH	CH	N	i-Pr	Br	CN	F
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Br	CN	F
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
55	CH	CH	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
60	CH	CH	CH	N	i-Pr	Br	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Br	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Me	Cl	Cl
65	CH	CH	CH	N	t-Bu	Me	Cl	Cl

## ES 2 278 738 T3

	CH	CH	CH	N	i-Pr	Cl	Cl	Cl
5	CH	CH	CH	N	t-Bu	Cl	Cl	Cl
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Br	Cl	Cl
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Br	Cl	Cl
10	CH	CH	CH	N	i-Pr	Me	Br	Cl
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Me	Br	Cl
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Cl	Br	Cl
15	CH	CH	CH	N	t-Bu	Cl	Br	Cl
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Br	Br	Cl
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Br	Br	Cl
20	CH	CH	CH	N	i-Pr	Me	CN	Cl
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Me	CN	Cl
25	CH	CH	CH	N	i-Pr	Cl	CN	Cl
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Cl	CN	Cl
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Br	CN	Cl
30	CH	CH	CH	N	t-Bu	Br	CN	Cl
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Br
35	CH	CH	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
40	CH	CH	CH	N	i-Pr	Br	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Br	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Me	Cl	Br
45	CH	CH	CH	N	t-Bu	Me	Cl	Br
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Cl	Cl	Br
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Cl	Cl	Br
50	CH	CH	CH	N	i-Pr	Br	Cl	Br
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Br	Cl	Br
55	CH	CH	CH	N	i-Pr	Me	Br	Br
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Me	Br	Br
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Cl	Br	Br
60	CH	CH	CH	N	t-Bu	Cl	Br	Br
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Br	Br	Br
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Br	Br	Br
65	CH	CH	CH	N	i-Pr	Me	CN	Br

## ES 2 278 738 T3

	CH	CH	CH	N	t-Bu	Me	CN	Br
5	CH	CH	CH	N	i-Pr	Cl	CN	Br
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Cl	CN	Br
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Br	CN	Br
10	CH	CH	CH	N	t-Bu	Br	CN	Br
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CN
15	CH	CH	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Br	CF <sub>3</sub>	CN
20	CH	CH	CH	N	t-Bu	Br	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Me	Cl	CN
25	CH	CH	CH	N	t-Bu	Me	Cl	CN
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Cl	Cl	CN
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Cl	Cl	CN
30	CH	CH	CH	N	i-Pr	Br	Cl	CN
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Br	Cl	CN
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Me	Br	CN
35	CH	CH	CH	N	t-Bu	Me	Br	CN
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Cl	Br	CN
40	CH	CH	CH	N	t-Bu	Cl	Br	CN
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Br	Br	CN
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Br	Br	CN
45	CH	CH	CH	N	i-Pr	Me	CN	CN
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Me	CN	CN
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Cl	CN	CN
50	CH	CH	CH	N	t-Bu	Cl	CN	CN
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Br	CN	CN
55	CH	CH	CH	N	t-Bu	Br	CN	CN
	CH	CH	CH	CH	Me	Me	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	F
60	CH	CH	CH	CH	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	Me	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	CH	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Me	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	CH	propargilo	Me	CF <sub>3</sub>	F
65	CH	CH	CH	CH	Me	Me	CF <sub>3</sub>	Cl

## ES 2 278 738 T3

	CH	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
5	CH	CH	CH	CH	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	CH	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	CH	propargilo	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
10	CH	CH	CH	CH	Me	Me	Br	F
	CH	CH	CH	CH	Et	Me	Br	F
	CH	CH	CH	CH	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	Me	Br	F
15	CH	CH	CH	CH	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Me	Br	F
	CH	CH	CH	CH	propargilo	Me	Br	F
	CH	CH	CH	CH	Me	Me	Br	Cl
20	CH	CH	CH	CH	Et	Me	Br	Cl
	CH	CH	CH	CH	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	Me	Br	Cl
	CH	CH	CH	CH	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Me	Br	Cl
25	CH	CH	CH	CH	propargilo	Me	Br	Cl
	CH	CH	CH	CH	Me	Cl	CF <sub>3</sub>	F
30	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	CH	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	Cl	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	CH	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Cl	CF <sub>3</sub>	F
35	CH	CH	CH	CH	propargilo	Cl	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	CH	Me	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
40	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	CH	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	CH	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
45	CH	CH	CH	CH	propargilo	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	CH	Me	Cl	Br	F
50	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	Br	F
	CH	CH	CH	CH	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	Cl	Br	F
	CH	CH	CH	CH	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Cl	Br	F
55	CH	CH	CH	CH	propargilo	Cl	Br	F
	CH	CH	CH	CH	Me	Cl	Br	Cl
	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	Br	Cl
60	CH	CH	CH	CH	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	Cl	Br	Cl
	CH	CH	CH	CH	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Cl	Br	Cl
	CH	CH	CH	CH	propargilo	Cl	Br	Cl
65	CH	CH	CH	N	Me	Me	CF <sub>3</sub>	F



## ES 2 278 738 T3

	CH	CH	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	F
5	CH	CH	CH	N	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	Me	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	N	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Me	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	N	propargilo	Me	CF <sub>3</sub>	F
10	CH	CH	CH	N	Me	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	N	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
15	CH	CH	CH	N	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	N	propargilo	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	N	Me	Me	Br	F
20	CH	CH	CH	N	Et	Me	Br	F
	CH	CH	CH	N	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	Me	Br	F
25	CH	CH	CH	N	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Me	Br	F
	CH	CH	CH	N	propargilo	Me	Br	F
	CH	CH	CH	N	Me	Me	Br	Cl
30	CH	CH	CH	N	Et	Me	Br	Cl
	CH	CH	CH	N	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	Me	Br	Cl
	CH	CH	CH	N	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Me	Br	Cl
35	CH	CH	CH	N	propargilo	Me	Br	Cl
	CH	CH	CH	N	Me	Me	CF <sub>3</sub>	F
40	CH	CH	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	N	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	Me	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	N	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Me	CF <sub>3</sub>	F
45	CH	CH	CH	N	propargilo	Cl	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	N	Me	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
50	CH	CH	CH	N	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	N	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
55	CH	CH	CH	N	propargilo	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	N	Me	Cl	Br	F
	CH	CH	CH	N	Et	Cl	Br	F
60	CH	CH	CH	N	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	Cl	Br	F
	CH	CH	CH	N	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Cl	Br	F
	CH	CH	CH	N	propargilo	Cl	Br	F
65	CH	CH	CH	N	Me	Cl	Br	Cl

## ES 2 278 738 T3

	CH	CH	CH	N	Et	Cl	Br	Cl
5	CH	CH	CH	N	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	Cl	Br	Cl
	CH	CH	CH	N	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	Cl	Br	Cl
	CH	CH	CH	N	propargilo	Cl	Br	Cl
10	C-Cl	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	C-F	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	acetileno
15	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me
20	C-Cl	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	C-F	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	acetileno
25	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me
30	C-Cl	CH	CH	CH	i-Pr	Me	Br	Cl
	C-F	CH	CH	CH	i-Pr	Me	Br	F
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	Br	acetileno
35	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	Br	I
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	Br	SO <sub>2</sub> Me
40	C-Cl	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	Br	Cl
	C-F	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	Br	F
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	Br	acetileno
45	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	Br	I
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	Br	SO <sub>2</sub> Me
50	C-Cl	CH	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	C-F	CH	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	acetileno
55	CH	CH	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me
60	C-Cl	CH	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	C-F	CH	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	acetileno
65	CH	CH	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	SO <sub>2</sub> Me
	C-Cl	CH	CH	N	i-Pr	Me	Br	Cl

## ES 2 278 738 T3

	C-F	CH	CH	N	i-Pr	Me	Br	F	
5		CH	CH	CH	N	i-Pr	Me	Br	acetileno
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Me	Br	I	
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Me	Br	SO <sub>2</sub> Me	
10		C-Cl	CH	CH	N	i-Pr	Cl	Br	Cl
	C-F	CH	CH	N	i-Pr	Cl	Br	F	
15		CH	CH	CH	N	i-Pr	Cl	Br	acetileno
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Cl	Br	I	
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Cl	Br	SO <sub>2</sub> Me	
20		CH	N	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	H
	CH	N	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Me	
	CH	N	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Cl	
25		CH	N	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	H
	CH	N	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Me	
	CH	N	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl	
30		CH	N	CH	N	i-Pr	Me	CN	H
	CH	N	CH	N	i-Pr	Me	CN	Me	
	CH	N	CH	N	i-Pr	Me	CN	Cl	
35		CH	N	CH	N	i-Pr	Cl	CN	H
	CH	N	CH	N	i-Pr	Cl	CN	Me	
40		CH	N	CH	N	i-Pr	Cl	CN	Cl
	CH	N	CH	N	i-Pr	Me	Br	H	
45		CH	N	CH	N	i-Pr	Me	Br	Me
	CH	N	CH	N	i-Pr	Me	Br	Cl	
	CH	N	CH	N	i-Pr	Cl	Br	H	
50		CH	N	CH	N	i-Pr	Cl	Br	Me
	CH	N	CH	N	i-Pr	Cl	Br	Cl	
	CH	N	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	H	
55		CH	N	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	N	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Cl	
	CH	N	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	H	
60		CH	N	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	N	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl	
	CH	N	CH	N	t-Bu	Me	CN	H	
65		CH	N	CH	N	t-Bu	Me	CN	Me

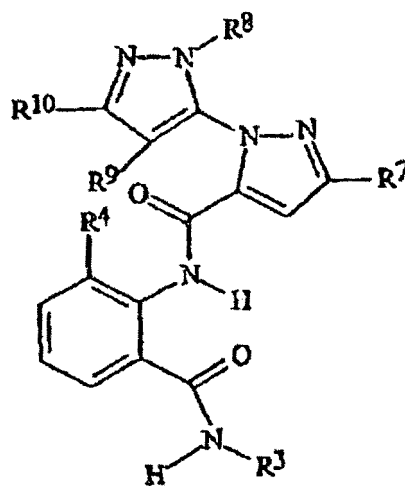
## ES 2 278 738 T3

	CH	N	CH	N	t-Bu	Me	CN	Cl
5	CH	N	CH	N	t-Bu	Cl	CN	H
	CH	N	CH	N	t-Bu	Cl	CN	Me
	CH	N	CH	N	t-Bu	Cl	CN	Cl
10	CH	N	CH	N	t-Bu	Me	Br	H
	CH	N	CH	N	t-Bu	Me	Br	Me
	CH	N	CH	N	t-Bu	Me	Br	Cl
15	CH	N	CH	N	t-Bu	Cl	Br	H
	CH	N	CH	N	t-Bu	Cl	Br	Me
	CH	N	CH	N	t-Bu	Cl	Br	Cl
20	CH	CH	N	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	H
	CH	CH	N	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Me
25	CH	CH	N	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	N	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	H
	CH	CH	N	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
30	CH	CH	N	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	N	N	i-Pr	Me	CN	H
35	CH	CH	N	N	i-Pr	Me	CN	Me
	CH	CH	N	N	i-Pr	Me	CN	Cl
	CH	CH	N	N	i-Pr	Cl	CN	H
40	CH	CH	N	N	i-Pr	Cl	CN	Me
	CH	CH	N	N	i-Pr	Cl	CN	Cl
	CH	CH	N	N	i-Pr	Me	Br	H
45	CH	CH	N	N	i-Pr	Me	Br	Me
	CH	CH	N	N	i-Pr	Me	Br	Cl
	CH	CH	N	N	i-Pr	Cl	Br	H
50	CH	CH	N	N	i-Pr	Cl	Br	Me
	CH	CH	N	N	i-Pr	Cl	Br	Cl
55	CH	CH	N	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	H
	CH	CH	N	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	N	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
60	CH	CH	N	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	H
	CH	CH	N	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	N	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
65	CH	CH	N	N	i-Pr	Me	CN	H

ES 2 278 738 T3

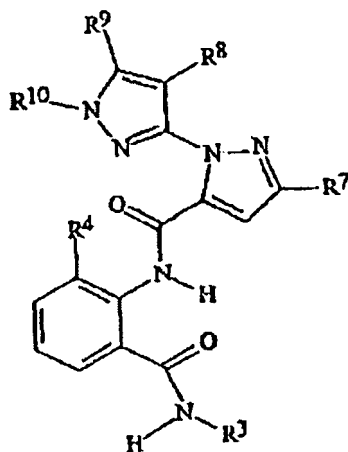
	CH	CH	N	N	i-Pr	Me	CN	Me
	CH	CH	N	N	i-Pr	Me	CN	Cl
5	CH	CH	N	N	i-Pr	Cl	CN	H
	CH	CH	N	N	i-Pr	Cl	CN	Me
10	CH	CH	N	N	i-Pr	Cl	CN	Cl
	CH	CH	N	N	i-Pr	Me	Br	H
	CH	CH	N	N	i-Pr	Me	Br	Me
15	CH	CH	N	N	i-Pr	Me	Br	Cl
	CH	CH	N	N	i-Pr	Cl	Br	H
	CH	CH	N	N	i-Pr	Cl	Br	Me
20	CH	CH	N	N	i-Pr	Cl	Br	Cl

TABLA 10



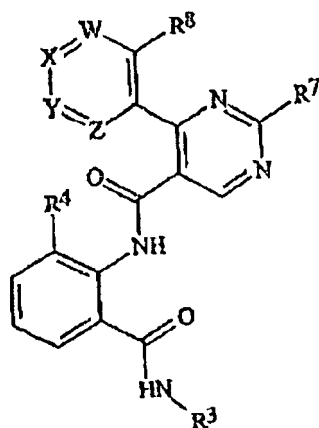
R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>	R <sup>10</sup>
Me	CF <sub>3</sub>	i-Pr	Me	H	H
Me	CF <sub>3</sub>	i-Pr	Me	H	Me
Me	CF <sub>3</sub>	i-Pr	Me	Cl	H
Me	CF <sub>3</sub>	i-Pr	Me	Cl	Me
Me	CF <sub>3</sub>	i-Pr	Me	Me	Me
Me	CF <sub>3</sub>	t-Bu	Me	H	H
Me	CF <sub>3</sub>	t-Bu	Me	H	Me
Me	CF <sub>3</sub>	t-Bu	Me	Cl	H
Me	CF <sub>3</sub>	t-Bu	Me	Cl	Me
Me	CF <sub>3</sub>	t-Bu	Me	Me	Me

TABLA 11



R <sup>1</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>	R <sup>9</sup>	R <sup>10</sup>
Me	CF <sub>3</sub>	i-Pr	Me	H	Me
Me	CF <sub>3</sub>	i-Pr	Me	Me	Me
Me	CF <sub>3</sub>	i-Pr	Cl	H	Me
Me	CF <sub>3</sub>	i-Pr	Cl	Me	Me
Me	CF <sub>3</sub>	t-Bu	Me	H	Me
Me	CF <sub>3</sub>	t-Bu	Me	Me	Me
Me	CF <sub>3</sub>	t-Bu	Cl	H	Me
Me	CF <sub>3</sub>	t-Bu	Cl	Me	Me

TABLA 12



W	X	Y	Z	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
CH	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
CH	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Br
CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Br

## ES 2 278 738 T3

	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Br
5	CH	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	I
10	CH	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	F
15	CH	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Me
20	CH	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
25	CH	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
30	CH	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CN
35	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
40	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
45	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	I
50	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	F
55	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
60	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
65	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>

## ES 2 278 738 T3

	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
5	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
10	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
15	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
20	CH	CH	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Br
25	CH	CH	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	I
30	CH	CH	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	I
35	CH	CH	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	F
40	CH	CH	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Me
45	CH	CH	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
50	CH	CH	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
55	CH	CH	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CN
60	CH	CH	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
65	CH	CH	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl



## ES 2 278 738 T3

	CH	CH	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
5	CH	CH	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	I
10	CH	CH	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	F
15	CH	CH	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	F
20	CH	CH	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
25	CH	CH	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
30	CH	CH	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
35	CH	CH	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
40	CH	CH	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	N	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	N	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
45	CH	CH	N	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	N	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	N	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Br
50	CH	CH	N	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	N	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	I
55	CH	CH	N	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	N	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	N	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	F
60	CH	CH	N	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	N	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	N	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Me
65	CH	CH	N	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Me

## ES 2 278 738 T3

	CH	CH	N	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Me
5	CH	CH	N	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	N	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	N	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
10	CH	CH	N	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	N	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	N	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
15	CH	CH	N	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	N	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CN
20	CH	CH	N	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	N	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	N	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
25	CH	CH	N	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	N	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	N	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
30	CH	CH	N	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	N	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	I
35	CH	CH	N	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	N	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	N	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	F
40	CH	CH	N	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	N	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	N	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
45	CH	CH	N	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	N	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
50	CH	CH	N	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	N	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	N	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
55	CH	CH	N	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	N	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	N	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
60	CH	CH	N	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	N	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
65	CH	CH	N	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	N	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Cl

## ES 2 278 738 T3

	CH	N	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
5	CH	N	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	N	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	N	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Br
10	CH	N	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	N	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	I
	CH	N	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	I
15	CH	N	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	I
	CH	N	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	F
	CH	N	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	F
20	CH	N	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	F
	CH	N	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Me
25	CH	N	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	N	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	N	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
30	CH	N	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	N	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
35	CH	N	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	N	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	N	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
40	CH	N	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	N	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	N	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CN
45	CH	N	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	N	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	N	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
50	CH	N	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	N	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
55	CH	N	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	N	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	I
	CH	N	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	I
60	CH	N	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	I
	CH	N	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	F
	CH	N	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	F
65	CH	N	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	F

## ES 2 278 738 T3

	CH	N	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
5	CH	N	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	N	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	N	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
10	CH	N	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	N	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	N	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
15	CH	N	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	N	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	N	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
20	CH	N	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	N	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
25	N	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	N	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	N	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
30	N	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Br
	N	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Br
	N	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Br
35	N	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	I
	N	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	I
40	N	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	I
	N	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	F
	N	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	F
45	N	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	F
	N	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Me
50	N	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Me
	N	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Me
	N	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
55	N	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	N	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	N	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
60	N	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
	N	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
	N	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CN
65	N	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CN

## ES 2 278 738 T3

	N	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CN
5	N	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	N	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	N	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
10	N	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
	N	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
	N	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
15	N	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	I
	N	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	I
20	N	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	I
	N	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	F
	N	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	F
25	N	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	F
	N	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	N	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
30	N	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	N	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
35	N	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	N	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	N	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
40	N	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
	N	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
	N	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
45	N	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
	N	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
50	CH	N	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	N	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	N	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
55	CH	N	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	N	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	N	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Br
60	CH	N	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	I
	CH	N	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	I
65	CH	N	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	I
	CH	N	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	F

## ES 2 278 738 T3

	CH	N	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	F
5	CH	N	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	F
	CH	N	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	N	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Me
10	CH	N	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	N	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	N	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
15	CH	N	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	N	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	N	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
20	CH	N	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	N	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CN
25	CH	N	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	N	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	N	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
30	CH	N	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	N	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	N	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
35	CH	N	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	N	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
40	CH	N	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	I
	CH	N	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	I
	CH	N	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	I
45	CH	N	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	F
	CH	N	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	F
	CH	N	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	F
50	CH	N	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	N	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
55	CH	N	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	N	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	N	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
60	CH	N	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	N	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	N	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
65	CH	N	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe

## ES 2 278 738 T3

	CH	N	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
5	CH	N	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	N	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	CH	CCl	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
10	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	CCl	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Br
15	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	CH	CCl	Et	Me	CF <sub>3</sub>	I
20	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	CH	CCl	Et	Me	CF <sub>3</sub>	F
25	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	CCl	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Me
30	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Me
35	CH	CH	CH	CCl	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
40	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	CCl	Et	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
45	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	CH	CCl	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CN
50	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	CH	CCl	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
55	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	CCl	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
60	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	CH	CCl	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	I
65	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	I

## ES 2 278 738 T3

	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	I
5	CH	CH	CH	CCl	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	F
10	CH	CH	CH	CCl	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
15	CH	CH	CH	CCl	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
20	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	CCl	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
25	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	CH	CCl	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
30	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	CH	CF	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
35	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	CF	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Br
40	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	CH	CF	Et	Me	CF <sub>3</sub>	I
45	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	I
50	CH	CH	CH	CF	Et	Me	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	F
55	CH	CH	CH	CF	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Me
60	CH	CH	CH	CF	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
65	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	CF	Et	Me	CF <sub>3</sub>	OMe



## ES 2 278 738 T3

	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
5	CH	CH	CH	CF	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CN
10	CH	CH	CH	CF	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
15	CH	CH	CH	CF	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
20	CH	CH	CH	CF	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	I
25	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	F
30	CH	CH	CH	CF	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
35	CH	CH	CH	CF	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
40	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	CF	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
45	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	CH	CF	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
50	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	CH	CH	Et	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Cl
55	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Cl
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Cl
	CH	CH	CH	CH	Et	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Br
60	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Br
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Br
	CH	CH	CH	CH	Et	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	I
65	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	I

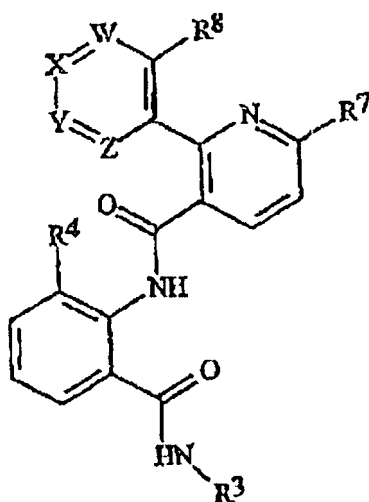
## ES 2 278 738 T3

	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	I
5	CH	CH	CH	CH	Et	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	F
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	F
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	F
10	CH	CH	CH	CH	Et	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Me
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Me
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Me
15	CH	CH	CH	CH	Et	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CF <sub>3</sub>
20	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	CH	Et	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	OMe
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	OMe
25	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	OMe
	CH	CH	CH	CH	Et	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CN
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CN
30	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CN
	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Cl
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Cl
35	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Cl
	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Br
40	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Br
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Br
	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	I
45	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	I
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	I
50	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	F
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	F
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	F
55	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Me
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Me
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Me
60	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CF <sub>3</sub>
65	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	OMe

ES 2 278 738 T3

CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	OMe
CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	OMe
CH	CH	CH	CH	Et	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CN
CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CN
CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CN

TABLA 13



W	X	Y	Z	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
CH	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
CH	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Br
CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Br
CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Br
CH	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	I
CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	I
CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	I
CH	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	F
CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	F
CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	F
CH	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Me
CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Me
CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Me
CH	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>

## ES 2 278 738 T3

	CH	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
5	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CN
10	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
15	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
20	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
25	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	I
30	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	F
35	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
40	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
45	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
50	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
55	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
60	CH	CH	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Br
65	CH	CH	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Br

## ES 2 278 738 T3

	CH	CH	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Br
5	CH	CH	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	I
10	CH	CH	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	F
15	CH	CH	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Me
20	CH	CH	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
25	CH	CH	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
30	CH	CH	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CN
35	CH	CH	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
40	CH	CH	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
45	CH	CH	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
50	CH	CH	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	I
55	CH	CH	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	F
60	CH	CH	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
65	CH	CH	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>

## ES 2 278 738 T3

	CH	CH	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
5	CH	CH	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
10	CH	CH	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
15	CH	CH	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	N	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	N	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
20	CH	CH	N	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	N	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Br
25	CH	CH	N	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	N	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	N	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	I
30	CH	CH	N	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	N	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	N	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	F
35	CH	CH	N	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	N	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	F
40	CH	CH	N	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	N	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	N	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Me
45	CH	CH	N	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	N	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	N	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
50	CH	CH	N	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	N	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
55	CH	CH	N	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	N	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	N	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CN
60	CH	CH	N	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	N	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	N	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
65	CH	CH	N	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl

## ES 2 278 738 T3

	CH	CH	N	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
5	CH	CH	N	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	N	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	N	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	I
10	CH	CH	N	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	N	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	N	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	F
15	CH	CH	N	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	N	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	N	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
20	CH	CH	N	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	N	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	N	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
25	CH	CH	N	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	N	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	N	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
30	CH	CH	N	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	N	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	N	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
35	CH	CH	N	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	N	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	N	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
40	CH	N	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	N	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	N	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Br
45	CH	N	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	N	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	N	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	I
50	CH	N	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	I
	CH	N	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	I
	CH	N	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	F
55	CH	N	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	F
	CH	N	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	F
	CH	N	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Me
60	CH	N	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	N	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Me
65	CH	N	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	N	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Me

## ES 2 278 738 T3

	CH	N	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Me
5	CH	N	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	N	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	N	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
10	CH	N	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	N	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	N	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
15	CH	N	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	N	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CN
20	CH	N	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	N	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	N	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
25	CH	N	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	N	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	N	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
30	CH	N	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	N	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	I
35	CH	N	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	I
	CH	N	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	I
	CH	N	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	F
40	CH	N	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	F
	CH	N	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	F
	CH	N	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
45	CH	N	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	N	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	N	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
50	CH	N	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	N	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
55	CH	N	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	N	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	N	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
60	CH	N	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	N	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	N	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
65	N	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Cl



## ES 2 278 738 T3

	N	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
5	N	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	N	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Br
	N	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Br
10	N	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Br
	N	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	I
	N	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	I
15	N	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	I
	N	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	F
	N	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	F
20	N	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	F
	N	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Me
25	N	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Me
	N	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Me
	N	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
30	N	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	N	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
35	N	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
	N	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
	N	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
40	N	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CN
	N	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CN
	N	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CN
45	N	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	N	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
50	N	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	N	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
	N	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
55	N	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
	N	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	I
	N	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	I
60	N	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	I
	N	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	F
	N	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	F
65	N	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	F

## ES 2 278 738 T3

	N	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
5	N	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	N	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	N	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
10	N	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	N	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	N	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
15	N	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
	N	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
	N	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
20	N	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
	N	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
25	CH	N	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	N	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	N	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
30	CH	N	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	N	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	N	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Br
35	CH	N	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	I
	CH	N	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	I
40	CH	N	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	I
	CH	N	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	F
	CH	N	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	F
45	CH	N	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	F
	CH	N	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	N	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Me
50	CH	N	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	N	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
55	CH	N	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	N	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	N	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
60	CH	N	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	N	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	N	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CN
65	CH	N	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CN

## ES 2 278 738 T3

	CH	N	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CN
5	CH	N	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	N	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	N	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
10	CH	N	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	N	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	N	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
15	CH	N	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	I
	CH	N	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	I
	CH	N	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	I
20	CH	N	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	F
	CH	N	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	F
25	CH	N	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	F
	CH	N	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	N	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
30	CH	N	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	N	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
35	CH	N	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	N	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	N	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
40	CH	N	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	N	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	N	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
45	CH	N	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	N	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
50	CH	CH	CH	CCl	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
55	CH	CH	CH	CCl	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Br
60	CH	CH	CH	CCl	Et	Me	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	I
65	CH	CH	CH	CCl	Et	Me	CF <sub>3</sub>	F

## ES 2 278 738 T3

	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	F
5	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	CCl	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Me
10	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	CH	CCl	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
15	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	CCl	Et	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
20	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	CH	CCl	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CN
25	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	CH	CCl	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
30	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	CCl	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
35	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
40	CH	CH	CH	CCl	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	I
45	CH	CH	CH	CCl	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	F
50	CH	CH	CH	CCl	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
55	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	CH	CCl	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
60	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	CCl	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
65	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe

## ES 2 278 738 T3

	CH	CH	CH	CCl	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
5	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	CH	CF	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
10	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	CF	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Br
15	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	CH	CF	Et	Me	CF <sub>3</sub>	I
20	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	I
25	CH	CH	CH	CF	Et	Me	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	F
30	CH	CH	CH	CF	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Me
35	CH	CH	CH	CF	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
40	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	CF	Et	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
45	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	CH	CF	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CN
50	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	CH	CF	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
55	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	CF	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
60	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	CH	CF	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	I
65	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	I

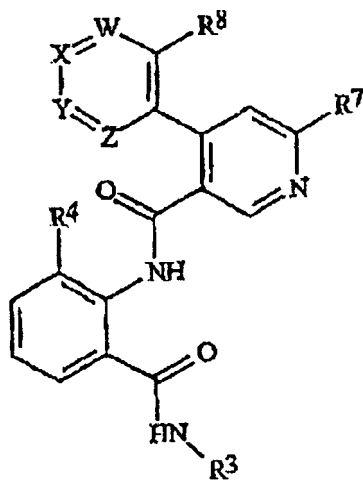
## ES 2 278 738 T3

	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	I
5	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	CF	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
10	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	CH	CF	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
15	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	CF	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
20	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
25	CH	CH	CH	CF	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
30	CH	CH	CH	CH	Et	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Cl
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Cl
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Cl
35	CH	CH	CH	CH	Et	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Br
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Br
40	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Br
	CH	CH	CH	CH	Et	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	I
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	I
45	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	I
	CH	CH	CH	CH	Et	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	F
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	F
50	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	F
	CH	CH	CH	CH	Et	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Me
55	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Me
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Me
	CH	CH	CH	CH	Et	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CF <sub>3</sub>
60	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	CH	Et	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	OMe
65	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	OMe

## ES 2 278 738 T3

	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	OMe
5	CH	CH	CH	CH	Et	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CN
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CN
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CN
10	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Cl
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Cl
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Cl
15	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Br
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Br
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Br
20	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	I
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	I
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	I
25	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	F
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	F
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	F
30	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Me
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Me
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Me
35	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CF <sub>3</sub>
40	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	OMe
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	OMe
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	OMe
45	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CN
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CN
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CN
50								
55								
60								
65								

TABLA 14



W	X	Y	Z	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
CH	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
CH	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Br
CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Br
CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Br
CH	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	I
CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	I
CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	I
CH	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	F
CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	F
CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	F
CH	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Me
CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Me
CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Me
CH	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
CH	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
CH	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CN
CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CN
CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CN



## ES 2 278 738 T3

	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
5	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
10	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	I
15	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	I
20	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	F
25	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
30	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
35	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
40	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
45	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
50	CH	CH	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Br
55	CH	CH	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Br
60	CH	CH	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	I
65	CH	CH	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	F

## ES 2 278 738 T3

	CH	CH	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	F
5	CH	CH	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Me
10	CH	CH	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
15	CH	CH	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
20	CH	CH	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CN
25	CH	CH	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
30	CH	CH	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
35	CH	CH	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	I
40	CH	CH	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	F
45	CH	CH	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
50	CH	CH	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
55	CH	CH	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
60	CH	CH	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
65	CH	CH	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CN

## ES 2 278 738 T3

	CH	CH	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
5	CH	CH	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	N	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	N	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
10	CH	CH	N	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	N	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	N	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Br
15	CH	CH	N	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	N	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	N	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	I
20	CH	CH	N	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	N	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	N	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	F
25	CH	CH	N	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	N	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	N	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Me
30	CH	CH	N	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	N	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	N	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
35	CH	CH	N	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	N	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	N	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	N	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
45	CH	CH	N	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	N	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	N	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CN
50	CH	CH	N	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	N	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	N	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
55	CH	CH	N	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	N	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
60	CH	CH	N	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	N	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	N	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	I
65	CH	CH	N	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	I

## ES 2 278 738 T3

	CH	CH	N	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	F
5	CH	CH	N	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	N	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	N	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
10	CH	CH	N	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	N	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	N	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
15	CH	CH	N	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	N	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	N	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
20	CH	CH	N	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	N	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
25	CH	CH	N	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	N	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	N	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
30	CH	N	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	N	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
35	CH	N	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	N	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	N	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Br
40	CH	N	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	N	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	I
	CH	N	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	I
45	CH	N	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	I
	CH	N	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	F
	CH	N	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	F
50	CH	N	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	F
	CH	N	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Me
55	CH	N	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	N	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	N	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
60	CH	N	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	N	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
65	CH	N	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	N	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	OMe

## ES 2 278 738 T3

	CH	N	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
5	CH	N	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	N	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	N	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CN
10	CH	N	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	N	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	N	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
15	CH	N	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	N	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	N	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
20	CH	N	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	I
	CH	N	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	I
25	CH	N	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	I
	CH	N	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	F
	CH	N	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	F
30	CH	N	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	F
	CH	N	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
35	CH	N	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	N	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	N	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
40	CH	N	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	N	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	N	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
45	CH	N	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	N	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
50	CH	N	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	N	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	N	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
55	N	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	N	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	N	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
60	N	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Br
	N	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Br
	N	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Br
65	N	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	I

## ES 2 278 738 T3

	N	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	I
5	N	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	I
	N	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	F
	N	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	F
10	N	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	F
	N	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Me
	N	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Me
15	N	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Me
	N	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	N	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
20	N	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	N	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
25	N	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
	N	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
	N	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CN
30	N	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CN
	N	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CN
	N	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
35	N	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	N	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
40	N	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
	N	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
	N	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
45	N	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	I
	N	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	I
	N	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	I
50	N	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	F
	N	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	F
55	N	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	F
	N	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	N	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
60	N	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	N	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	N	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
65	N	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>

## ES 2 278 738 T3

	N	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
5	N	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
	N	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
	N	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
10	N	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
	N	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	N	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
15	CH	N	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	N	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	N	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Br
20	CH	N	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	N	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	N	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	I
25	CH	N	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	I
	CH	N	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	I
	CH	N	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	F
30	CH	N	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	F
	CH	N	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	F
	CH	N	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Me
35	CH	N	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	N	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	N	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	N	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
45	CH	N	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	N	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	N	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
50	CH	N	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	N	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	N	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CN
55	CH	N	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	N	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
60	CH	N	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	N	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	N	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
65	CH	N	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Br

## ES 2 278 738 T3

	CH	N	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
5	CH	N	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	I
	CH	N	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	I
	CH	N	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	I
10	CH	N	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	F
	CH	N	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	F
	CH	N	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	F
15	CH	N	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	N	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	N	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
20	CH	N	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	N	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	N	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
25	CH	N	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	N	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	N	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
30	CH	N	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	N	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	N	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
35	CH	CH	CH	CCl	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
40	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	CCl	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Br
45	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	CH	CCl	Et	Me	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	I
50	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	CH	CCl	Et	Me	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	F
55	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	CCl	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Me
60	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	CH	CCl	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
65	CH	CH	CH	CCl	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>



## ES 2 278 738 T3

5	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	CCl	Et	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
10	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	CH	CCl	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CN
15	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	CH	CCl	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
20	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	CCl	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
25	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	CH	CCl	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	I
30	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	CH	CCl	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	F
35	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	CCl	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
40	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
45	CH	CH	CH	CCl	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
50	CH	CH	CH	CCl	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
55	CH	CH	CH	CCl	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
60	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	CH	CF	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
65	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Cl

## ES 2 278 738 T3

	CH	CH	CH	CF	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Br
5	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	CH	CF	Et	Me	CF <sub>3</sub>	I
10	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	CH	CF	Et	Me	CF <sub>3</sub>	F
15	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	CF	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Me
20	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	CH	CF	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
25	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	CF	Et	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
30	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
35	CH	CH	CH	CF	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CN
40	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	CH	CF	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
45	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	CF	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
50	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	CH	CF	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	I
55	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	F
60	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	CF	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
65	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Me

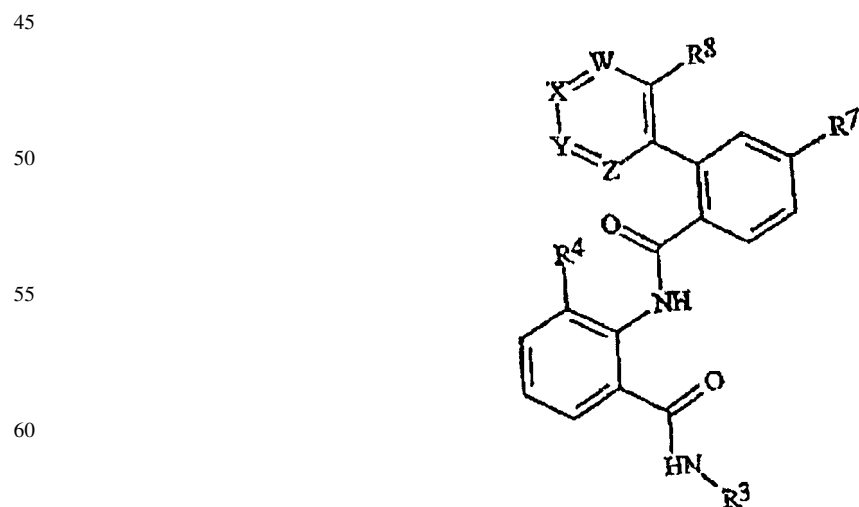
## ES 2 278 738 T3

	CH	CH	CH	CF	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
5	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	CF	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
10	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	CH	CF	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
15	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
20	CH	CH	CH	CH	Et	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Cl
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Cl
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Cl
25	CH	CH	CH	CH	Et	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Br
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Br
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Br
30	CH	CH	CH	CH	Et	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	I
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	I
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	I
35	CH	CH	CH	CH	Et	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	F
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	F
40	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	F
	CH	CH	CH	CH	Et	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Me
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Me
45	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Me
	CH	CH	CH	CH	Et	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CF <sub>3</sub>
50	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	CH	Et	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	OMe
55	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	OMe
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	OMe
	CH	CH	CH	CH	Et	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CN
60	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CN
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CN
	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Cl
65	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Cl

ES 2 278 738 T3

5	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Cl
	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Br
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Br
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Br
	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	I
10	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	I
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	I
	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	F
15	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	F
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	F
	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Me
20	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Me
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Me
25	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CF <sub>3</sub>
30	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	OMe
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	OMe
35	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	OMe
	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CN
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CN
40	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CN

TABLE 15



65

W	X	Y	Z	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
CH	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Cl

## ES 2 278 738 T3

	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
5	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Br
10	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	I
15	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	F
20	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Me
25	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
30	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
35	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
40	CH	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CN
45	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
50	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
55	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	I
60	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	F
65	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	F

## ES 2 278 738 T3

	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
5	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
10	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
15	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
20	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
25	CH	CH	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
30	CH	CH	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Br
35	CH	CH	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	I
40	CH	CH	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	F
45	CH	CH	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Me
50	CH	CH	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
55	CH	CH	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
60	CH	CH	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CN
65	CH	CH	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CN

## ES 2 278 738 T3

	CH	CH	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CN
5	CH	CH	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
10	CH	CH	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
15	CH	CH	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	I
20	CH	CH	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	F
25	CH	CH	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
30	CH	CH	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
35	CH	CH	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
40	CH	CH	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
45	CH	CH	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	N	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
50	CH	CH	N	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	N	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	N	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Br
55	CH	CH	N	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	N	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Br
60	CH	CH	N	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	N	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	N	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	I
65	CH	CH	N	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	F

## ES 2 278 738 T3

	CH	CH	N	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	F
5	CH	CH	N	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	N	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	N	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Me
10	CH	CH	N	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	N	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	N	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
15	CH	CH	N	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	N	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	N	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
20	CH	CH	N	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	N	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CN
25	CH	CH	N	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	N	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	N	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
30	CH	CH	N	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	N	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	N	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
35	CH	CH	N	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	N	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
40	CH	CH	N	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	N	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	N	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	I
45	CH	CH	N	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	N	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	N	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	F
50	CH	CH	N	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	N	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
55	CH	CH	N	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	N	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	N	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
60	CH	CH	N	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	N	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	N	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
65	CH	CH	N	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe



## ES 2 278 738 T3

	CH	CH	N	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
5	CH	CH	N	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	N	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	N	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
10	CH	N	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	N	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	N	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Br
15	CH	N	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	N	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	N	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	I
20	CH	N	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	I
	CH	N	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	I
	CH	N	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	F
25	CH	N	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	F
	CH	N	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	F
	CH	N	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Me
30	CH	N	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	N	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Me
35	CH	N	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	N	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
40	CH	N	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	N	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	N	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
45	CH	N	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	N	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CN
50	CH	N	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	N	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	N	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
55	CH	N	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	N	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	N	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
60	CH	N	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	N	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	N	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	I
65	CH	N	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	I

## ES 2 278 738 T3

	CH	N	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	I
5	CH	N	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	F
	CH	N	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	F
	CH	N	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	F
10	CH	N	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	N	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	N	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
15	CH	N	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	N	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
20	CH	N	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	N	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	N	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
25	CH	N	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	N	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	N	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
30	CH	N	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
	N	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
35	N	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	N	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	N	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Br
40	N	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Br
	N	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Br
	N	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	I
45	N	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	I
	N	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	I
50	N	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	F
	N	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	F
	N	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	F
55	N	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Me
	N	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Me
	N	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Me
60	N	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	N	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
65	N	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	N	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	OMe

## ES 2 278 738 T3

	N	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
5	N	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
	N	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CN
	N	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CN
10	N	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CN
	N	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	N	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
15	N	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	N	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
20	N	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
	N	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
	N	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	I
25	N	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	I
	N	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	I
	N	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	F
30	N	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	F
	N	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	F
35	N	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	N	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	N	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
40	N	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	N	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	N	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
45	N	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
	N	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
50	N	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
	N	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
	N	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
55	N	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	N	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	N	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
60	CH	N	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	N	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	N	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Br
65	CH	N	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Br

## ES 2 278 738 T3

5	CH	N	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	I
	CH	N	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	I
	CH	N	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	I
	CH	N	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	F
10	CH	N	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	F
	CH	N	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	F
	CH	N	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Me
15	CH	N	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	N	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Me
20	CH	N	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	N	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	N	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
25	CH	N	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	N	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	N	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
30	CH	N	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	N	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	N	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CN
35	CH	N	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	N	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
40	CH	N	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	N	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	N	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
45	CH	N	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	N	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	I
50	CH	N	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	I
	CH	N	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	I
	CH	N	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	F
55	CH	N	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	F
	CH	N	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	F
	CH	N	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
60	CH	N	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	N	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	N	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
65	CH	N	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>

## ES 2 278 738 T3

	CH	N	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
5	CH	N	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	N	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	N	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
10	CH	N	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	N	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	N	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
15	CH	CH	CH	CCl	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
20	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	CCl	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Br
25	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	CH	CCl	Et	Me	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	I
30	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	CH	CCl	Et	Me	CF <sub>3</sub>	F
35	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	CCl	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Me
40	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	CH	CCl	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
45	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
50	CH	CH	CH	CCl	Et	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
55	CH	CH	CH	CCl	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CN
60	CH	CH	CH	CCl	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
65	CH	CH	CH	CCl	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Br

## ES 2 278 738 T3

	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
5	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	CH	CCl	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	I
10	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	CH	CCl	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	F
15	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	CCl	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
20	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	CH	CCl	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
25	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	CCl	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
30	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	CH	CCl	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
35	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
40	CH	CH	CH	CF	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
45	CH	CH	CH	CF	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Br
50	CH	CH	CH	CF	Et	Me	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	I
55	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	CH	CF	Et	Me	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	F
60	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	CF	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Me
65	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Me

## ES 2 278 738 T3

	CH	CH	CH	CF	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
5	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	CF	Et	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
10	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	CH	CF	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CN
15	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	CH	CF	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
20	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	CF	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
25	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	CH	CF	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	I
30	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	F
35	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	CF	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
40	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
45	CH	CH	CH	CF	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
50	CH	CH	CH	CF	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
55	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	CH	CF	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
60	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	CH	CH	Et	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Cl
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Cl
65	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Cl

## ES 2 278 738 T3

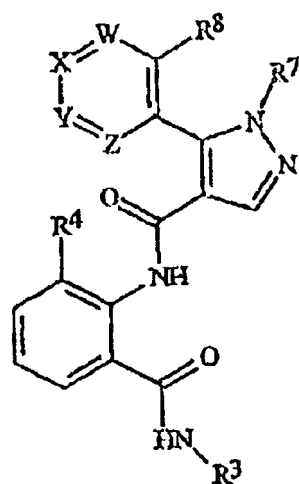
	CH	CH	CH	CH	Et	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Br
5	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Br
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Br
	CH	CH	CH	CH	Et	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	I
10	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	I
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	I
	CH	CH	CH	CH	Et	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	F
15	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	F
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	F
	CH	CH	CH	CH	Et	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Me
20	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Me
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Me
25	CH	CH	CH	CH	Et	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CF <sub>3</sub>
30	CH	CH	CH	CH	Et	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	OMe
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	OMe
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	OMe
35	CH	CH	CH	CH	Et	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CN
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CN
40	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CN
	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Cl
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Cl
45	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Cl
	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Br
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Br
50	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Br
	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	I
55	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	I
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	I
	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	F
60	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	F
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	F
	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Me
65	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Me



ES 2 278 738 T3

	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Me
	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CF <sub>3</sub>
5	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	OMe
10	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	OMe
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	OMe
	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CN
15	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CN
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CN

TABLE 16



	W	X	Y	Z	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
	CH	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
45	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Br
50	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	I
55	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	F
60	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	F
65	CH	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Me

## ES 2 278 738 T3

	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Me
5	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
10	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
15	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CN
20	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
25	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
30	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	I
35	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	I
40	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	F
45	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
50	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
55	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
60	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
65	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CN

## ES 2 278 738 T3

	CH	CH	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
5	CH	CH	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Br
10	CH	CH	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	I
15	CH	CH	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	F
20	CH	CH	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	F
25	CH	CH	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Me
30	CH	CH	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
35	CH	CH	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
40	CH	CH	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CN
45	CH	CH	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
50	CH	CH	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
55	CH	CH	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	I
60	CH	CH	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	F
65	CH	CH	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	F

## ES 2 278 738 T3

	CH	CH	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	F
5	CH	CH	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
10	CH	CH	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
15	CH	CH	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
20	CH	CH	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
25	CH	CH	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	N	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	N	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
30	CH	CH	N	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	N	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Br
35	CH	CH	N	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	N	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	N	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	I
40	CH	CH	N	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	N	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	N	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	F
45	CH	CH	N	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	N	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	F
50	CH	CH	N	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	N	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	N	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Me
55	CH	CH	N	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	N	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	N	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
60	CH	CH	N	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	N	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	N	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
65	CH	CH	N	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CN

## ES 2 278 738 T3

	CH	CH	N	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CN
5	CH	CH	N	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	N	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	N	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
10	CH	CH	N	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	N	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	N	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
15	CH	CH	N	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	N	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	N	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	I
20	CH	CH	N	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	N	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	F
25	CH	CH	N	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	N	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	N	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
30	CH	CH	N	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	N	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	N	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
35	CH	CH	N	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	N	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
40	CH	CH	N	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	N	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	N	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
45	CH	CH	N	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	N	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	N	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
50	CH	N	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	N	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
55	CH	N	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	N	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	N	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Br
60	CH	N	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	N	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	I
	CH	N	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	I
65	CH	N	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	I

## ES 2 278 738 T3

	CH	N	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	F
5	CH	N	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	F
	CH	N	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	F
	CH	N	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Me
10	CH	N	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	N	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	N	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
15	CH	N	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	N	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
20	CH	N	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	N	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	N	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
25	CH	N	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	N	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	N	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CN
30	CH	N	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	N	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	N	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
35	CH	N	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	N	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
40	CH	N	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	N	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	I
	CH	N	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	I
45	CH	N	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	I
	CH	N	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	F
	CH	N	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	F
50	CH	N	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	F
	CH	N	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
55	CH	N	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	N	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	N	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
60	CH	N	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	N	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	N	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
65	CH	N	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe

## ES 2 278 738 T3

	CH	N	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
5	CH	N	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	N	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	N	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
10	N	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	N	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	N	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
15	N	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Br
	N	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Br
	N	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Br
20	N	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	I
	N	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	I
25	N	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	I
	N	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	F
	N	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	F
30	N	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	F
	N	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Me
35	N	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Me
	N	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Me
	N	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
40	N	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	N	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	N	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
45	N	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
	N	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
50	N	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CN
	N	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CN
	N	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CN
55	N	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	N	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	N	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
60	N	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
	N	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
	N	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
65	N	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	I

## ES 2 278 738 T3

	N	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	I
5	N	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	I
	N	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	F
	N	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	F
10	N	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	F
	N	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	N	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
15	N	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	N	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	N	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
20	N	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	N	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
25	N	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
	N	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
	N	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
30	N	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
	N	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
35	CH	N	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	N	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	N	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
40	CH	N	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	N	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	N	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Br
45	CH	N	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	I
	CH	N	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	I
	CH	N	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	I
50	CH	N	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	F
	CH	N	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	F
55	CH	N	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	F
	CH	N	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	N	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Me
60	CH	N	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	N	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	N	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
65	CH	N	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>



## ES 2 278 738 T3

	CH	N	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
5	CH	N	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	N	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	N	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CN
10	CH	N	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	N	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	N	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
15	CH	N	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	N	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
20	CH	N	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	N	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	N	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
25	CH	N	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	I
	CH	N	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	I
	CH	N	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	I
30	CH	N	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	F
	CH	N	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	F
	CH	N	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	F
35	CH	N	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	N	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
40	CH	N	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	N	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	N	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
45	CH	N	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	N	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
50	CH	N	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	N	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	N	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
55	CH	N	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	N	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
60	CH	CH	CH	CCl	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
65	CH	CH	CH	CCl	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Br

## ES 2 278 738 T3

	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Br
5	CH	CH	CH	CCl	Et	Me	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	I
10	CH	CH	CH	CCl	Et	Me	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	F
15	CH	CH	CH	CCl	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Me
20	CH	CH	CH	CCl	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
25	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	CCl	Et	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
30	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	CH	CCl	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CN
35	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	CH	CCl	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
40	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	CCl	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
45	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
50	CH	CH	CH	CCl	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	I
55	CH	CH	CH	CCl	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	F
60	CH	CH	CH	CCl	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
65	CH	CH	CH	CCl	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>

## ES 2 278 738 T3

	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
5	CH	CH	CH	CCl	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
10	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	CH	CCl	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
15	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	CH	CF	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
20	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	CF	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Br
25	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	CH	CF	Et	Me	CF <sub>3</sub>	I
30	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	CH	CF	Et	Me	CF <sub>3</sub>	F
35	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	F
40	CH	CH	CH	CF	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Me
45	CH	CH	CH	CF	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
50	CH	CH	CH	CF	Et	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
55	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	CH	CF	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CN
60	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	CH	CF	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
65	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl

## ES 2 278 738 T3

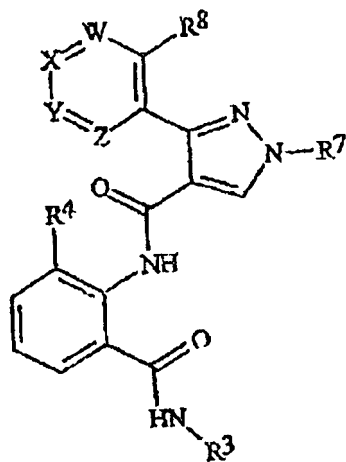
	CH	CH	CH	CF	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
5	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	CH	CF	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	I
10	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	F
15	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	CF	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
20	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	CH	CF	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
25	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	CF	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
30	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	CH	CF	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
35	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
40	CH	CH	CH	CH	Et	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Cl
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Cl
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Cl
45	CH	CH	CH	CH	Et	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Br
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Br
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Br
50	CH	CH	CH	CH	Et	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	I
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	I
55	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	I
	CH	CH	CH	CH	Et	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	F
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	F
60	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	F
	CH	CH	CH	CH	Et	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Me
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Me
65	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Me

## ES 2 278 738 T3

	CH	CH	CH	CH	Et	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CF <sub>3</sub>
5	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	CH	Et	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	OMe
10	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	OMe
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	OMe
	CH	CH	CH	CH	Et	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CN
15	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CN
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CN
	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Cl
20	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Cl
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Cl
	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Br
25	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Br
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Br
	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	I
30	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	I
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	I
	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	F
35	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	F
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	F
	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Me
40	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Me
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Me
	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CF <sub>3</sub>
45	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	OMe
50	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	OMe
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	OMe
	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CN
55	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CN
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CN
	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CN
60	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CN
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CN

65

TABLA 17



W	X	Y	Z	R <sup>3</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>7</sup>	R <sup>8</sup>
CH	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
CH	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Br
CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Br
CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Br
CH	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	I
CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	I
CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	I
CH	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	F
CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	F
CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	F
CH	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Me
CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Me
CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Me
CH	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
CH	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
CH	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CN
CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CN
CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CN
CH	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl

## ES 2 278 738 T3

	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
5	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
10	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	I
15	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	F
20	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
25	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
30	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
35	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
40	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
45	CH	CH	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
50	CH	CH	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Br
55	CH	CH	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	I
60	CH	CH	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	F
65	CH	CH	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	F

## ES 2 278 738 T3

	CH	CH	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Me
5	CH	CH	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
10	CH	CH	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
15	CH	CH	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CN
20	CH	CH	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CN
25	CH	CH	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
30	CH	CH	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
35	CH	CH	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	I
40	CH	CH	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	F
45	CH	CH	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
50	CH	CH	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
55	CH	CH	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
60	CH	CH	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
65	CH	CH	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CN



## ES 2 278 738 T3

	CH	CH	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
5	CH	CH	N	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	N	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	N	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
10	CH	CH	N	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	N	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	N	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Br
15	CH	CH	N	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	N	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	N	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	I
20	CH	CH	N	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	N	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	N	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	F
25	CH	CH	N	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	N	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	N	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Me
30	CH	CH	N	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	N	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	N	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
35	CH	CH	N	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	N	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	N	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
40	CH	CH	N	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	N	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	N	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CN
45	CH	CH	N	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	N	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	N	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
50	CH	CH	N	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	N	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	N	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
55	CH	CH	N	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	N	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	N	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	I
60	CH	CH	N	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	N	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	F
65	CH	CH	N	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	F

## ES 2 278 738 T3

	CH	CH	N	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	F
5	CH	CH	N	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	N	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	N	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
10	CH	CH	N	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	N	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	N	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
15	CH	CH	N	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	N	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
20	CH	CH	N	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	N	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	N	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
25	CH	CH	N	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	N	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
30	CH	N	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	N	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	N	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
35	CH	N	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	N	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	N	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Br
40	CH	N	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	I
	CH	N	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	I
	CH	N	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	I
45	CH	N	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	F
	CH	N	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	F
	CH	N	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	F
50	CH	N	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	N	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Me
55	CH	N	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	N	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	N	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
60	CH	N	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	N	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	N	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
65	CH	N	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	OMe

## ES 2 278 738 T3

	CH	N	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CN
5	CH	N	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	N	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	N	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
10	CH	N	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	N	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	N	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
15	CH	N	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	N	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	N	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	I
20	CH	N	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	I
	CH	N	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	I
	CH	N	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	F
25	CH	N	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	F
	CH	N	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	F
30	CH	N	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	N	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	N	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
35	CH	N	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	N	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
40	CH	N	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	N	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	N	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
45	CH	N	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	N	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
50	CH	N	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	N	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
	N	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
55	N	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	N	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	N	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Br
60	N	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Br
	N	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Br
	N	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	I
65	N	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	I

## ES 2 278 738 T3

	N	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	I
5	N	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	F
	N	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	F
	N	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	F
10	N	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Me
	N	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Me
	N	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Me
15	N	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	N	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
20	N	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	N	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
	N	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
25	N	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
	N	CH	CH	CH	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CN
	N	CH	CH	CH	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CN
30	N	CH	CH	CH	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CN
	N	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	N	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
35	N	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	N	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
40	N	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
	N	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
	N	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	I
45	N	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	I
	N	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	I
50	N	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	F
	N	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	F
	N	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	F
55	N	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	N	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	N	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
60	N	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	N	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	N	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
65	N	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe

## ES 2 278 738 T3

	N	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
5	N	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
	N	CH	CH	CH	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
	N	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
10	N	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	N	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	N	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
15	CH	N	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	N	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	N	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Br
20	CH	N	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	N	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	I
25	CH	N	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	I
	CH	N	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	I
	CH	N	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	F
30	CH	N	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	F
	CH	N	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	F
	CH	N	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Me
35	CH	N	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	N	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Me
40	CH	N	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	N	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	N	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
45	CH	N	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	N	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	N	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
50	CH	N	CH	N	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	N	CH	N	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CN
55	CH	N	CH	N	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	N	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	N	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
60	CH	N	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	N	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	N	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
65	CH	N	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Br

## ES 2 278 738 T3

	CH	N	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	I
5	CH	N	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	I
	CH	N	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	I
	CH	N	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	F
10	CH	N	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	F
	CH	N	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	F
	CH	N	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
15	CH	N	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	N	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	N	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
20	CH	N	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	N	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
25	CH	N	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	N	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	N	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
30	CH	N	CH	N	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	N	CH	N	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
35	CH	N	CH	N	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	CH	CCl	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
40	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	CCl	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Br
45	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	CH	CCl	Et	Me	CF <sub>3</sub>	I
50	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	CH	CCl	Et	Me	CF <sub>3</sub>	F
55	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	CCl	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Me
60	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Me
65	CH	CH	CH	CCl	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>

## ES 2 278 738 T3

	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
5	CH	CH	CH	CCl	Et	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
10	CH	CH	CH	CCl	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CN
15	CH	CH	CH	CCl	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
20	CH	CH	CH	CCl	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
25	CH	CH	CH	CCl	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	I
30	CH	CH	CH	CCl	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	F
35	CH	CH	CH	CCl	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
40	CH	CH	CH	CCl	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
45	CH	CH	CH	CCl	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
50	CH	CH	CH	CCl	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	CH	CCl	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	CH	CCl	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
55	CH	CH	CH	CF	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Cl
60	CH	CH	CH	CF	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Br
65	CH	CH	CH	CF	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Br

## ES 2 278 738 T3

	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Br
5	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	CH	CF	Et	Me	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	I
10	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	CH	CF	Et	Me	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	F
15	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	CF	Et	Me	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	Me
20	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	CH	CF	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
25	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	CF	Et	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
30	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	CH	CF	Et	Me	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Me	CF <sub>3</sub>	CN
35	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Me	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	CH	CF	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
40	CH	CH	CH	CF	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Cl
	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
45	CH	CH	CH	CF	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Br
	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	I
50	CH	CH	CH	CF	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	I
55	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	I
	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	F
	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	F
60	CH	CH	CH	CF	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	Me
65	CH	CH	CH	CF	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>



## ES 2 278 738 T3

	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
5	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	CF	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
10	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	OMe
	CH	CH	CH	CF	Et	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	CH	CF	i-Pr	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
15	CH	CH	CH	CF	t-Bu	Cl	CF <sub>3</sub>	CN
	CH	CH	CH	CH	Et	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Cl
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Cl
20	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Cl
	CH	CH	CH	CH	Et	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Br
25	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Br
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Br
	CH	CH	CH	CH	Et	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	I
30	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	I
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	I
	CH	CH	CH	CH	Et	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	F
35	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	F
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	F
40	CH	CH	CH	CH	Et	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Me
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Me
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Me
45	CH	CH	CH	CH	Et	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CF <sub>3</sub>
50	CH	CH	CH	CH	Et	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	OMe
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	OMe
55	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	OMe
	CH	CH	CH	CH	Et	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CN
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CN
60	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Me	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CN
	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Cl
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Cl
65	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Cl

	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Br
5	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Br
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Br
	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	I
10	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	I
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	I
	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	F
15	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	F
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	F
	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Me
20	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Me
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	Me
25	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CF <sub>3</sub>
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CF <sub>3</sub>
30	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	OMe
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	OMe
	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	OMe
35	CH	CH	CH	CH	Et	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CN
	CH	CH	CH	CH	i-Pr	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CN
40	CH	CH	CH	CH	t-Bu	Cl	C <sub>2</sub> F <sub>5</sub>	CN

#### Formulación/Utilidad

45 Los compuestos de esta invención se utilizarán generalmente como formulaciones o composiciones con un vehículo apropiado para su uso en agricultura que comprenda al menos un diluyente líquido, un diluyente sólido o un surfactante. Los ingredientes de la composición o formulación se seleccionan de forma que sea consistentes con las propiedades físicas del ingrediente activo, del modo de aplicación y de factores ambientales tales como tipo de suelo, humedad y temperatura. Algunas formulaciones útiles incluyen líquidos como soluciones (incluyendo concentrados emulsificables), suspensiones, emulsiones (incluyendo microemulsiones y/o suspensiones) y similares que pueden espesarse de forma opcional para obtener geles. Algunas formulaciones útiles incluyen sólidos como polvos, pulverizados, gránulos, perlas, tablas, películas y similares, que pueden ser dispersables en agua ("mojables") o solubles en agua. Los ingredientes activos pueden estar (micro)encapsulados y, adicionalmente, formulados en una suspensión o formulación sólida; de forma alternativa toda la formulación del ingrediente activo puede estar encapsulada (o "recubierta"). La encapsulación puede controlar o retrasar la liberación del ingrediente activo. Las formulaciones pulverizables pueden extenderse en un medio apropiado y utilizarse en volúmenes de pulverización de desde alrededor de uno hasta varios centenares de litros por hectárea. Las composiciones más potentes se utilizan principalmente como intermedios para formulaciones adicionales.

60 Las formulaciones contendrán típicamente cantidades efectivas del ingrediente activo, diluyente y surfactante dentro de los siguientes rangos aproximados que suman un 100 por cien en peso.

65

## ES 2 278 738 T3

### Porcentaje en peso

	Ingrediente Activo	Diluyente	Surfactante
5	<b>Gránulos, Tabletas</b>		
	<b>y Pulverizados despersables</b>		
10	<b>en agua y solubles en</b>		
	<b>agua</b>	<b>5-90</b>	<b>0-94</b>
			<b>1-15</b>
15	<b>Suspensiones, Emulsiones,</b>		
	<b>Soluciones (incluyendo</b>		
20	<b>Concentrados Emulsificables)</b>	<b>5-50</b>	<b>40-95</b>
			<b>0-15</b>
	<b>Polvos</b>	<b>1-25</b>	<b>70-99</b>
			<b>0-15</b>
25	<b>Composiciones de alta potencia 90-99</b>	<b>0-10</b>	<b>0-2</b>

30 Algunos diluyentes sólidos típicos se describen en Watkins y otros, Handbook of Insecticide Dust Diluents and Carriers, 2nd Ed., Dorland Books, Caldwell, New Jersey. Algunos diluyentes líquidos típicos se describen en Mardsen, Solvents Guide, 2nd Ed., Interscience, New York, 1950. McCutcheon's Detergents and Emulsifiers Annual, Allured Publ. Corp., Ridgewood, New Jersey, así como en Sisely and Wood, Encyclopedia of Surface Active Agents, Chemical Publ. Co., Inc., New York, 1964, presenta surfactantes y sus usos recomendados. Todas las formulaciones pueden contener pequeñas cantidades de aditivos para reducir la formación de espuma, emplazamiento, corrosión, crecimiento microbiano y similares, o espesantes para aumentar la viscosidad.

40 Los surfactantes incluyen, por ejemplo, alcoholes polietoxilados, alquilfenoles polietoxilados, ésteres de ácidos grasos sorbitan polietoxilados, sulfosuccinatos de dialquilo, sulfatos de alquilo, sulfonatos de alquilbenceno, organosiliconas, N,N-dialquiltauratos, lignin sulfonatos, condensados de sulfonato de naftaleno formaldehído, policarboxilatos y copolímeros de bloque de polioxietileno/polioxipropileno. Los diluyentes sólidos incluyen, por ejemplo, arcillas como bentonita, montmorilonita, atapulgita y caolina, almidón, azúcar, sílice, talco, tierras diatomáceas, urea, carbonato de calcio, carbonato y bicarbonato de sodio, y sulfato de sodio. Los diluyentes líquidos incluyen, por ejemplo, agua, N,N-dimetilformamida, dimetilsulfóxido, N-alquilpirrolidona, etilenglicol, polipropilenglicol, parafinas, alquilbencenos, alquilnaftalenos, aceites de oliva, de ricino, de linaza, de tung, de sésamo, de maíz, de cacahuete, de de semillas de algodón, de soja, de colza y de coco, ésteres de ácidos grasos, cetonas como ciclohexanona, 2-heptanona, isoforona y 4-hidroxi-4-metil-2-pentanona, y alcoholes como metanol, ciclohexanol, decanol y alcohol tetrahidrofurfurílico.

50 Las soluciones, incluyendo los concentrados emulsificables, se pueden preparar simplemente mezclando los ingredientes. Los polvos y pulverizados se pueden preparar mediante la mezcla y, normalmente, el molido en un molino de martillo o en un molino de chorro. Las suspensiones normalmente se preparan por molido húmedo; ver, por ejemplo la U.S. 3,060,084. Los gránulos y las perlas se pueden preparar pulverizando el material activo sobre vehículos granulares preformados o bien mediante técnicas de aglomeración. Ver Browning, "Agglomeration", Chemical Engineering, December 4, 1967, pp 147-48, Perry's Chemical Enginner's Handbook, 4th Ed., McGraw-Hill, New York, 1963, paginas 8-57 y siguientes, y WO 91/13546. La perlas se pueden preparar tal como se describe en U.S. 4,172,714.

55 Los gránulos despersables en agua y solubles en agua se pueden preparar tal como se enseña en U.S. 4,144,050, U.S. 3,920,442 y DE 3,246,493. Las tabletas se pueden preparar tal como se enseña en U.S. 5,180,587, U.S. 5,232,701 y U.S. 5,208,030. Las películas se pueden preparar tal como se muestra en GB 2,095,558 y U.S. 3,299,566.

60 Para obtener información adicional sobre la técnica de la formulación, ver U.S. 3,235,361, Col. 6, línea 16 hasta Col./línea 19 y los Ejemplos 10-41; U.S. 3,309,192, Col. 5, línea 43 hasta Col. 7, línea 62 y Ejemplos 8, 12, 15, 39, 41, 52, 53, 58, 132, 138-140, 162-164, 166, 167 y 169-182; U.S. 2,891,855, Col. 3 línea 66 hasta Col. 5, línea 17 y Ejemplos 1-4; Klingman, Weed Control como a Science, John Wiley and Sons, Inc., New York, 1961, pp 81-96; y Hance *et al.*, Weed Control Handbook, 8th Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford 1989.

65 En los siguientes Ejemplos, todos los porcentajes están en peso y todas las formulaciones se preparan de modo convencional. Los números de los compuestos se refieren a los compuestos en las Tablas Índice A.

## ES 2 278 738 T3

### Ejemplo A

#### *Polvo Mojable*

5	Compuesto 1	65.0%
	dedecilfenol polietilen glicol éter	2.0%
	ligninsulfonato de sodio	4.0%
	silicoaluminato de sodio	6.0%
10	montmorilonita (calcinada)	23.0%

### Ejemplo B

#### *Gránulos*

15	Compuesto 1	10.0%
	gránulos de atapulgita (materia baja en volátiles, 0.71/0.30 mm; tamices U.S.S. No. 25-50)	90.0%

### Ejemplo C

#### *Perlas Extruidas*

25	Compuesto 1	25.0%
	sulfato de sodio anhidro	10.0%
	ligninsulfonato de calcio en bruto	5.0%
	alquilnaftalensulfato de sodio	1.0%
30	bentonita de calcio/magnesio	59.0%

### Ejemplo D

#### *Concentrado Emulsificable*

35	Compuesto 1	22.0%
	mezcla de sulfonatos y éteres de polioxietileno solubles en aceite	10.0%
	isoforona	70.0%

40 Los compuestos de esta invención muestran actividad frente a un amplio espectro de artrópodos que se alimentan de hojas, frutas, tallos o raíces, acuáticos y terrestres (el término “artrópodos” incluye insectos, ácaros y nemátodos) que son plagas de cultivos agrícolas en crecimiento y almacenados, cultivos forestales, cultivos de invernadero, ornamentales, de vivero, alimentos productos de fibra almacenados, ganado, animales domésticos y salud pública y animal. Aquellos con experiencia en el campo de la técnica apreciarán que no todos los compuestos son igualmente efectivos

45 contra todos los estados de crecimiento de todas las plagas. Sin embargo, todos los compuestos de esta invención presentan actividad frente a plagas que incluyen; huevos, larvas y adultos del Orden Lepidópteros; huevos, larvas que se alimentan de hojas, de frutas, de raíces y de semillas y adultos del Orden de los Coleópteros; huevos, inmaduros y adultos de los Órdenes Hemípteros y Homópteros; huevos, larvas, ninfas y adultos del Orden de los Acáridos; huevos, inmaduros y adultos de los Órdenes Tisanópteros, Ortópteros y Dermápteros; huevos, inmaduros y adultos del Orden de los Dípteros; y huevos, jóvenes y adultos del Filum de los Nemátodos. Los compuestos de esta invención también son activos frente a plagas de los Órdenes de los Himenópteros, Isópteros, Sifonápteros, Blatarios, Tisanuros y Psocópteros; plagas pertenecientes a la Clase de los Arácnidos y al Filum de los Platelminios. De forma específica, los compuestos son activos frente al gusano de la raíz del maíz (*Diabrotica undecimpunctata howardi*), saltahojas del áster (*Macrosteles fascifrons*), picudo del algodón (*Anthonomus grandis*), arañuela roja común (*Tetranychus urticae*), oruga militar tardía (*Spodoptera frugiperda*), pulgón del haba (*Aphis fabae*), pulgón verde del melocotonero (*Myzus persica*), pulgón del algodón (*Aphis gossypii*), pulgón ruso del trigo (*Diuraphis noxia*), pulgón de la espiga (*Sitobion avenae*), pulgón blanco (*Bemisia tabaci*), gusano de la yema del tabaco (*Heliothis virescens*), gorgojo acuático del arroz (*Lissorhoptrus oryzophilus*), escarabajo del arroz (*Oulema oryzae*), saltamontes de lomo blanco (*Sogatella furcifera*), saltamontes verde (*Nephotettix cincticeps*), saltamontes marrón (*Nilaparvata lugens*), saltamontes marrón pequeño (*Laodelphax striatellus*), taladrador asiático del arroz (*Chilo suppressalis*), gusano doblador de hojas (*Cnaphalocrocis medinalis*), chinche hedionda del arroz negra (*Scotinophara lurida*), chinche hedionda del arroz (*Oebalus pugnax*), chinche del arroz (*Leptocorisa chinensis*), chinche del arroz esbelto (*Cletus puntiger*), chinche hedionda verde (*Nezara viridula*) y cucaracha alemana (*Blattella germanica*). Los compuestos son activos frente a los ácaros, demostrando actividad ovicida, larvicida y quimioesterilizante frente a familias tales como Tetraniquídeos, incluyendo

65 *Tetranychus urticae*, *Tetranychus cinnabarinus*, *Tetranychus mcdanieli*, *Tetranychus pacificus*, *Tetranychus trukestani*, *Byrobia rubrioculus*, *Panonychus ulmi*, *Panonychus citri*, *Eotetranychus carpini borealis*, *Eotetranychus hicoriae*, *Eotetranychus sexmaculatus*, *Eotetranychus yumensis*, *Eotetranychus banksi* y *Oligonychus pratensis*; Tenuipalpídeos

## ES 2 278 738 T3

incluyendo *Brevipalpus lewisi*, *Brevipalpus phoenicis*, *Brevipalpus californicus* y *Brevipalpus obovatus*; Eriofídeos incluyendo *Phyllocoptruta oleivora*, *Eriophyes sheldoni*, *Aculus cornutus*, *Epitrimerus pyri* y *Eriophyes mangiferae*. Ver WO 90/10623 y WO 92/00673 para descripciones más detalladas de las plagas.

5 Los compuestos de esta invención también pueden mezclarse con uno o más insecticidas, fungicidas, nematocidas, bactericidas, acaricidas, reguladores del crecimiento, quimioesterilizantes, semioquímicos, repelentes, atrayentes, feromonas, estimulantes del apetito u otros compuestos biológicamente activos para fabricar un pesticida multi-componente que de un espectro incluso mayor de protección agrícola. Algunos ejemplos de tales protectores agrícolas con los cuales se puede formular los compuestos de esta invención son: insecticidas como abamectina, acefato, avermectina, azinfos-metilo, bifentrina, buprofezina, carborurano, clorfenapir, clorpirifos, clorpirifos-metilo, clotianidina, ciflutrina, beta-ciflutrina, cihalotrina, lambda-cihalotrina, cipermetrina, deltametrina, diafenitiuron, diazinon, diflubenzuron, demetoato, diofenolan, emamectina, endosulfan, esfenvalerato, fenotcarb, fenoxicarb, fenpropatrin, fenvalerato, fipronil, flucitrinato, tau-fluvalinato, flufenoxuron, fonofos, imidacloprid, isofenfos, malation, metaldehído, metamidofos, metidation, metomil, metopreno, metoxiclor, 7-cloro-2,5-dihidro-2-[[N-(metoxicarbonil)-N-[4-(trifluorometoxi)fenil]amino]carbonil]indeno[1,2-e][1,3,4]oxadiazin-4<sup>a</sup>(3H)-carboxilato de metilo (indoxacarb), monocrotofos, oxamil, paration, paration-metil, permetrin, forato, fosalona, fosmet, fosfamidon, pirimicarb, profenofos, pimetozina, piriproxifen, rotenona, spionsad, sulprofos, tebufenozida, teflutrin, terbufos, tetraclorinfos, tiacloprid, tiodicarb, tralometrin, tricloroform y triflumuron; fungicidas como acibenzolar, azocistrobin, benomil, blastididín-S, mezcla de Burdeos (sulfato de cobre tribásico), bromuconazol, carpropamid (KTU 3616), captafol, captan, carbendazim, cloroneb, clorotalonil, oxiclورو de cobre, sales de cobre, cimoxanil, ciproconazol, ciprodinil (CGA 219417), (s)-3,5-dicloro-N-(3-cloro-1-etil-1-metil-2-oxopropil)4-metilbenzamida (RH 7281), diclocimet (S-2900), diclomezina, dicloran, difenoconazol, (S)-3,5-dihidro-5-metil-2-(metiltio)5-fenil-3-(fenilamino)-4H-imidazol-4-ona (RP 407213), dimetomorf, diniconazol, diniconazol-M, dodina, edifenfos, epoxiconazol (BAS 480F), famoxadona, fenamidona, fenarimol, fenbuconazol, fencaramid (SZX0722) fenpiclonil, fenpropidín, fenpropimorf, fentin acetato, fentin hidróxido, fluazinam, fludioxonil, flumetover (RPA 403397), fluquinconazol, flusilazol, flutolanil, flutriafol, folpet, fosetil-aluminio, furalaxil, furametapir (S-82658), hexaconazol, ipconazol, iprobenfos, iprodiona, isofprotiolano, kasugamicina, kresoxim-metil, mancozeb, maneb, mefenoxam, mepronil, metalaxil, metconazol, metominostrobin/fenominostrobin (SSF-126), miclobutanil, neo-asozin (metanoarsonato férrico), oxadixil, penconazol, pencicuron, probenazol, procloraz, propamocarb, propiconazol, pirifenox, peraclostrobin, pirimetanil, piroquilon, quinoxifen, spiroxamina, azufre, tebuconazol, tetraconazol, tiabendazol, tifulzamida, tiofanato-metil, tiram, triadimefon, triadimenol, triciclazol, trifloxistrobin, triticonazol, validamicin y vinclozolin; nematocidas como aldicarb, oxamil y fenamifos; bactericidas como estreptomycin; acaricidas como amitraz, quinometionato, clorobencilato, cihexatina, dicofol, dienoclor, etoxazol, fenazaquina, fenbutatin óxido, fenpropatrin, fenpiroximato, hexitiazox, propargita, piridaben y tebufenpirad; y agentes biológicos como *Bacillus thuringiensis*, *Bacillus thuringiensis* delta endotoxin, baculovirus, y bacterias, virus y hongos entomopatogénicos.

Los insecticidas y acaricidas preferidos para mezclar con los compuestos de esta invención incluyen piretroides como cipermetrina, cihalotrina, ciflutrina y beta-ciflutrina, esfenvalerato, fenvalerato y tralometrina; carbamatos como fenotcarb, metomil, oxamil y tiodicarb; meonicotinoides como clotianidina, imidacloprid y tiacloprid, bloqueadores de canales de sodio neuronales como indoxacarb, lactonas macrocíclicas insecticidas como spinosad, abamectina, avermectina y emamectina; antagonistas de GABA como endosulfan y fipronil; ureas insecticidas como flufenoxuron y triflumuron, mimetizantes de las hormonas juveniles como diofenolan y piriproxifen; pimetozina; y amitraz.

Los agentes biológicos preferidos para su mezcla con los compuestos de esta invención incluyen *Bacillus thuringiensis* y la endotoxina delta de *Bacillus thuringiensis*.

Las mezclas más preferidas incluyen una mezcla de un compuesto de esta invención con cihalotrina; una mezcla de un compuesto de esta invención con beta-ciflutrina; una mezcla de un compuesto de esta invención con esfenvalerato; una mezcla de un compuesto de esta invención con metomil; una mezcla de un compuesto de esta invención con imidacloprid; una mezcla de un compuesto de esta invención con tiacloprid; una mezcla de un compuesto de esta invención con indoxacarb; una mezcla de un compuesto de esta invención con abamectina; una mezcla de un compuesto de esta invención con endosulfan; una mezcla de un compuesto de esta invención con fipronil; una mezcla de un compuesto de esta invención con flufenoxuron; una mezcla de un compuesto de esta invención con piriproxifen; una mezcla de un compuesto de esta invención con pimetozina; una mezcla de un compuesto de esta invención con amitraz; una mezcla de un compuesto de esta invención con *Bacillus thuringiensis* y una mezcla de un compuesto de esta invención con la endotoxina delta de *Bacillus thuringiensis*.

En algunos casos, las combinaciones con otros artropodocidas que tengan un espectro de control similar pero un modo de acción distinto será particularmente ventajoso para el control de la resistencia.

El control de las plagas de artrópodos y la protección de los cultivos agrícolas, hortícolas y especializados, así como de la salud humana y animal, se consigue aplicando uno o más de los compuestos de esta invención, en una cantidad efectiva, al entorno de la plaga incluyendo el lugar de infección agrícola o no agrícola, el área a proteger, o directamente sobre las plagas a controlar. Así pues, la presente invención comprende además un método para el control de plagas de artrópodos que habitan en las hojas y en el suelo, y de nemátodos y la protección de cultivos agrícolas y/o no agrícolas, comprendiendo la aplicación de uno o más de los compuestos de la invención, o de composiciones que contengan al menos uno de tales compuestos, en una cantidad efectiva, al entorno de las plagas incluyendo el lugar de infección agrícola y/o no agrícola, el área a proteger o directamente la plaga a controlar. Uno de los métodos

## ES 2 278 738 T3

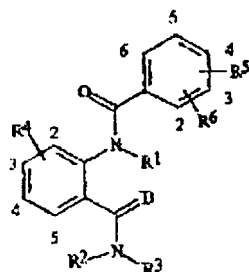
preferidos de aplicación es la pulverización. De forma alternativa se puede aplicar formulaciones granulares de estos compuestos al follaje de la planta o a la tierra. Otros métodos de aplicación incluyen la pulverización directa y residual, pulverización aérea, recubrimientos de semillas, microencapsulaciones, absorción sistémica, cebos, etiquetas en las orejas, bolos, nebulizadores, fumigantes, aerosoles, polvos y muchos otros. Los compuestos pueden incorporarse en cebos que son consumidos por los artrópodos, o en aparatos tales como trampas y similares.

Los compuestos de esta invención pueden aplicarse en su estado puro, pero de forma más frecuente la aplicación consistirá en una formulación que contiene uno o más compuestos con vehículos, diluyentes y surfactantes apropiados, y posiblemente en combinación con un alimento dependiendo del uso final que se contemple. Uno de los métodos preferidos de aplicación comprende la pulverización de una dispersión acuosa o solución en aceite refinado de los compuestos. Las combinaciones con aceites para la pulverización, concentrados de aceite para la pulverización, adhesivos difusores, adyuvantes, otros disolventes y compuestos sinérgicos como butóxido de piperonilo a menudo mejora la eficacia del compuesto.

La tasa de aplicación requerida para un control eficaz dependerá de factores tales como las especies de artrópodos a controlar, el ciclo de vida de la plaga, el estadio vital, su tamaño, localización, época del año, cultivo o animal huésped, comportamiento frente a la alimentación, comportamiento frente al apareamiento, humedad ambiental, temperatura y similares. Bajo condiciones normales, tasas de aplicación de alrededor de 0.01 hasta 2 kg de ingrediente activo por hectárea son suficientes para controlar plagas en ecosistemas agrícolas, pero cantidades tan pequeñas como 0.001 kg/hectárea pueden ser suficientes, o pueden necesitarse hasta 8 kg/hectárea. Para aplicaciones no agrícolas, las tasas de utilización efectivas estarán entre alrededor de 1.0 hasta 50 mg/metro cuadrado, pero cantidades tan pequeñas como 0.1 mg/metro cuadrado pueden ser suficientes, o bien pueden necesitarse tanto como 150 mg/metro cuadrado.

La siguiente prueba demuestra la eficacia de los compuestos de esta invención en el control de plagas concretas. "Eficacia en el control" representa la inhibición del desarrollo de los artrópodos (incluyendo mortalidad) que provoca un daño por alimentación significativamente reducido. Sin embargo, la protección debida al control de las plagas proporcionada por los compuestos no está limitada a estas especies. Ver las Tablas Índice A hasta Q para descripciones de los compuestos. En las siguientes Tablas Índice se utilizan las siguientes abreviaturas: t es terciario, n es normal, i es iso, c es ciclo, s es secundario, Me es metilo, Et es etilo, Pr es propilo, i-Pr es isopropilo, c-Pr es ciclopropilo, Bu es butilo, s-Bu es butilo secundario, Pent es pentilo, OMe es metoxi, OEt es etoxi, SMe es metiltio, SEt es etiltio, CN es ciano, NO<sub>2</sub> es nitro y Het es heterociclo. La abreviatura "Ej." quiere decir "Ejemplo" y se sigue de un número que indica en que ejemplo se prepara el compuesto.

TABLA ÍNDICE A



B es O, excepto donde así se indica

Compuesto	R <sup>1</sup>	R <sup>3</sup>	R <sup>2</sup>	R <sup>4</sup>	R <sup>5</sup> y/o R <sup>6</sup>	p.f. °C
1 (Ej. 1)	H	i-Pr	H	2-Me	4-OCF <sub>3</sub>	207-209
2	H	i-Pr	H	5-Cl	2-CF <sub>3</sub>	195-196
3	H	i-Pr	H	5-Cl	2-Me-4-CF <sub>3</sub>	182-184
4	H	i-Pr	H	2-Me	4-CF <sub>3</sub>	238-240
5	H	i-Pr	H	2-Me	4-CO <sub>2</sub> Me	216-217

## ES 2 278 738 T3

6	H	i-Pr	H	2-Me	3-NO <sub>2</sub>	230-233
7	H	i-Pr	H	2-Me	3-CF <sub>3</sub> -4-F	223-225
8	H	i-Pr	H	2-Me	3-CN	237-239
9	H	i-Pr	H	2-Me	2-OCF <sub>3</sub>	191-193
10	H	i-Pr	H	2-Me	4-OCF <sub>3</sub>	163-167
11	H	i-Pr	H	2-Me	4-CO <sub>2</sub> Me	164-169
12	H	i-Pr	H	2-Cl	4-CO <sub>2</sub> Me	224-225
13	H	i-Pr	H	2-Me	2-OCF <sub>3</sub>	203-204
14	H	i-Pr	H	2-Me	3-NO <sub>2</sub>	193-195
15	H	i-Pr	H	2-Me	3-CF <sub>3</sub> -4-F	198-199
16	H	i-Pr	H	2-OMe	4-OCF <sub>3</sub>	178-181
17	H	i-Pr	H	2-Me	2-OCF <sub>3</sub>	170-172
18	H	i-Pr	H	2-OMe	3-CF <sub>3</sub> -4-F	209-211
19	H	i-Pr	H	2-Cl	4-OCF <sub>3</sub>	215-216
20	H	i-Pr	Me	2-Me	2-OCF <sub>3</sub>	153-155
21	H	i-Pr	H	5-Me	4-OCF <sub>3</sub>	173-175
22	H	i-Pr	H	5-Me	2-OCF <sub>3</sub>	180-185
23	H	i-Pr	H	5-Me	4-CO <sub>2</sub> Me	182-184
24	H	i-Pr	Me	2-Me	4-OCF <sub>3</sub>	vidrio
25	H	i-Pr	Me	2-Me	4-CO <sub>2</sub> Me	67-73
26	H	(1,2-di-Me)-Pr	H	2-Me	4-OCF <sub>3</sub>	189-191
27	H	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> OC H <sub>3</sub>	H	2-Me	4-OCF <sub>3</sub>	147-148
28	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	H	2-Me	4-OCF <sub>3</sub>	153-155
29	H	2-Pent	H	2-Me	4-OCF <sub>3</sub>	165-168
30	H	s-Bu	H	2-Me	4-OCF <sub>3</sub>	181-183
31	H	propargilo	H	2-Me	4-OCF <sub>3</sub>	190-192
32	H	n-Pr	H	2-Me	4-OCF <sub>3</sub>	189-191
33	H	alilo	H	2-Me	4-OCF <sub>3</sub>	185-187
34	H	Me <sub>2</sub> NCH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub>	H	2-Me	4-OCF <sub>3</sub>	168-170
35	H	propargilo	H	2-Me	4-OCF <sub>3</sub>	202-204
36	H	i-Bu	H	2-Me	4-OCF <sub>3</sub>	182-183
37	H	i-Pr	H	2,4-di-Me	4-OCF <sub>3</sub>	205-208
38	H	i-Pr	H	2,4-di-Me	4-CF <sub>3</sub>	> 230
39	H	i-Pr	H	2,4-di-Me	2-OCF <sub>3</sub>	231-232

## ES 2 278 738 T3

	40	H	i-Pr	H	2,4-di-Me	4-CO <sub>2</sub> Me	219-221
	41	H	i-Pr	H	2,4-di-Me	3-CF <sub>3</sub> -4-F	222-224
5	42	H	t-Bu	H	2-OMe	4-CF <sub>3</sub>	210-214
	43	H	t-Bu	H	2-OMe	4-OCF <sub>3</sub>	170-173
	44	H	i-Pr	Me	2-Me	3-NO <sub>2</sub>	aceite
10	45	H	i-Pr	H	2-Cl	4-OCF <sub>3</sub>	187-194
	46	H	t-Bu	H	2-Cl	4-OCF <sub>3</sub>	205-207
	47	H	alilo	H	2-Cl	4-OCF <sub>3</sub>	188-189
15	48	H	n-Bu	H	2-Cl	4-OCF <sub>3</sub>	192-193
	49	H	- CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -		2-Me	4-OCF <sub>3</sub>	138-142
20	50	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	2-Me	4-OCF <sub>3</sub>	> 230
	51	H	c-Bu	H	2-Me	4-OCF <sub>3</sub>	218-220
25	52 (Ej. 3)	H	i-Pr	H	2-Me	2-Me-4-CF <sub>3</sub>	247-248
	53	H	i-Pr	H	5-Me	2-Me-4-CF <sub>3</sub>	186-188
	54	H	i-Pr	H	H	4-OCF <sub>3</sub>	185-187
30	55	H	i-Pr	H	H	3-NO <sub>2</sub>	199-200
	56	H	i-Pr	H	H	2-OCF <sub>3</sub>	118-122
	57	Me	i-Pr	H	H	4-OCF <sub>3</sub>	117-118
35	58	Me	i-Pr	H	H	3-NO <sub>2</sub>	134-136
	59	Me	i-Pr	H	H	2-OCF <sub>3</sub>	128-130
	60	H	i-Pr	H	H	3-CF <sub>3</sub>	176-177
40	61	H	i-Pr	H	H	2-Me-4-CF <sub>3</sub>	100-106
	62	H	Me	H	2-Me	4-OCF <sub>3</sub>	204-206
	63	H	Et	H	2-Me	4-OCF <sub>3</sub>	198-200
45	64	H	NHi-Pr	H	2-Me	4-OCF <sub>3</sub>	126-128
	65	H	i-Pr	H	2-Me	3-CF <sub>3</sub>	198-200
50	66	H	i-Pr	H	2-Me	4-CN	>230
	67	H	i-Pr	H	2-Me	2-NO <sub>2</sub>	>230
	68	H	i-Pr	H	2-Me	3,5-di-CF <sub>3</sub>	>230
55	69	H	i-Pr	H	2-Me	4-NO <sub>2</sub>	227-230
	70	H	i-Pr	H	2-Me	2-CF <sub>3</sub>	227-230
	71	H	i-Pr	H	H	2-Me-4-OCF <sub>3</sub>	118-124
60	72	H	i-Pr	H	H	4-CF <sub>3</sub>	196-198
	73	H	i-Pr	H	2-Me	2-Me-4-SCF <sub>2</sub> H	212-213

65



## ES 2 278 738 T3

	74	H	t-Bu	H	2-Me	2-Me-4-SCF <sub>2</sub> H	193-195
5	75	H	i-Pr	H	2-Me	2-Me-4-OCF <sub>3</sub>	221-222
	76	H	t-Bu	H	2-Me	4-CF <sub>3</sub>	217-219
	77	H	t-Bu	H	2-Me	3-CF <sub>3</sub>	197-198
10	78	H	t-Bu	H	2-Me	3,5-di-CF <sub>3</sub>	206-207
	79	H	t-Bu	H	2-Me	4-CN	> 230
	80	H	t-Bu	H	2-Me	4-NO <sub>2</sub>	> 230
15	81	Me	i-Pr	H	2-Me	2-CF <sub>3</sub>	aceite
	82	Me	i-Pr	H	2-Me	4-OCF <sub>3</sub>	151-157
	83	Me	i-Pr	H	H	2-Me-4-OCF <sub>3</sub>	103-107
20	84	Me	t-Bu	H	2-Me	2-Me-4-CF <sub>3</sub>	233-234
	85	H	t-Bu	H	2-Me	2-Me-4-OCF <sub>3</sub>	207-209
	86	H	t-Bu	H	2-Me	2,5-di-CF <sub>3</sub>	199-201
25	87	H	i-Pr	H	2-CF <sub>3</sub>	4-OCF <sub>3</sub>	183-185
	88	H	i-Pr	H	2-CF <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub>	211-212
	89	H	t-Bu	H	2-CF <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub>	191-192
30	90	H	R-(-)-s-Bu	H	2-Me	4-OCF <sub>3</sub>	170-172
	91	H	S-(+)-s-Bu	H	2-Me	4-OCF <sub>3</sub>	177-179
35	92	Me	i-Pr	H	H	4-CF <sub>3</sub>	aceite
	93	Me	i-Pr	H	2-OCF <sub>2</sub> H	4-OCF <sub>3</sub>	162-164
	94	H	t-Bu	H	2-CF <sub>3</sub>	4-OCF <sub>3</sub>	145-148
40	95	H	i-Pr	Me	2-CF <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub>	151-154
	96	H	i-Pr	Me	2-CF <sub>3</sub>	4-OCF <sub>3</sub>	140-144
	97	H	i-Pr	H	2-OCF <sub>2</sub> H	4-CF <sub>3</sub>	224-227
45	98	H	i-Pr	H	2,4-di-Me	2-Me-4-CF <sub>3</sub>	> 230
	99	H	i-Pr	H	2-Cl	2-Me-4-CF <sub>3</sub>	> 230
50	100	H	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> OC H <sub>3</sub>	H	2-Cl	2-Me-4-CF <sub>3</sub>	194-197
	101	H	s-Bu	H	2-Cl	2-Me-4-CF <sub>3</sub>	212-214
	102	H	c-Pr	H	2-Me	4-OCF <sub>3</sub>	208-210
55	103	H	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> OC H <sub>3</sub>	H	2,4-di-Me	4-OCF <sub>3</sub>	166-168
60	104	H	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> OC H <sub>3</sub>	H	2,4-di-Me	4-CF <sub>3</sub>	192-194
	105	H	i-Pr	H	4-Me	4-CF <sub>3</sub>	212-213

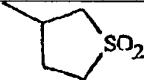
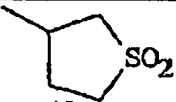
65

## ES 2 278 738 T3

5	106	H	i-Pr	H	4-Me	4-OCF <sub>3</sub>	204-205
	107	H	i-Pr	H	2-Br-4-Me	4-OCF <sub>3</sub>	> 230
	108	H	t-Bu	H	2-Br-4-Me	4-OCF <sub>3</sub>	118-120
	109	H	i-Pr	H	2-NO <sub>2</sub>	4-CF <sub>3</sub>	203-204
10	110	H	t-Bu	H	2-NO <sub>2</sub>	4-CF <sub>3</sub>	199-200
	111	H	i-Pr	H	2-NO <sub>2</sub>	4-OCF <sub>3</sub>	204-205
	112	H	t-Bu	H	2-NO <sub>2</sub>	4-OCF <sub>3</sub>	181-183
15	113	H	i-Pr	H	2-Me	2-Me-4-S(O) 2CF <sub>2</sub> H	218-221
	114	H	i-Pr	H	2-Me	2-Me-4-S(O) CF <sub>2</sub> H	203-206
20	115	H	CH(CH <sub>3</sub> ) CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	H	3-Cl	4-CF <sub>3</sub>	158-161
	116	H	i-Pr	H	4-Br	4-CF <sub>3</sub>	232-234
	117	H	t-Bu	H	4-Br	4-CF <sub>3</sub>	204-206
25	118	H	CH	H	4-Br	4-CF <sub>3</sub>	157-158
	119	H	i-Pr	H	4-Br	4-OCF <sub>3</sub>	221-222
	120	H	t-Bu	H	4-Br	4-OCF <sub>3</sub>	173-175
30	121	H	CH(CH <sub>3</sub> ) CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	H	4-Br	4-OCF <sub>3</sub>	153-155
35	122	H	CH(CH <sub>3</sub> ) CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	H	3-Cl	4-OCF <sub>3</sub>	137-140
	123	H	i-Pr	H	4-F	4-CF <sub>3</sub>	205-206
40	124	H	t-Bu	H	2-Cl	2-Me-4-CF <sub>3</sub>	237-240
	125	H	2-Pent	H	2-Me	4-CF <sub>3</sub>	194-196
	126	H	s-Bu	H	2-Me	4-CF <sub>3</sub>	207-210
45	127	H	Et	H	2-Me	4-CF <sub>3</sub>	> 240
	128	H	Me	H	2-Me	4-CF <sub>3</sub>	236-237
	129	H	i-Pr	H	4-F	4-OCF <sub>3</sub>	208-209
50	130	H	CH(CH <sub>3</sub> ) CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	H	4-F	4-OCF <sub>3</sub>	151-152
55	131	H	CH(CH <sub>3</sub> ) CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	H	2-Me	4-CF <sub>3</sub>	188-190
60	132	CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Me	i-Pr	H	H	4-CF <sub>3</sub>	aceite
	133	CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> Me	i-Pr	H	H	4-OCF <sub>3</sub>	aceite

65

ES 2 278 738 T3

	134	Me	Et	H	2-Me	4-CF <sub>3</sub>	aceite
	135	Me	Et	H	2-Me	4-OCF <sub>3</sub>	aceite
5	136	Me	Et	H	2-Me	2-Me-4-SCF <sub>2</sub> H	132-136
	137	H	CH(CH <sub>3</sub> ) CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	H	2-Me-4-Br	4-CF <sub>3</sub>	197-199
10	138	H	CH(CH <sub>3</sub> ) CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	H	2-Me-4-Br	4-OCF <sub>3</sub>	188-190
	139	H	i-Pr	H	3-Cl	4-CF <sub>3</sub>	201-202
15	140	H	t-Bu	H	3-Cl	4-CF <sub>3</sub>	159-161
	141	H	i-Pr	H	3-Cl	4-OCF <sub>3</sub>	190-192
20	142	H	t-Bu	H	3-Cl	4-OCF <sub>3</sub>	150-152
	143	H	iPr	H	2-Br-4-Me	4-CF <sub>3</sub>	>230
	144	H	t-Bu	H	2-Br-4-Me	4-CF <sub>3</sub>	213-215
25	145	H	CH(CH <sub>3</sub> ) CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	H	5-F	4-CF <sub>3</sub>	145-147
	146	H		H	2-Me	4-CF <sub>3</sub>	>230
30	147	H	i-Pr	H	2-Me	2-F-4-CF <sub>3</sub>	224-226
	148	H	i-Pr	H	2-Me	2-CF <sub>3</sub> -4-F	223-225
35	149	H	t-Bu	H	4-F	4-OCF <sub>3</sub>	180-187
	150	H	CH(CH <sub>3</sub> ) CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	H	2-Me	2-Me-4-CF <sub>3</sub>	194-197
40	151	H	Me	H	2-Me	2-Me-4-CF <sub>3</sub>	> 230
	152	H	Et	H	2-Me	2-Me-4-CF <sub>3</sub>	243-245
45	153	H		H	2-Me	2-Me-4CFg	> 230
	154	H	i-Pr	H	3-NO <sub>2</sub>	4-CF <sub>3</sub>	244-246
50	155	H	i-Pr	H	3-NO <sub>2</sub>	4-OCF <sub>3</sub>	239-240
	156	H	t-Bu	H	3-NO <sub>2</sub>	4-OCF <sub>3</sub>	180-184
55	157	H	CH(CH <sub>3</sub> ) CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	H	3-NO <sub>2</sub>	4-OCF <sub>3</sub>	172-175
	158	H	t-Bu	H	3-NO <sub>2</sub>	4-CF <sub>3</sub>	194-196
60	159	H	CH(CH <sub>3</sub> ) CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	H	3-NO <sub>2</sub>	4-CF <sub>3</sub>	178-179
	160	H	i-Pr	H	2-Cl	4-CF <sub>3</sub>	> 230

65

## ES 2 278 738 T3

5	161	H	CH(CH <sub>3</sub> ) CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	H	2-Cl	4-CF <sub>3</sub>	182-185
	162	H	t-Bu	H	5-Cl	2-Me-4-CF <sub>3</sub>	203-205
10	163	H	CH(CH <sub>3</sub> ) CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	H	5-Cl	2-Me-4-CF <sub>3</sub>	154-155
	164	H	i-Pr	H	2-Me	2, 4-(CF <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	> 230
	165	H	i-Pr	H	2-Me	3, 4-OCF <sub>2</sub> O-	199-200
15	166	H	CH <sub>2</sub> CN	H	2-Me	4-CF <sub>3</sub>	218-223
	167	H	CH(CH <sub>3</sub> )Ph	H	2-Me	4-CF <sub>3</sub>	225-228
	168	H	CH(CH <sub>3</sub> )Ph	H	2-Me	4-OCF <sub>3</sub>	208-210
20	169	H	t-Bu	H	2-Cl	4-CF <sub>3</sub>	191-193
	170	H	i-Pr	Me	2-Cl	4-CF <sub>3</sub>	136-140
	171	H	i-Pr	H	2-Me	4-SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	> 250
25	172	H	i-Pr	H	5-Cl	4-CF <sub>3</sub>	217-218
	173	H	t-Bu	H	S-Cl	4-CF <sub>3</sub>	231-235
30	174	H	CH(CH <sub>3</sub> ) CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	H	5-Cl	4-CF <sub>3</sub>	175-177
	175	H	i-Pr	H	4-I	4-CF <sub>3</sub>	> 230
35	176	H	t-Bu	H	4-I	4-CF <sub>3</sub>	215-219
	177	H	CH(CH <sub>3</sub> ) CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	H	4-I	4-CF <sub>3</sub>	173-178
40	178	H	i-Pr	H.	4-I	4-OCF <sub>3</sub>	> 230
	179	H	t-Bu	H	4-I	4-OCF <sub>3</sub>	192-194
45	180	H	CH(CH <sub>3</sub> ) CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	H	4-I	4-OCF <sub>3</sub>	178-180
	181	H	CH <sub>2</sub> (3-piridinil)	H	2-Me	4-CF <sub>3</sub>	198-199
50	182	H	CH <sub>2</sub> CN	H	2-Me	2-Me-4-CF <sub>3</sub>	> 230
	183	H	CH(CH <sub>3</sub> ) CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	H	2-Me	4-CF <sub>3</sub>	223-225
55	184	H	i-Pr	H	2-F	4-CF <sub>3</sub>	228-229
	185	H	i-Pr	H	5-F	4-CF <sub>3</sub>	169-170
	186	H	i-Pr	H	2-F	2-Me-4-OCF <sub>3</sub>	206-208
60	187	H	i-Pr	H	5-F	2-Me-4-OCF <sub>3</sub>	125-126
	188	H	i-P	rH	2-F	2-Me-4-CF <sub>3</sub>	234-235
65	189	H	i-Pr	H	5-F	2-Me-4-CF <sub>3</sub>	133-135

## ES 2 278 738 T3

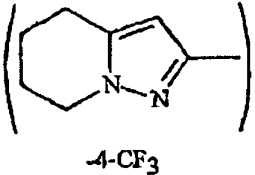
	190	H	CH <sub>2</sub> (3-piridinil)	H	2-Me	4-OCF <sub>3</sub>	201-202
5	191	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	H	2-Me	4-CF <sub>3</sub>	187-188
	192	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	H	2-Me	2-Me-4-CF <sub>3</sub>	250-251
	193	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SEt	H	2-Me	4-CF <sub>3</sub>	190-191
10	194	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> SEt	H	2-Me	2-Me-CF <sub>3</sub>	228-230
	195	H	CH(CH <sub>3</sub> ) CH=CH <sub>2</sub>	H	2-Me	2-Me-4-CF <sub>3</sub>	211-214
15	196	H	i-Pr	H	2-Et	4-CF <sub>3</sub>	228-230
	197	H	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> OC H <sub>3</sub>	H	2-Et	4-CF <sub>3</sub>	176-177
20	198	H	i-Pr	H	2-Me	3, 4-OCF <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> O-	218-220
	199	H	i-Pr	H	2-Me	2-(CONMe <sub>2</sub> )-4,5-Cl <sub>2</sub>	229-230
25	200	H	i-Pr	H	2-Me	2-(CO-1-piperidinil)-4,5- Cl <sub>2</sub>	202-205
	201	H	t-Bu	H	2-Et	4-CF <sub>3</sub>	187-191
30	202	H	CH(CH <sub>3</sub> ) CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	H	2-Et	2-Me-4-CF <sub>3</sub>	206-208
	203	H	i-Pr	H	2-Me	2-(CONMe <sub>2</sub> )-4-Br	191-194
	204	H	i-Pr	H	2-Me	2-(CONMe <sub>2</sub> )-5-Br	190-194
35	205	H	CH(CH <sub>3</sub> ) CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	2-Me	2-Me-4-CF <sub>3</sub>	231-233
40	206	H	c-Pr	H	2-Me	2-Me-4-CF <sub>3</sub>	258-261
	207	H	c-Pr	H	2-Cl	2-Me-4-CF <sub>3</sub>	> 260
	208	H	i-Pr	H	2-I	2-Me-4-OCF <sub>3</sub>	241-242
45	209	H	i-Pr	H	2-I	2-Me-4-CF <sub>3</sub>	260-262
	210	H	i-Pr	H	2-Me	2-(CONMe <sub>2</sub> )-4-F	164-170
	211	H	i-Pr	H	2-Me	2-(CONMe <sub>2</sub> )-5-F	167-171
50	212	H	i-Pr	H	2-Me	2-(CO-1-piperidinil)-4- Br	105-117
	213	H	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> OH	H	2-Me	2-Me-4-CF <sub>3</sub>	179-180
55	214	H	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> OH	H	2-Cl	2-Me-4-CF <sub>3</sub>	183-185
	215	H	i-Pr	H	2-Cl	2-(CONMe <sub>2</sub> )-4-Br	165-170
	216	H	i-Pr	H	2-Cl	2-(CONMe <sub>2</sub> )-5-Br	179-181
60	217	H	i-Pr	H	2-Me	2-(3-CF <sub>3</sub> -1-pirazolil)-4- CF <sub>3</sub>	243-244

65

## ES 2 278 738 T3

5	218	H	i-Pr	H	2-Me	2-(1-(1,2,4-triazolil))-4-CF <sub>3</sub>	238-240
	219	H	i-Pr	H	2-Me	2-(3-Br-1-pirazolil)-4-CF <sub>3</sub>	> 250
10	220	H	i-Pr	H	2-Me	2-(3-CN-1-pirazolil)-4-	>250
	221	H	i-Pr	H	2-Me	2-(4-CF <sub>3</sub> -1-imidazolil)-	>250
	222	H	i-Pr	H	2-Me	2-(3-CH <sub>3</sub> -1-pirazolil)-	248-250
15	223	H	i-Pr	H	2-Me	2-(2-CH <sub>3</sub> -1-imidazolil)-	186-188
	224	H	i-Pr	H	2-Me2-(3-CF <sub>3</sub> -1-(1,2,4-	triazolil))-4-CF <sub>3</sub>	254-256
20	225	H	i-Pr	H	2-Me	2-(1-pirazolil)-4-CF <sub>3</sub>	246-248
	226	H	i-Pr	H	2-Me	2-(3-CO <sub>2</sub> Et-5-Me-1-pirazolil)-4-CF <sub>3</sub>	224-225
25	227	H	i-Pr	H	2-Me	2-(1-imidazolil)-4-CF <sub>3</sub>	240-241
	228	H	i-Pr	H	2-Me	2-(3-CF <sub>3</sub> -5-Me-1-pirazolil)-4-CF <sub>3</sub>	229-231
30	229	H	i-Pr	H	2-Me2-(3,	5-Me2-1-pirazolil)-4-CF <sub>3</sub>	214-218
35	230	H	i-Pr	H	2-Me2-(2,	4-Me2-1-imidazolil)-4-CF <sub>3</sub>	246-248
	231	H	i-Pr	H	2-Me2-(4-Me-1-imidazolil)-	4-CF <sub>3</sub>	223-225
40	232	H	i-Pr	H	2-Cl	2-(3-CF <sub>3</sub> -1-pirazolil)-4-CF <sub>3</sub>	> 250
45	233	H	i-Pr	H	2-Cl	2-(1-(1,2,4-triazolil))-4-CF <sub>3</sub>	252-254
50	234	H	i-Pr	H	2-Cl	2-(3-Br-1-pirazolil)-4-CF <sub>3</sub>	> 250
	235	H	i-Pr	H	2-Cl	2-(3-CO <sub>2</sub> Et-5-Me-1-pirazolil)-4-CF <sub>3</sub>	220-221
55	236	H	i-Pr	H	2-Cl	2-(4-CO <sub>2</sub> Me-1-imidazolil)-4-CF <sub>3</sub>	255-257
60	237	H	i-Pr	H	2-Cl	2-(3-CN-1-pirazolil)-4-CF <sub>3</sub>	>250
65	238	H	i-Pr	H	2-Cl	2-(1-imidazolil)-4-CF <sub>3</sub>	248-249

ES 2 278 738 T3

239	H	i-Pr	H	2-Me	2-(4-CO <sub>2</sub> Me-1-imidazolil)-4-CF <sub>3</sub>	219-222
240	H	i-Pr	H	2-Me	2-(2-tienil)-4-CF <sub>3</sub>	241-243
241	H	i-Pr	H	2-Me	2-(3-tienil)-4-CF <sub>3</sub>	229-231
242	H	i-Pr	H	2-Me	2-(2-furanil)-4-CF <sub>3</sub>	246-247
243	H	i-Pr	H	2-Me	2-(3-t-Bu-1-pirazolil)-4-CF <sub>3</sub>	247-249
244	H	i-Pr	H	2-Me	2-(3-s-Bu-1-pirazolil)-4-CF <sub>3</sub>	224-225
245	H	i-Pr	H	2-Me	2-(3-c-Pr-1-pirazolil)-4-CF <sub>3</sub>	220-221
246	H	i-Pr	H	2-Me	2-(3-Me-5-isoxazolil)-4-CF <sub>3</sub>	233-234
247	H	i-Pr	H	2-Me	 -4-CF <sub>3</sub>	> 250
248	H	i-Pr	H	2-Me	2-(CONMe <sub>2</sub> )-4-CF <sub>3</sub>	188-192
249	H	i-Pr	H	2-Me	2-(CONMe <sub>2</sub> )-5-CF <sub>3</sub>	194-196
250	H	i-Pr	H	2-Me	2-(CO-1-pirrolidinil)-4-CF <sub>3</sub>	201-204
251	H	i-Pr	H	2-Me	2-(CO-1-pirrolidinil)-5-CF <sub>3</sub>	221-223
252	H	i-Pr	H	2-Me	2-OCH <sub>3</sub> -4-CF <sub>3</sub>	188-189
253	H	i-Pr	H	2-Me	2-(3-Cl-5-isoxazolil)-4-CF <sub>3</sub>	247-248
254	H	i-Pr	H	2-Me	2-Oi-Pr-4-CF <sub>3</sub>	158-159
255	H	i-Pr	H	2-Cl	2-(4-Me-1-pirazolil)-4-CF <sub>3</sub>	252-253
256	H	i-Pr	H	2-Me	2-(4-Me-1-pirazolil)-4-CF <sub>3</sub>	226-227
257	H	i-Pr	H	2,5-Cl <sub>2</sub>	2-Me-4-CF <sub>3</sub>	235-237
258	H	i-Pr	H	2-Me	4-Ph	221-224
259	H	i-Pr	H	2-Me	4-(4-OCH <sub>3</sub> )Ph	>230
260	H	i-Pr	H	2-Me	4-(2-Me)Ph	156-158

ES 2 278 738 T3

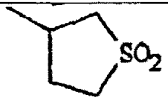
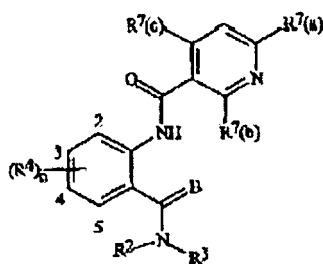
261	H	i-Pr	H	2-Me	4-(3-CH <sub>3</sub> )Ph	225-226
262	H	i-Pr	H	2-Me	4-(3-CF <sub>3</sub> )Ph	214-215
263	H	i-Pr	H	2-Me	4-(4-F)Ph	>230
264	H	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> -		2-Cl	3-Cl	158-161
265	H		H	2-Me	4-OCF <sub>3</sub>	>230
266	H	i-Pr	H	2-CF <sub>3</sub>	2-Me-4-Br	>230
267	H	t-Bu	H	2-CF <sub>3</sub>	2-Me-4-Br	234-236
268	H	i-Pr	Me	2-CF <sub>3</sub>	2-Me-4-Br	154-158
269	H	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> OC H <sub>3</sub>	H	2-CF <sub>3</sub>	2-Me-4-Br	202-204
270	H	s-Bu	H	2-CF <sub>3</sub>	2-Me-4-Br	>230
271	H	s-pentilo	H	2-CF <sub>3</sub>	2-Me-4-Br	215-217
272	H	i-Pr	H	2-CH <sub>3</sub>	2-Me-4-CF <sub>3</sub>	>230
273	H	i-Pr	Me	2-OCHF <sub>2</sub>	2-Me-4-Br	224-227
274	H	i-Pr	H	2-CH <sub>3</sub>	2-(CONMe <sub>2</sub> )-4-CF <sub>3</sub>	130-137
275	B es S H	i-Pr	H	2-Me	2-Me-4-CF <sub>3</sub>	193-195
276	H	i-Pr	H	2-Cl	2-(1-pirazolil)-4-CF <sub>3</sub>	249-250
277	B es S H	i-Pr	H	2-Me	4-OCF <sub>3</sub>	169-171
278	B es S H	i-Pr	H	2-Me	4-CF <sub>3</sub> Ph	204-206

TABLA ÍNDICE B



R<sup>7</sup>(c) es H, excepto cuando se indique de otra forma

y B es O, excepto cuando se indique de otra forma

Compuesto	R <sup>3</sup>	R <sup>2</sup>	(R <sup>4</sup> ) <sub>n</sub>	R <sup>7</sup> (a)	R <sup>7</sup> (b)	p.f.°C
B1 (Ej. 4)	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	247-248
B2	i-Pr	H	2-Me	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	188-191



## ES 2 278 738 T3

	B3	i-Pr	H	2-Cl	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	234-236
	B4	t-Bu	H	2-Cl	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	243-245
5	B5	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	H	2-Cl	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	198-201
	B6	CH(CH <sub>3</sub> )CH=CH <sub>2</sub>	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	226-227
10	B7	i-P	rH	2-Cl	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	208-210
	B8	t-Bu	H	2-Cl	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	174-175
	B9	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	H	2-Cl	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	163-165
15	B10	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	H	208-211
	B11	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	187-191
20	B12	s-Bu	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	215-218
	B13	2-pentilo	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	213-215
	B14	i-Pr	H	2-Me	Cl	H	235-237
25	B15	i-Pr	H	2-Me	H	Cl	235-237
	B16	i-Pr	H	2-OCHF <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	221-224
30	B17	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	208-209
	B18	t-Bu	H	2-Me	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	211-212
	B19	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	H	2-Me	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	193-196
35	B20	t-Bu	H	2-CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	>250
	B21	t-Bu	H	2-CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	218-222
40	B22	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	H	2-CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	200-202
	B23	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	Br	253-255
	B24	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	222-223
45	B25	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CN	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	230-232
	B26	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CN	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	>260
50	B27	c-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	>260
	B28	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	181-183
	B29	i-Pr	H	2-Me	Cl	CH <sub>3</sub>	246-247
55	B30	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	Ph	>250
	B31	i-Pr	H	2-I	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	256-257
	B32	i-Pr	H	2-F	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	218-220
60	B33	i-Pr	H	5-F	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	144-146
	B34	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> SO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	243-245
	B35	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> OH	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	222-223
65	B36	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	204-206

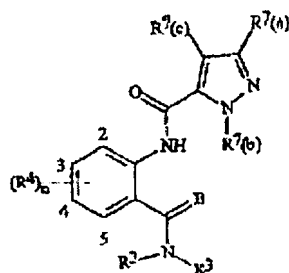
## ES 2 278 738 T3

	B37	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	241-242
5	B38	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	229-231
	B39	i-Pr	H	2-Me	CH <sub>3</sub>	Cl	236-237
	B40	i-Pr	H	2-Me	CH <sub>3</sub>	2-piridinil	278-281
10	B41	t-Bu	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	234-236
	B42	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	n-Pr	224-226
	B43	i-Pr	Me	2-Me	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	202-205
15	B44	i-Pr	H	2-Me	c-Pr	CH <sub>3</sub>	226-229
	B45	i-Pr	H	2-Me	c-Pr	CH <sub>3</sub> , sal de HCl	> 230
20	B46	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	Cl	248-254
	B47	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	i-Pr	235-237
25	B48	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	1-(1,2,4- triazolil)	> 260
	B49	i-Pr	H	2-Br	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	247-248
30	B50	i-Pr	H	2-Me	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	150-160
	B51	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	2-fenoxilo	231-232
35	B52	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	1-morfolinil	> 250
	B53	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	1-(3-CF <sub>3</sub> - imidazolil)	247-250
40	B54	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	1-(3-Br- pirazolil)	> 260
	B55	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	1-(3-CF <sub>3</sub> - pirazolil)	> 260
45	B56	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	1-((3-CF <sub>3</sub> )- 1,2,4-triazolil)	> 260
50	B57	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	1-((3-CN)- 1,2,4-triazolil)	> 260
55	B58	i-Pr	H	2-Me	i-Bu	Cl	185-190
	B59	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	2-MePh	200-203
	B60	i-Pr	H	2-Me	i-Pr	CH <sub>3</sub>	186-190
60	B61	i-Pr	H	2-Me	Ph	Cl	229-234
	B62	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	SCH <sub>2</sub> CH(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	230-231
	B63	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	209-211
65	B64	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	1-pirazolil	> 250

ES 2 278 738 T3

B65	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	> 250
B66	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	i-Pr	209-212
B67	i-Pr	H	2-Me, 4Br	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	> 250
B68	i-Pr	H	2-Me	OCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	n-Pr	165-169
B69	i-Pr	H	2-Me	Cl	n-Pr	200-205
B70	i-Pr	H	2-Me	Cl	Et	200-205
B71	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	CN	214-215
B72	i-Pr	H	2,5-Cl <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	> 240
B73	i-Pr	H	2-Me	H	H, R <sup>7(c)</sup> es SPh	223-225
B74	B es S, i-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	201-203
B75	BesS, i-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	Et	173-175
B76	B es S, i-Pr	H	2-Me	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	156-158
B77	i-Pr	H	2-Me	H	1-((3-CF <sub>3</sub> )- pirazlil)	224-225
B78	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	2-CIPh	223-225

TABLA INDICE C



B es O, excepto cuando se indique de otra forma

Compuesto	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	(R <sup>4</sup> ) <sub>n</sub>	R <sup>7(a)</sup>	R <sup>7(b)</sup>	p.f. °C
C1 (Ej. 5)	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	252-253
C2	i-Pr	H	2-Cl	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	260-262
C3	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	OCH <sub>3</sub>	195-196
C4	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	N(CH <sub>3</sub> ) <sub>2</sub>	270-272
C5	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	Et	246-248
C6	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	Ph	175-177
C7	i-Pr	H	2-Me	i-Pr	Et	179-182
C8	i-Pr	H	2-Me	c-Pr	Et	202-204
C9	i-Pr	H	2-Me	i-Pr	CH <sub>3</sub>	206-209
C10	i-Pr	H	2-Me	c-Pr	CH <sub>3</sub>	222-225

## ES 2 278 738 T3

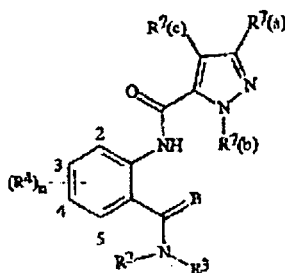
	C11	i-Pr	H	2-Me	c-Pr	Ph	236-239
5	C12	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	SCH <sub>3</sub>	244-247
	C13	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	1-pirrolidinil	272-273
	C14	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	OCH <sub>2</sub> C(Cl)=CH <sub>2</sub>	142-144
10	C15	Et	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	2-MePh	253-256
	C16	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	2-MePh	244-246
	C17	t-Bu	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	2-MePh	251-253
15	C18	Et	H	2-Cl	CF <sub>3</sub>	2-MePh	242-243
	C19	i-Pr	H	2-Cl	CF <sub>3</sub>	2-MePh	237-240
	C20	t-Bu	H	2-Cl	CF <sub>3</sub>	2-MePh	253-255
20	C21	Et	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	2-ClPh	251-252
	C22	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	2-ClPh	246-248
25	C23	t-Bu	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	2-ClPh	238-239
	C24	Et	H	2-Cl	CF <sub>3</sub>	2-ClPh	248-249
	C25	i-Pr	H	2-Cl	CF <sub>3</sub>	2-ClPh	254-255
30	C26	t-Bu	H	2-Cl	CF <sub>3</sub>	2-ClPh	240-242
	C27	Et	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	c-Pr	236-238
35	C27	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	c-Pr	240-241
	C29	t-Bu	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	c-Pr	246-248
	C30	Et	H	2-Cl	CF <sub>3</sub>	c-Pr	240-242
40	C31	i-Pr	H	2-Cl	CF <sub>3</sub>	c-Pr	232-235
	C32	t-Bu	H	2-Cl	CF <sub>3</sub>	c-Pr	266-268
	C33	Et	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	i-Pr	230-231
45	C34	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	i-Pr	211-214
	C35	t-Bu	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	i-Pr	210-213
	C36	Et	H	2-Cl	CF <sub>3</sub>	i-Pr	247-249
50	C37	i-Pr	H	2-Cl	CF <sub>3</sub>	i-Pr	236-239
	C38	t-Bu	H	2-Cl	CF <sub>3</sub>	il-Pr	235-238
55	C39	Et	H	2-Me	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	2-MePh	247
	C40	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	2-MePh	218-220
	C41	t-Bu	H	2-Me	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	2-MePh	224-226
60	C42	Et	H	2-Cl	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	2-MePh	241-243
	C43	i-Pr	H	2-Cl	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	2-MePh	232-234
	C44	t-Bu	H	2-Cl	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	2-MePh	237-239
65	C45	Et	H	2-Me	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	2-ClPh	255-257

## ES 2 278 738 T3

5	C46	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	2-ClPh	224
	C47	t-Bu	H	2-Me	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	2-ClPh	215
	C48	Et	H	2-Cl	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	2-ClPh	248-250
	C49	i-Pr	H	2-Cl	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	2-ClPh	222-224
10	C50	t-Bu	H	2-Cl	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	2-ClPh	242
	C51	Et	H	2-Me	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Ph	246-248
	C52	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Ph	220
15	C53	t-Bu	H	2-Me	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Ph	242
	C54	Et	H	2-Cl	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Ph	238-240
	C55	i-Pr	H	2-Cl	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Ph	260
20	C56	t-Bu	H	2-Cl	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Ph	231-232
	C57	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	208
25	C58	t-Bu	H	2-Me	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	242-244
	C59	Et	H	2-Cl	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	210-212
	C60	i-Pr	H	2-Cl	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	195
30	C61	t-Bu	H	2-Cl	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	246-248
	C62	Et	H	2-Me	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	c-Pr	224-225
	C63	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	c-Pr	232-234
35	C64	Et	H	2-Cl	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	c-Pr	216-218
	C65	i-Pr	H	2-Cl	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	c-Pr	218-220
40	C66	t-Bu	H	2-Cl	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	c-Pr	210-212
	C67	Et	H	2-Me	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	i-Pr	218-220
	C68	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	i-Pr	196-198
45	C69	t-Bu	H	2-Me	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	i-Pr	212-214
	C70	Et	H	2-Cl	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	i-Pr	216-220
50	C71	i-Pr	H	2-Cl	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	i-Pr	215-218
	C72	t-Bu	H	2-Cl	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	i-Pr	240-244
	C73	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Et	210-212
55	C74	Et	H	2-Me	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Et	230-232
	C75	Et	H	2-Cl	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Et	210-213
	C76	i-Pr	H	2-Cl	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Et	203-204
60	C77	t-Bu	H	2-Cl	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Et	230-232
	C78	Et	H	2-Me	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	238-240
65	C79	B es S i-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	Et	190-193
	C80	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	2-CF <sub>3</sub> Ph	255-258

ES 2 278 738 T3

TABLA ÍNDICE D



R<sup>7</sup> (c) es H, excepto donde se indique de otra forma

y B es O, excepto donde se indique de otra forma

Compuesto	R <sup>3</sup>	R <sup>2</sup>	(R <sup>4</sup> ) <sub>n</sub>	R <sup>7</sup> (a)	R <sup>7</sup> (b)	p.f. °C
D1	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	200-204
D2	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	Et	123-126
D3	i-Pr	H	2-Cl	CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	233-235
D4	t-Bu	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	Et	215-218
D5	i-Pr	H	2-Me	CH <sub>3</sub>	Ph	238-239
D6	i-Pr	H	2-Me	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	206-208
D7	i-Pr	H	2-Me	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	246-248
D8	i-Pr	H	2-Cl	Et	CF <sub>3</sub>	235-237
D9	i-Pr	H	2-Me	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub> , R <sup>7</sup> (c) es Cl	205-207
D10	i-Pr	H	2-Me	CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> Ph	256-258
D11	i-Pr	H	2-Me	CH <sub>3</sub>	2-CF <sub>3</sub> Ph	204-206
D12	t-Bu	H	2-Me	CH <sub>3</sub>	Ph	236-238
D13	i-Pr	H	2-F	CH <sub>3</sub>	Ph	227-229
D14	i-Pr	H	5-F	CH <sub>3</sub>	Ph	209-211
D15	i-Pr	H	2-Cl	CH <sub>3</sub>	Ph	233-234
D16	i-Pr	H	H	CH <sub>3</sub>	Ph	215-217
D17	i-Pr	H	2-NO <sub>2</sub>	CH <sub>3</sub>	Ph	236-237
D18	i-Pr	H	2-Cl	CF <sub>3</sub>	Ph	240-242
D19 (Ej. 6)	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	Ph	260-262
D20	i-Pr	H	2-I	CH <sub>3</sub>	Ph	250-251
D21	i-Pr	H	2-I	CH <sub>3</sub>	2-CF <sub>3</sub> Ph	251-253
D22	H	H	2-Me	CH <sub>3</sub>	Ph	253-255
D23	Et	Et	2-Me	CH <sub>3</sub>	Ph	182-184
D24	i-Pr	H	2-Cl	CF <sub>3</sub>	Ph	232-234

## ES 2 278 738 T3

	D25	i-Pr	H	2-I	CF <sub>3</sub>	Ph	271-273
	D26	t-Bu	H	2-I	CF <sub>3</sub>	Ph	249-250
5	D27	i-Pr	H	2-Me	CH <sub>3</sub>	t-Bu	210-211
	D28	i-Pr	H	2-Br	CF <sub>3</sub>	Ph	257-259
10	D29	i-Pr	H	2-Br	CH <sub>3</sub>	Ph	246-247
	D30	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	2-piridinil	237-238
	D31	i-Pr	H	2,5-Cl <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	Ph	> 250
15	D32 B es S,	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	Ph	169-172
	D33	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	2-CIPh	208-209
20	D34	i-Pr	H	2-Cl	CF <sub>3</sub>	2-CIPh	234-235
	D35	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	4-CIPh	289-290
	D36	i-Pr	H	2-Cl	CF <sub>3</sub>	3-CIPh	276-278
25	D37	i-Pr	H	2-Cl	CF <sub>3</sub>	2-piridinil	239-240
	D38	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	2-pirimidinil	205-208
30	D39	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	2-(3-CH <sub>3</sub> - pirindinil)	183-187
	D40	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Ph	231-232
35	D41	i-Pr	H	2-Cl	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Ph	206-207
	D42	t-Bu	H	2-Cl	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Ph	212-213
	D43	i-Pr	H	2-Br	CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Ph	219-222
40	D44	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	3-CIPh	278-280
	D45	i-Pr	H	2-Cl	CF <sub>3</sub>	3-CIPh	272-273
	D46	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	2-CIPh	217-218
45	D47	i-Pr	H	2-Cl	CF <sub>3</sub>	2-CIPh	220-221
	D48	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	4-CIPh	269-270
	D49	i-Pr	H	2-Cl	CF <sub>3</sub>	4-CIPh	279-280
50	D50	i-Pr	H	2-I	c-Pr	CH <sub>3</sub>	222-224
	D51	i-Pr	H	5-I	c-Pr	CH <sub>3</sub>	215-217
55	D52	i-Pr	H	2-CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Ph	247-249
	D53	i-Pr	H	2-Cl	CF <sub>3</sub>	i-Pr	255-258
	D54	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	3-FPh	277-278
60	D55	i-Pr	H	2-Cl	CF <sub>3</sub>	3-FPh	256-257
	D56	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	2-CF <sub>3</sub> Ph	215-216
	D57	i-Pr	H	2-Cl	CF <sub>3</sub>	2-CF <sub>3</sub> Ph	230-231
65	D58	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	2-BrPh	207-208

## ES 2 278 738 T3

	D59	i-Pr	H	2-Cl	CF <sub>3</sub>	2-BrPh	239-240
5	D60	i-Pr	H	2-OCH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Ph	215-216
	D61	i-Pr	H	5-Cl	CF <sub>3</sub>	2-(3-CH <sub>3</sub> - piridinil)	224-225
10	D62	i-Pr	H	5-Me	CF <sub>3</sub>	2-(3-Cl- piridinil)	
	D63	s-Bu	H	2-Cl	CF <sub>3</sub>	Ph	>240
15	D65	Et	H	2-Cl	CF <sub>3</sub>	Ph	>240
	D66	t-Bu	H	2-CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Ph	230-233
20	D67	Et	H	2-CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Ph	246-249
	D68	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	H	2-CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Ph	215-217
	D69	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	H	2-CF <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	Ph	220-223
25	D70	i-Pr	H	5-Cl	CF <sub>3</sub>	2-(3-Cl- piridinil)	230-233
	D71	i-Pr	H	5-Me	CF <sub>3</sub>	2-tiazolil	201-203
30	D72	i-Pr	H	5-Me	CF <sub>3</sub>	2-pirazinil	252-253
	D73	i-Pr	H	5-Me	CF <sub>3</sub>	4-piridinil	224-228
35	D74	iPr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	i-Pr	236-243
	D75i	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	2-CH <sub>3</sub> Ph	211-212
	D76	i-Pr	H	2-Cl	CF <sub>3</sub>	2-CH <sub>3</sub> Ph	232-234
40	D77	i-Pr	H	2-Br	CF <sub>3</sub>	2-ClPh	247-248
	D78	t-Bu	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	2-ClPh	216-217
45	D79 (Ej. 7)	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	2-(3-CF <sub>3</sub> - piridinil)	227-230
	D80	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl	H	2-Cl	CF <sub>3</sub>	Ph	237-242
50	D81	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> Cl	H	2-Cl	CF <sub>3</sub>	Ph	233-239
	D82	CH(CH <sub>3</sub> )CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	2-Cl	CF <sub>3</sub>	Ph	221-222
	D83	S-CH(i-Pr)CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub>	H	2-Cl	CF <sub>3</sub>	Ph	212-213
55	D84	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	2,6-Cl <sub>2</sub> -Ph	267-268
	D85	i-Pr	H	2-Cl	CF <sub>3</sub>	2,6-Cl <sub>2</sub> -Ph	286-287
60	D86	i-Pr	H	2-Me	Br	Ph	253-255
	D87	i-Pr	H	2-Cl	Br	Ph	247-248
	D88	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	i-Bu	205-210
65	D89	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> Ph	235-237
	D90	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	2-(3-OCH <sub>3</sub> -	221-222



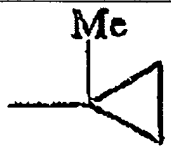
## ES 2 278 738 T3

					piridinil)	
5	D91	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	3-piridinil 260-261
	D92	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	4-quinolinil >260
10	D93	i-Pr	H	2-Me	CN	2-(3-Cl-piridinil) 203-204
	D94	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	2,4-F <sub>2</sub> -Ph 245-246
	D95	i-Pr	H	2-Cl	CF <sub>3</sub>	2,4-F <sub>2</sub> -Ph 252-253
15	D96	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	2-Et-Ph 207-209
	D97	i-Pr	H	2-Cl	CF <sub>3</sub>	2-Et-Ph 221-222
	D98	i-Pr	H	H	CF <sub>3</sub>	2-CIPh 206-207
20	D99	t-Bu	H	H	CF <sub>3</sub>	2-CIPh 197-198
	D100	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	H	H	CF <sub>3</sub>	2-CIPh 145-148
25	D101	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	H	H	CF <sub>3</sub>	2-CIPh 158-160
	D102	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	H	2-Cl	CF <sub>3</sub>	Ph 184-186
	D103	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	H	2-Cl	CF <sub>3</sub>	Ph 217-218
30	D104	n-Pr	H	2-Cl	CF <sub>3</sub>	Ph 247-248
	D105	i-Bu	H	2-Cl	CF <sub>3</sub>	Ph 244-245
35	D106	CH <sub>3</sub>	H	2-Cl	CF <sub>3</sub>	Ph >250
	D107	i-Pr	Me	2-Cl	CF <sub>3</sub>	Ph 193-194
	D108	CH <sub>3</sub> C=CH	H	2-Cl	CF <sub>3</sub>	Ph >250
40	D109	CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	H	2-Cl	CF <sub>3</sub>	Ph 248-249
	D110	CH <sub>2</sub> (2-furanil)	H	2-Cl	CF <sub>3</sub>	Ph 246-247
	D111	i-Pr	H	2-Me	Ph	2-CIPh 133-136
45	D112	i-Pr	H	2-Cl	Ph	2-CIPh 220-221
	D113	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	4-(3,5-Cl <sub>2</sub> -piridinil) 239-242
50	D114	i-Pr	H	2-Cl	CF <sub>3</sub>	4-(3,5-Cl <sub>2</sub> -piridinil) 229-231
55	D115	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	2-CIPh 194-195
	D116	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	2-CIPh 181-183
	D117	s-Bu	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	2-CIPh 199-200
60	D118	c-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	2-CIPh 234-235
	D119	n-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	2-CIPh 222-223
	D120	i-Bu	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	2-CIPh 235-237
65	D121	Me	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	2-CIPh 242-243

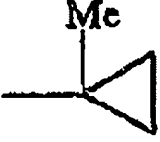
## ES 2 278 738 T3

	D122	i-Pr	Me	2-Me	CF <sub>3</sub>	2-CIPh	90-93
5	D123	CH <sub>2</sub> C=CH	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	2-CIPh	215-216
	D124	Et	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	2-CIPh	228-229
	D125	CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	2-CIPh	227-228
10	D126	CH <sub>2</sub> (2-furanil)	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	2-CIPh	218-219
	D127	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	Ph	179-180
	D128	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	Ph	219-220
15	D129	s-Bu	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	Ph	244-245
	D130	c-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	Ph	> 250
	D131	n-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	Ph	238-239
20	D132	i-Bu	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	Ph	237-238
	D133	Me	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	Ph	263-265
25	D134	i-Pr	Me	2-Me	CF <sub>3</sub>	Ph	178-179
	D135	CH <sub>2</sub> C=CH	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	Ph	253-254
	D136	Et	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	Ph	244-245
30	D137	CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	Ph	240-241
	D138	CH <sub>2</sub> (2-furanil)	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	Ph	245-246
	D139	i-Pr	H	2-OCHF <sub>2</sub>	CF <sub>3</sub>	2-CIPh	200-201
35	D140	i-Pr	H	2-OCH <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	2-CIPh	206-207
	D141	i-Pr	H	2-I	CF <sub>3</sub>	2-CIPh	253-256
40	D142	i-Pr	H	2-Me	Br	2-CIPh	147-150
	D143	i-Pr	H	2-Cl	Br	2-CIPh	246-247
	D144	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	2-OCH <sub>3</sub> Ph	218-219
45	D145	i-Pr	H	2-Cl	CF <sub>3</sub>	2-OCH <sub>3</sub> Ph	243-244
	D146	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	1-isoquinolinil	252-253
	D147	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	H	2-Cl	CF <sub>3</sub>	2-CIPh	217-218
50	D148	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	H	2-Cl	CF <sub>3</sub>	2-CIPh	207-208
	D149	s-Bu	H	2-Cl	CF <sub>3</sub>	2-CIPh	216-217
55	D150	c-Pr	H	2-Cl	CF <sub>3</sub>	2-CIPh	261-262
	D151	n-Pr	H	2-Cl	CF <sub>3</sub>	2-CIPh	231-232
	D152	i-Bu	H	2-Cl	CF <sub>3</sub>	2-CIPh	255-256
60	D153	Me	H	2-Cl	CF <sub>3</sub>	2-CIPh	233-235
	D154	i-Pr	Me	2-Cl	CF <sub>3</sub>	2-CIPh	127-128
	D155	CH <sub>2</sub> C=CH	H	2-Cl	CF <sub>3</sub>	2-CIPh	226-227
65	D156	Et	H	2-Cl	CF <sub>3</sub>	2-CIPh	244-246

## ES 2 278 738 T3

	D157	CH <sub>2</sub> CH=CH <sub>2</sub>	H	2-Cl	CF <sub>3</sub>	2-CIPh	235-236
5	D158	CH <sub>2</sub> (2-furanil)	H	2-Cl	CF <sub>3</sub>	2-CIPh	207-208
	D159	i-Pr	H	C=CSi(CH <sub>3</sub> ) <sub>3</sub>	CF <sub>3</sub>	2-CIPh	256-258
	D160	i-Pr	H	C=CH	CF <sub>3</sub>	2-CIPh	228-230
10	D161	i-Pr	H	2-Cl	C=CH	2-CIPh	219-222
	D162	i-Pr	H	2-Me	H	H,R <sup>7</sup> (c)esCH <sub>3</sub>	220-223
	D163	i-Pr	H	2-Me	CH <sub>3</sub>	Ph,R <sup>7</sup> (c)esCl	209-210
15	D164 B es S	i-Pr	H	2-Cl	CF <sub>3</sub>	Ph	169-174
	D165	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	2,6-F <sub>2</sub> Ph	223-225
20	D166	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	2-Cl-6-FPh	203-206
	D167	i-Pr	H	2-Cl	CF <sub>3</sub>	2-Cl-6-FPh	218-221
	D168	i-Pr	H	2-Me-4-Br	CF <sub>3</sub>	2-FPh	232-233
25	D169	t-Bu	H	2-Cl	CF <sub>3</sub>	2-(3-Cl-piridinil)	250-251
30	D170		H	2-Cl	CF <sub>3</sub>	2-(3-Cl-piridinil)	>250
35	D171	Et	Et	2-Cl	CF <sub>3</sub>	2-CIPh	243-247
	D172	Me	Me	2-Cl	CF <sub>3</sub>	2-CIPh	234-235
	D173	Et	Et	2-Me	CF <sub>3</sub>	2-CIPh	237-238
40	D174	Me	Me	2-Me	CF <sub>3</sub>	2-CIPh	225-226
	D175	CH <sub>2</sub> CH <sub>2</sub> N(Me) <sub>2</sub>	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	2-CIPh	188-190
45	D176	i-Pr	H	2-Cl	CF <sub>3</sub>	2-pirazinil	242-243
	D177	t-Bu	H	2-Me-4-Br	CF <sub>3</sub>	2-CIPh	>260
50	D178	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	2-(3-Cl-piridinil)	176-177
	D179	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	2-(3-Cl-piridinil)	196-197
55	D180	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	H	2-Cl	CF <sub>3</sub>	2-(3-Cl-piridinil)	197-198
60	D181	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> SCH <sub>3</sub>	H	2-Cl	CF <sub>3</sub>	2-(3-Cl-piridinil)	202-203
	D182	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	2-IPh	221-222
65	D183	i-Pr	H	2-Cl	CF <sub>3</sub>	2-IPh	238-240
	D184	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	2-(C=CH)-Ph	215-217

## ES 2 278 738 T3

	D185	i-Pr	H	2-Cl	CF <sub>3</sub>	2-(C=CH)-Ph	244-246
5	D186	t-Bu	H	2-Cl	CF <sub>3</sub>	2-(3-Cl-piridinil)	250-251
10	D187		H	2-Cl	CF <sub>3</sub>	2-(3-Cl-piridinil)	>250
15	D188	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	2-Cl-4-FPh	203-205
	D189	i-Pr	H	2-Cl	CF <sub>3</sub>	2-Cl-4-FPh	218-219
20	D190	Me	Me	2-Me	CF <sub>3</sub>	2-ClPh	225-226
	D191	Et	Et	2-Me	CF <sub>3</sub>	2-ClPh	243-247
	D192	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	2,6-Me <sub>2</sub> Ph	259-260
	D193	i-Pr	H	2-Cl	CF <sub>3</sub>	2,6-Me <sub>2</sub> Ph	268-269
25	D194	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	2,6-Cl <sub>2</sub> -4-CNPh	*
	D195	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	2-CNPh	225-235
30	D196	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	2-(OCF <sub>3</sub> )Ph	214-215
	D197	i-Pr	H	2-Cl	CF <sub>3</sub>	2-(OCF <sub>3</sub> )Ph	223-224
	D198	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	2-Br-4-FPh	202-203
35	D199	i-Pr	H	2-Cl	CF <sub>3</sub>	2-Br-4-FPh	222-223
	D200	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	2-(3-Me-pirazinil)	205-207
40	D201	Me	H	2-Cl	CF <sub>3</sub>	2-(3-Cl-piridinil)	215-220
45	D202	CH <sub>2</sub> C=CH	H	2-Cl	CF <sub>3</sub>	2-(3-Cl-piridinil)	197-198
	D207	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	4-(2-Me-quinolinil)	>250
50	D208	i-Pr	H	2-Cl	CF <sub>3</sub>	4-(2-Me-quinolinil)	>250
55	D209	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	4-(7-Cl-quinolinil)	>250
	D210	i-Pr	H	2,4-BR <sup>2</sup>	CF <sub>3</sub>	2-ClPh	233-234
60	D211	i-Pr	H	2-Br	Br	2-ClPh	255-258
	D212	Me	H	2-Me	Br	2-ClPh	236-237
	D213	t-Bu	H	2-Cl	Br	2-ClPh	260-261
65	D214	Et	H	2-Me	Br	2-ClPh	254-255

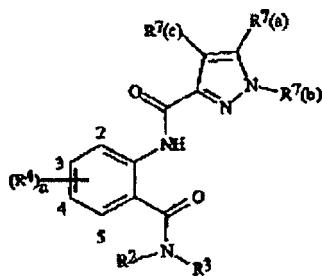
## ES 2 278 738 T3

	D215	t-Bu	H	2-Me	Br	2-CIPh	259-260
5	D216	c-Bu	H	2-Cl	CN	2-(3-Cl-pyridinil)	177-180
10	D217	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	2-(3-Cl-pyridinil)	>250
15	D218	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	4-(6-Cl-quinolinil)	>250
	D219	Me	Me	2-Me	CF <sub>3</sub>	4-(6-Cl-quinolinil)	>250
20	D220	O-i-Pr	H	2-Cl	CF <sub>3</sub>	2-CIPh	218-219
	D221	i-Pr	H	2-Cl	CN	2-(3-Cl-pyridinil)	195-200
25	D222	t-Bu	H	2-Cl	CN	2-(3-Cl-pyridinil)	>250
30	D223	Et	H	2-Cl	CN	2-(3-Cl-pyridinil)	200-205
35	D224	i-Pr	H	2-Cl	CF <sub>3</sub>	2-(3-Me-pyridinil)	225-230
	D225	t-Bu	H	2-Cl	CF <sub>3</sub>	2-(3-Me-pyridinil)	235-240
40	D226	Et	H	2-Cl	CF <sub>3</sub>	2-(3-Me-pyridinil)	210-220
45	D227	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	3-(2-Cl-pyridinil)	*
	D228	i-Pr	H	2-Cl	CF <sub>3</sub>	2,3-Cl <sub>2</sub> Ph	217-219
50	D229	t-Bu	H	2-Cl	CF <sub>3</sub>	2,3-Cl <sub>2</sub> Ph	254-256
	D230	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	2,3-Cl <sub>2</sub> Ph	208-209
	D231	t-Bu	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	2,3-Cl <sub>2</sub> Ph	232-233
55	D232	t-Bu	H	2-Me-4-Br	Br	2-CIPh	239-241
	D233	Me	H	2-Me-4-Br	Br	2-CIPh	150-152
	D234	Et	H	2-Me-4-Br	Br	2-CIPh	223-225
60	D235	i-Pr	H	2-Me-4-Br	Br	2-CIPh	197-198
	D236	Me	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	2-FPh	245-247
	D237	CH <sub>2</sub> C=CH	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	2-FPh	222-227
65	D238	O-i-Pr	H	2-Cl	CN	2-(3-Cl-	205-206

					piridinil)	
D239	O-i-Pr	H	2-Me	CN	2-(3-Cl-piridinil)	210-211
D240	Me	Me	2-Cl	CF <sub>3</sub>	2-ClPh	234-236
D241	CH <sub>2</sub> C=CH	H	2-Me-4-Br	Br	2-ClPh	187-188

\* Ver Tabla Índice Q para los datos de <sup>1</sup>H RMN

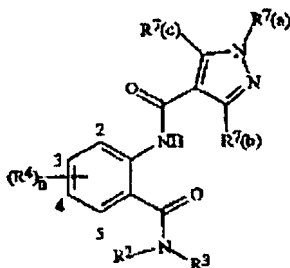
TABLA ÍNDICE E



Compuesto	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	(R <sup>4</sup> ) <sub>n</sub>	R <sup>7</sup> (a)	R <sup>7</sup> (b)	R <sup>7</sup> (c)	p.f. °C
E1	i-Pr	H	2-Me	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	143-145
E2	i-Pr	H	2-Me	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	198-199
E3	i-Pr	H	2-Me	CH <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	Cl	188-190
E4	i-Pr	H	2-Me	CH <sub>3</sub>	4-CF <sub>3</sub> -Ph	H	198-199
E5	i-Pr	H	2-Me	CH <sub>3</sub>	2-CF <sub>3</sub> -Ph	H	211-213
E6	i-Pr	H	2-Me	CH <sub>3</sub>	t-Bu	H	125-127
E7	i-Pr	H	2-Me	CH <sub>3</sub>	CH <sub>2</sub> Ph	H	130-135
E8	i-Pr	H	2-Me	H	Ph	CH <sub>3</sub>	249-250
E9	i-Pr	H	2-Me	H	CH <sub>3</sub>	Ph	268-270
E10	i-Pr	H	2-Cl	H	Ph	CH <sub>3</sub>	260-261
E11	i-Pr	H	2-Me	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Ph	213-215
E12	i-Pr	H	2-Cl	H	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	Ph	208-209
E13	i-Pr	H	2-Me	H	CHF <sub>2</sub>	Ph	*
E14	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	2-(3-Cl-piridinil)	H	249-245

\* Ver Tabla Índice Q para los datos de <sup>1</sup>H RMN

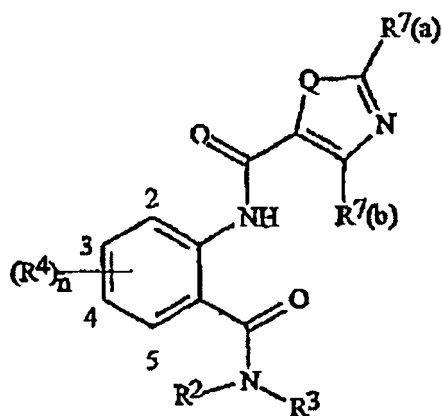
TABLA ÍNDICE F



ES 2 278 738 T3

Compuesto	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	(R <sup>4</sup> ) <sub>n</sub>	R <sup>7</sup> (a)	R <sup>7</sup> (b)	R <sup>7</sup> (c)	p.f. °C
F1	i-Pr	H	2-Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	H	254-255
F2	i-Pr	H	2-Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	200-205
F3	i-Pr	H	2-Me	CH <sub>2</sub> (3-CF <sub>3</sub> )Ph	H	CH <sub>3</sub>	212-215
F4	i-Pr	H	2-Cl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	CH <sub>3</sub>	215-217
F5	i-Pr	H	2-Me	Ph	H	CF <sub>3</sub>	223-224
F6	i-Pr	H	2-Cl	Ph	H	CF <sub>3</sub>	206-208
F7	i-Pr	H	2-Me	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	Ph	156-158
F8	i-Pr	H	2-Cl	CH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	H	Ph	162-164

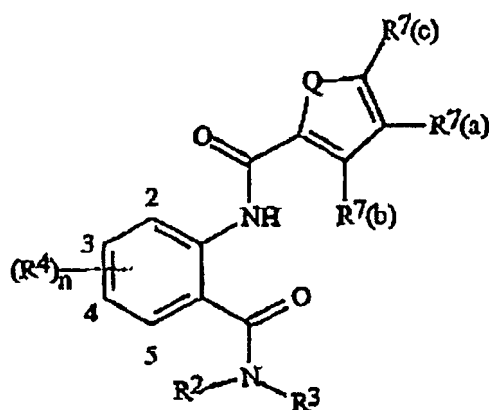
TABLA ÍNDICE G



Compuesto	Q	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	(R <sup>4</sup> ) <sub>n</sub>	R <sup>7</sup> (a)	R <sup>7</sup> (b)	p.f. °C
G1	S	i-Pr	H	2-Me	4-OCF <sub>3</sub> Ph	CH <sub>3</sub>	233-234
G2	S	i-Pr	H	2-Me	OCH <sub>2</sub> CF <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	CH <sub>3</sub>	170-173
G3	S	i-Pr	H	2-Me	Cl	CH <sub>3</sub>	164-167
G4	S	i-Pr	H	2-Me	CH <sub>3</sub>	Ph	216-219
G5	S	i-Pr	H	2-Me	C(CH <sub>3</sub> )OH	CH <sub>3</sub>	*
G6	S	i-Pr	H	2-Me	i-Pr	CH <sub>3</sub>	180-181
G7	S	i-Pr	H	2-Me	i-Pr	Ph	182-183
G8	O	i-Pr	H	2-Me	i-Pr	CH <sub>3</sub>	163-164

\* Ver Tabla Índice Q para los datos de <sup>1</sup>H RMN

TABLA ÍNDICE H

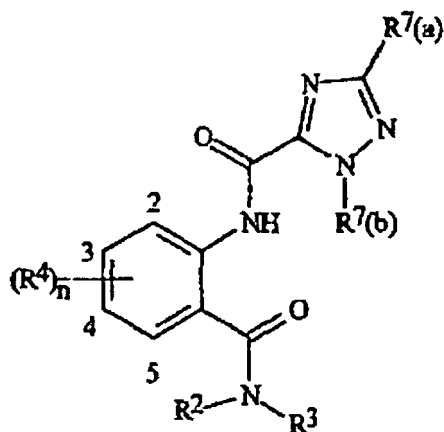


Compuesto	Q	R <sup>3</sup>	R <sup>2</sup>	(R <sup>4</sup> ) <sub>n</sub>	R <sup>7</sup> (a)	R <sup>7</sup> (b)	R <sup>7</sup> (c)	p.f. °C
H1	S	i-Pr	H	2-Me	H	H	H	192-195
H2	S	CH(CH <sub>3</sub> )CH <sub>2</sub> OCH <sub>3</sub>	H	2-Me	H	H	H	120-123
H3	S	t-Bu	H	2-Me	H	H	H	120-123
H4	NMe	i-Pr	H	2-Me	Me	H	H	193-195
H5	NPh	i-Pr	H	2-Me	H	Me	H	188-192
H6	NPh	i-Pr	H	2-Me	Br	H	H	176-179
H7	NPh	i-Pr	H	2-Me	Br	H	Br	215-216
H8	NPh	i-Pr	H	2-Me	H	H	Br	150-154
H9	NPh	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	H	H	182-184
H10	N(2-ClPh)	i-Pr	H	2-Me	Br	H	H	100-110
H11	N-(2-FPh)	i-Pr	H	2-Me	Br	H	H	178-179
H12	N-(2-FPh)	t-Bu	H	2-Me	Br	H	H	186-188
H13	N(2-ClPh)	t-Bu	H	2-Me	Br	H	H	225-229



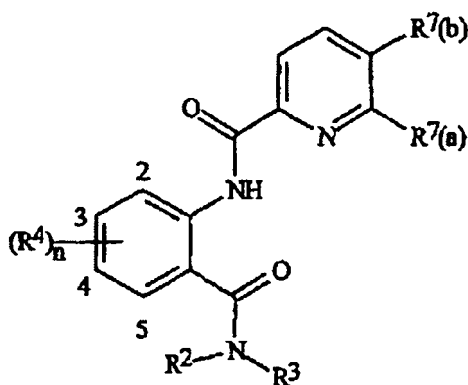
ES 2 278 738 T3

TABLA ÍNDICE J



Compuesto	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	(R <sup>4</sup> ) <sub>n</sub>	R <sup>7</sup> (a)	R <sup>7</sup> (b)	p.f. °C
J1	i-Pr	H	2-Me	Me	Me	221-222
J2	i-Pr	H	H	CF <sub>3</sub>	Ph	279-281
J3	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	Ph	263-268
J4	i-Pr	H	2-Cl	CF <sub>3</sub>	2-ClPh	235-238
J5	i-Pr	H	2-Cl	CF <sub>3</sub>	Ph	245-246
J6	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	2-ClPh	240-242
J7	i-Pr	H	2-Cl	CF <sub>3</sub>	2-F-4-ClPh	246-247
J8	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	2-F-4-ClPh	266-268
J9	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	2-piridinil	258-260

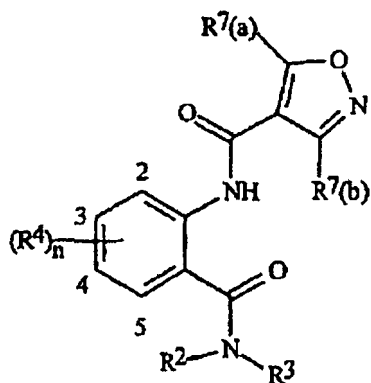
TABLA ÍNDICE K



Compuesto	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	(R <sup>4</sup> ) <sub>n</sub>	R <sup>7</sup> (a)	R <sup>7</sup> (b)	p.f. °C
K1	i-Pr	H	2-Me	Br	H	177-180
K2	t-Bu	H	2-Me	Br	H	188-194

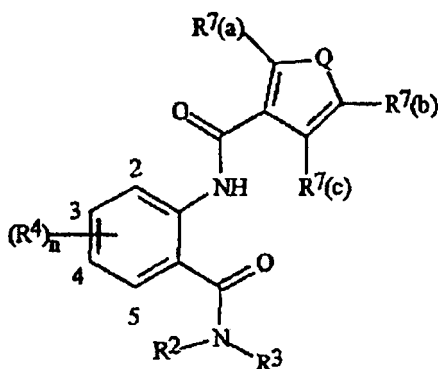
ES 2 278 738 T3

TABLA ÍNDICE L



Compuesto	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	(R <sup>4</sup> ) <sub>n</sub>	R <sup>7</sup> (a)	R <sup>7</sup> (b)	p.f. °C
L1	i-Pr	H	2-Me	Me	Me	203-205
L2	i-Pr	H	2-Me	Me	2,6-Cl <sub>2</sub> Ph	218-223

TABLA ÍNDICE M



Compuesto	Q	R <sup>2</sup>	R <sup>3</sup>	(R <sup>4</sup> ) <sub>n</sub>	R <sup>7</sup> (a)	R <sup>7</sup> (b)	R <sup>7</sup> (c)	p.f. °C
M1	S	i-Pr	H	2-Me	Cl	Me	H	203-205
M2	S	i-Pr	H	2-Cl	Cl	Me	H	210-213
M3	MCHF <sub>2</sub>	i-Pr	H	2-Me	H	H	Ph	165-166
M4	NH	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	Ph	H	118-120
M5	NMe	i-Pr	H	2-Me	CF <sub>3</sub>	Ph	H	110-112
M6	NHCF <sub>2</sub>	i-Pr	H	2-Me	2-FPh	H	H	143-144
M7	NHCF <sub>2</sub>	i-Pr	H	2-Me	2-FPh	H	H	120-123
M8	NCH <sub>2</sub> CF <sub>3</sub>	i-Pr	H	2-Me	2-FPh	H	H	235-237

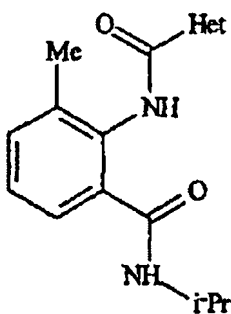
ES 2 278 738 T3

TABLA ÍNDICE N

5

10

15



20

25

30

35

40

45

50

55

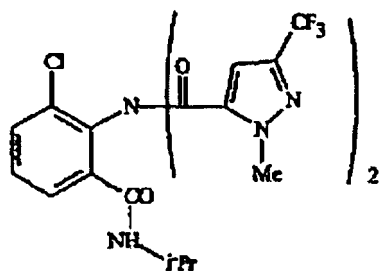
60

65

Compuesto	Het	p.f. °C
N1		169-171
N2		227-230
N3		243-246

## ES 2 278 738 T3

TABLA ÍNDICE P



Compuesto	Het	p.f. °C
P1		178-179

TABLA ÍNDICE Q

Nº Comp.	Datos <sup>1</sup> H RMN (solución de CDCl <sub>3</sub> a menos que se indique de otra forma) <sup>a</sup>
D194	(DMSO-d <sub>6</sub> ) δ 1.03 (d, 6H), 2.18 (s, 3H), 3.92 (m, 1H), 7.22-7.30 (m, 2H), 7.35 (m, 1H), 7.62 (dd, 1H), 7.81 (s, 1H), 8.02 (d, 1H), 8.15 (dd, 1H), 8.55 (dd, 1H), 10.34 (s, 1H).
D227	(DMSO-d <sub>6</sub> ) δ 1.01 (d, 6H), 2.16 (s, 3H), 3.92 (m, 1H), 7.27 (m, 2H), 7.35 (m, 1H), 7.89 (s, 1H), 7.96 (m, 1H), 8.37 (s, 2H), 10.42 (s, 1H).
G5	δ 1.22 (d, 6H), 2.05 (s, 6H), 2.31 (s, 3H), 2.76 (s, 3H), 4.18 (m, 1H), 5.94 (d, 1H), 7.20 (dd, 1H), 7.29 (d, 1H), 7.38 (d, 1H), 9.83 (br s, 1H).
E13	δ 1.12 (d, 6H), 2.32 (s, 1H), 4.14 (m, 1H), 4.95 (d, 1H), 7.19 (dd, 1H), 7.28 (t, 1H), 7.32 (m, 5H), 7.59 (dd, 2H), 7.92 (s, 1H), 9.51 (br s, 1H).

<sup>a</sup> Los datos de RMN se dan en en ppm de desplazamiento a campo más bajo respecto al tetrametilsilano. Los acoplamientos se designan como (s)-singulete, (d)-doblete, (t)-triplete, (q)-cuadruplete, (m)-multiplete, (dd)-doblete de dobles, (dt)-doblete de tripletes, (br s)-singulete ancho

**Ejemplos biológicos de la invención***Prueba*

5 Aplicación: Los compuestos se formulan en una solución de 10% de acetona, 90% de agua y 300 ppm de solución surfactante X-77, a menos que se indique de otra forma. Los compuestos formulados se aplican con una boquilla atomizadora SUJ2 con una boquilla a medida 1/8 JJ (Spraying Systems) colocada 1/2 por encima de la parte superior de cada unidad de prueba. Hay 6 de estas boquillas que constituyen la barra de pulverización, y ésta está fijada a la cinta de pulverización. Se coloca una rejilla (o transportador) de 6 unidades de prueba de insectos distintas sobre la  
10 cinta transportadora y se detiene de forma que cada unidad está centrada bajo una boquilla. Una vez que la rejilla está centrada, se pulveriza 1 mL de líquido sobre cada unidad de prueba; a continuación la rejilla continúa por la cinta hasta el final del pulverizador para ser descargada. Todos los compuestos experimentales en este ensayo se pulverizan a 250 ppm y se repiten tres veces.

15 Polilla del repollo (DBM) - *Plutella Xylostella*: La unidad de prueba consiste en una pequeña unidad autónoma con una planta de rábano de 12-14 días de edad en su interior. Estas plantas están pre-infestadas (utilizando un tomador de muestras) con 10-15 larvas neonatas sobre una porción de dieta para insectos. Una vez se ha pulverizado una cantidad de 1 mL del compuesto formulado en cada unidad de prueba, las unidades de prueba se dejan secar durante 1 hora antes de colocar una tapa de rejilla negra sobre cada cilindro. Se dejan reposar durante 6 días en una cámara de crecimiento a 25°C y un 70% de humedad relativa.

El daño a la planta causado por los insectos alimentándose de ella se evaluó visualmente utilizando una escala del 0-10 donde 0 indica que no ha habido daño por alimentación, 1 es un 10% o menos de daño por alimentación, 2 es un 20% o menos de daño por alimentación, 3 es un 30% o menos de daño por alimentación hasta un valor máximo de  
25 10, donde 10 representa un 100% de follaje consumido. De los compuestos provados, los siguientes proporcionaron excelentes niveles de protección de la planta (valores de 0-1, un 10% o menos de daño por alimentación): 1, 2, 3, 4, 6, 7, 9, 10, 13, 14, 15, 19, 20, 24, 27, 28, 29, 30, 31, 32, 33,35, 37, 38, 39, 51, 52, 53, 60, 61, 62, 63, 64, 65, 66, 68, 69, 72, 73, 74, 75, 76, 79, 80, 84, 86, 88, 89, 90, 92, 96, 97, 98, 99, 100,101, 102, 103, 107, 113, 124, 126,127, 143, 144, 146,1 47, 148,150, 151, 152, 153, 158, 159, 160, 161, 162, 163, 164, 165, 166, 167, 169, 170, 171, 174, 183, 184,  
30 185, 186, 187, 188, 189, 190, 191, 193, 194, 195, 196, 198, 202, 203, 204, 205, 206, 207, 208, 209, 210, 211, 212, 213, 214, 215, 216, 217, 218, 219, 220, 222, 223, 225, 227, 228, 229, 230, 231, 232, 233, 235, 238, 239, 240, 244, 245, 246, 248, 249, 250, 251, 252, 253, 256, 257, 275, 276, 277, 278, B2, B4, B5, B6, B7, B8, B9, B10, B11, B12, B13, B14, B15, B16, B17, B18, B19, B20, B21, B23, B24, B25, B28, B29, B30, B31, B32, B33, B35, B37, B38, B39, B40, B42, B43, B44, B45, B46, B47, B48, B49, B50, B53, B55, B57, B58, B59, B60, B61, B62, B63, B64, B66, B67,  
35 B68, B69, B70, B71, B72, B74, B75, B76, C1, C2, C3, C4, C5, C7, C8, C9, C10, C11, C12, C79, D2, D3, D4, D5, D6, D7, D8, D11, D12, D13, D14, D15, D16, D18, D19, D20, D23, D24, D25, D26, D27, D28, D29, D30, D32, D33, D34, D37, D38, D39, D40, D41, D42, D45, D46, D47, D48, D50, D51, D52, D53, D54, D55, D56, D57, D58, D59, D60, D61, D62, D63, D64, D65, D66, D67, D68, D69, D70, D71, D72, D73, D74, D75, D76, D77, D78, D79, D81, D83, D84, D85, D86, D87, D88, D89, D91, D92, D93, D94, D95, D96, D97, D111, D113, D114, D115, D116, D117,  
40 D118, D119, D120, D121, D122, D123, D124, D125, D126, D162, D164, E4, F2, F5, F6, F7, F8, G2, G3, G5, H1, H2, H3, H4, J3, J4, J6, M1, M3, N2 y P1.

45

50

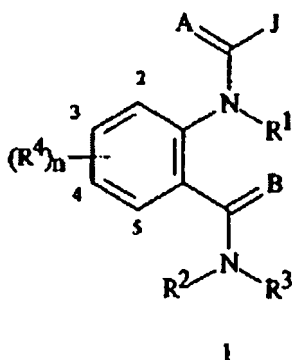
55

60

65

## REIVINDICACIONES

1. Un método para el control de artrópodos que comprende la puesta en contacto de los artrópodos o su entorno con una cantidad con eficacia artropodocida de un compuesto de Fórmula 1, su N-óxidos o sus sales apropiadas para su uso en agricultura.



donde

A y B son de forma independiente O o S;

cada J es de forma independiente un grupo fenilo o naftilo sustituido con de 1 a 2 R<sup>5</sup> y opcionalmente sustituido con de 1 a 3 R<sup>6</sup>;

o cada J es de forma independiente un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros o un sistema de anillos heterocíclicos fusionado de 8, 9 o 10 miembros donde cada anillo o sistema de anillos está opcionalmente sustituido con de 1 a 4 R<sup>7</sup>;

n es de 1 a 4;

R<sup>1</sup> es H; o alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquino C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> o cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> cada uno opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de entre el grupo formado por halógeno, CN, NO<sub>2</sub>, hidroxilo, alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfinilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, dialquilamino C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> y cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>; o

R<sup>1</sup> es alquilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquilaminocarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, dialquilaminocarbonilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> o C (=A) J;

R<sup>2</sup> es H, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquino C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, dialquilamino C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>, cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> o alquilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>;

R<sup>3</sup> es H; G; alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquino C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, cada uno opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de entre el grupo formado por halógeno, G, CN, NO<sub>2</sub>, hidroxilo, alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfinilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, trialquilsililo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, o a fenilo, fenoxilo o anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, cada anillo opcionalmente sustituido con de uno a tres sustituyentes seleccionados de forma independiente de entre el grupo formado por alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alquino C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalqueno C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquino C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, halocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, halógeno, CN, NO<sub>2</sub>, alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfinilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, dialquilamino C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>, cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, (alquil) cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alquilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquilaminocarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, dialquilaminocarbonilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> y trialquilsililo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>; alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>; alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>; dialquilamino C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>; cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>; C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alcoxilcarbonilo o alquilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>; o

R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> se pueden tomar conjuntamente con el nitrógeno al cual están unidos para formar un anillo que contiene de 2 a 6 átomos de carbono y opcionalmente un átomo adicional de nitrógeno, azufre o oxígeno, dicho anillo puede estar opcionalmente sustituido con de 1 a 4 sustituyentes seleccionados de entre el grupo formado por alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>, halógeno, CN, NO<sub>2</sub> y alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>;

G es un anillo carbocíclico o heterocíclico no aromático de 5 o 6 miembros, opcionalmente incluyendo uno o dos miembros de anillos seleccionados de entre el grupo formado por C (=O), SO o S(O)<sub>2</sub> y opcionalmente sustituido con de 1 a 4 sustituyentes seleccionados de entre el grupo formado por alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>, halógeno, CN, NO<sub>2</sub> y alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>;

## ES 2 278 738 T3

cada R<sup>4</sup> es de forma independiente H, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquino C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquino C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, halocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, halógeno, CN, NO<sub>2</sub>, hidroxilo, alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfinilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilsulfinilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, dialquilamino C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>, cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, o trialquilsililo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>;

o

cada R<sup>4</sup> es de forma independiente fenilo, bencilo o fenoxilo, cada uno opcionalmente sustituido con alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alquino C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalqueno C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquino C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, halocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, halógeno, CN, NO<sub>2</sub>, alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfinilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, dialquilamino C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>, cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, (alquil)cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alquilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquilaminocarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, dialquilaminocarbonilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> o trialquilsililo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>;

cada R<sup>5</sup> es de forma independiente haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquino C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, halocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, CN, NO<sub>2</sub>, haloalcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, tioalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilsulfinilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, dialquilamino C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>, o cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alquilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquilaminocarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, o dialquilaminocarbonilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>; o

(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub> cuando están unidos a átomos de carbono adyacentes se pueden tomar conjuntamente como -OCF<sub>2</sub>O-, -CF<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>O-, o -OCF<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>O-;

cada R<sup>6</sup> es de forma independiente H, halógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquino C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o alcoxilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>; o

cada R<sup>6</sup> es de forma independiente fenilo, bencilo, fenoxilo, anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros o un sistema heterobíciclico fusionado de 8, 9 o 10 miembros aromático, cada anillo opcionalmente sustituido con de uno a tres sustituyentes seleccionados de forma independiente de entre el grupo formado por alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alquino C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalqueno C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquino C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, halocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, halógeno, CN, NO<sub>2</sub>, alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfinilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, dialquilamino C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>, cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, (alquil)cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alquilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquilaminocarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, dialquilaminocarbonilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> y trialquilsililo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>;

cada R<sup>7</sup> es de forma independiente H, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquino C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquino C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, halocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, halógeno, CN, CO<sub>2</sub>H, CONH<sub>2</sub>, NO<sub>2</sub>, hidroxilo, alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfinilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilsulfinilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, dialquilamino C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>, cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alquilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquilaminocarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, dialquilaminocarbonilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, o trialquilsililo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>;

o cada R<sup>7</sup> es de forma independiente fenilo, bencilo, benzoilo, fenoxilo, anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros o un sistema heterobíciclico fusionado de 8, 9 o 10 miembros aromático, cada anillo opcionalmente sustituido con de uno a tres sustituyentes seleccionados de forma independiente de entre el grupo formado por alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alquino C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalqueno C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquino C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, halocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, halógeno, CN, NO<sub>2</sub>, alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfinilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, dialquilamino C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>, cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, (alquil)cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alquilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquilaminocarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, dialquilaminocarbonilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> o trialquilsililo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>;

mientras que

J es distinto de un 1, 2, 3-tiadiazol opcionalmente sustituido.

2. El método de la Reivindicación 1 donde J es un grupo fenilo sustituido con de 1 a 2 R<sup>5</sup> y opcionalmente sustituido con de 1 a 3 R<sup>6</sup>.

3. El método de la Reivindicación 2 donde

A y B son ambos O;

n es de 1 a 2;

R<sup>1</sup> es H; o alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alquino C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alquilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> o alcoxilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>;

R<sup>2</sup> es H, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alquino C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alquilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> o alcoxilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>;

## ES 2 278 738 T3

R<sup>3</sup> es alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquino C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> o cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, cada uno opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de entre el grupo formado por halógeno, CN, alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>, alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>, alquilsulfinilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> y alquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>;

5 uno de los grupos R<sup>4</sup> está unido al anillo fenilo en la posición 2 o en la posición 5, y dicho R<sup>4</sup> es alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, halógeno, CN, NO<sub>2</sub>, alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfinilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilsulfinilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, o haloalquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>;

10 cada R<sup>5</sup> es de forma independiente haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, CN, NO<sub>2</sub>, haloalcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfinilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilsulfinilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o alcocarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>; o

15 (R<sup>5</sup>)<sub>2</sub> cuando están unidos a átomos de carbono adyacentes se pueden tomar conjuntamente como -OCF<sub>2</sub>O-, -CF<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>O-, o -OCF<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>O-;

20 cada R<sup>6</sup> es de forma independiente H, halógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> o alcocarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>; o

25 cada R<sup>6</sup> es de forma independiente fenilo o un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, cada anillo opcionalmente sustituido con alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alquino C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalqueno C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquino C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, halocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, halógeno, CN, NO<sub>2</sub>, alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfinilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, dialquilamino C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>, cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, (alquil)cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alquilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alcocarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquilaminocarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, dialquilaminocarbonilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> y trialquilsililo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>.

30 4. El método de la Reivindicación 3 donde

R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> son ambos H;

R<sup>3</sup> es alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, opcionalmente sustituido con halógeno, CN, OCH<sub>3</sub>, o S(O)pCH<sub>3</sub>;

35 cada R<sup>4</sup> es de forma independiente H, CH<sub>3</sub>, CF<sub>3</sub>, OCF<sub>3</sub>, OCHF<sub>2</sub>, S(O)pCF<sub>3</sub>, S(O)pCHF<sub>2</sub>, CN o halógeno;

40 cada R<sup>5</sup> es de forma independiente CF<sub>3</sub>, OCF<sub>3</sub>, OCHF<sub>2</sub>, S(O)pCF<sub>3</sub>, S(O)pCHF<sub>2</sub>, OCH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, OCF<sub>2</sub>CHF<sub>2</sub>, S(O)pCH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub> o S(O)pCF<sub>2</sub>CHF<sub>2</sub>;

45 cada R<sup>6</sup> es de forma independiente H, halógeno o metilo; o fenilo, pirazol, imidazol, triazol, piridina o pirimidina, estando cada anillo sustituido opcionalmente con alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, halógeno o CN; y

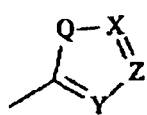
p es 0, 1 o 2.

50 5. El método de la Reivindicación 4 donde R<sup>3</sup> es i-propilo o t-butilo.

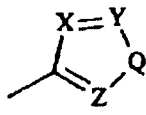
55 6. El método de la Reivindicación 1 donde J es un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros sustituido opcionalmente con de 1 a 4 R<sup>7</sup>.

60 7. El método de la Reivindicación 6 donde

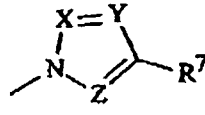
65 J es un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros seleccionado de entre el grupo consistente en J-1, J-2, J-3, J-4 y J-5, estando cada J opcionalmente sustituido con de 1 a 3 R<sup>7</sup>



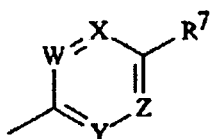
J-1



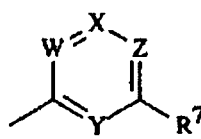
J-2



J-3



J-4



J-5

;



## ES 2 278 738 T3

Q es O, S o NR<sup>7</sup>; y

W, X, Y y Z son de forma independiente N o CR<sup>7</sup>, mientras que en J-4 y J-5 al menos uno de entre W, X, Y y Z sea N.

8. El método de las Reivindicaciones 6 o 7 donde

A y B son O;

n es de 1 a 2;

R<sup>1</sup> es H; o alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alquilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> o alcoxilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>;

R<sup>2</sup> es H, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alquilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> o alcoxicarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>;

R<sup>3</sup> es alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> o cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, cada uno opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de entre el grupo formado por halógeno, CN, alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>, alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>, alquilsulfinilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> y alquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>;

uno de los grupos R<sup>4</sup> está unido al anillo fenilo en la posición 2, y dicho R<sup>4</sup> es alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, halógeno, CN, NO<sub>2</sub>, alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfinilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilsulfinilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, o haloalquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>; y

cada R<sup>7</sup> es de forma independiente H, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, halógeno, CN, NO<sub>2</sub>, alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfinilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilsulfinilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o alcoxicarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>; o un fenilo o un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, cada anillo opcionalmente sustituido con alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquenilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquinilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, halocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, halógeno, CN, NO<sub>2</sub>, alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfinilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, dialquilamino C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>, cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, (alquil)cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alquilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquilaminocarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, dialquilaminocarbonilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> y trialquilsililo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>.

9. El método de la Reivindicación 8 donde J se selecciona de entre el grupo consistente en piridina, pirimidina, pirazol, imidazol, triazol, tiofeno, tiazol y oxazol, furano, isotiazol e isoxazol, cada uno opcionalmente sustituido con de 1 a 3 R<sup>7</sup>.

10. El método de la Reivindicación 9 donde

J se selecciona de entre el grupo consistente en piridina, pirimidina, pirazol, tiofeno y tiazol, cada uno opcionalmente sustituido con de 1 a 3 R<sup>7</sup>;

R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> son ambos H;

R<sup>3</sup> es alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> opcionalmente sustituido con halógeno, CN, OCH<sub>3</sub>, o S(O)pCH<sub>3</sub>;

cada R<sup>4</sup> es de forma independiente H, CH<sub>3</sub>, CF<sub>3</sub>, OCF<sub>3</sub>, OCHF<sub>2</sub>, S(O)pCF<sub>3</sub>, S(O)pCHF<sub>2</sub>, CN o halógeno;

cada R<sup>7</sup> es de forma independiente H, halógeno, CH<sub>3</sub>, CF<sub>3</sub>, OCF<sub>3</sub>, OCHF<sub>2</sub>, S(O)pCF<sub>3</sub>, S(O)pCHF<sub>2</sub>, OCH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, OCF<sub>2</sub>CHF<sub>2</sub>, S(O)pCH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub> o S(O)pCF<sub>2</sub>CHF<sub>2</sub>; o fenilo, pirazol, imidazol, triazol, piridina o pirimidina, estando cada anillo sustituido opcionalmente con alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfinilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, halógeno o CN; y

p es 0, 1 o 2.

11. El método de la Reivindicación 10 donde J es una piridina opcionalmente sustituida con de 1 a 3 R<sup>7</sup>.

12. El método de la Reivindicación 11 donde un R<sup>7</sup> es un fenilo opcionalmente sustituido con alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, halógeno o CN.

13. El método de la Reivindicación 11 donde un R<sup>7</sup> es pirazol, imidazol, triazol, piridina o pirimidina, estando cada anillo sustituido con alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, halógeno o CN.

14. El método de la Reivindicación 10 donde J es una pirimidina opcionalmente sustituida con de 1 a 3 R<sup>7</sup>.

15. El método de la Reivindicación 14 donde un R<sup>7</sup> es un fenilo opcionalmente sustituido con alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, halógeno o CN.

## ES 2 278 738 T3

16. El método de la Reivindicación 14 donde un  $R^7$  es pirazol, imidazol, triazol, piridina o pirimidina, estando cada anillo sustituido con alquilo  $C_1-C_4$ , haloalquilo  $C_1-C_4$ , halógeno o CN.

17. El método de la Reivindicación 10 donde J es un pirazol opcionalmente sustituida con de 1 a 3  $R^7$ .

18. El método de la Reivindicación 17 donde un  $R^7$  es un fenilo opcionalmente sustituido con alquilo  $C_1-C_4$ , haloalquilo  $C_1-C_4$ , halógeno o CN.

19. El método de la Reivindicación 17 donde un  $R^7$  es pirazol, imidazol, triazol, piridina o pirimidina, estando cada anillo sustituido con alquilo  $C_1-C_4$ , haloalquilo  $C_1-C_4$ , halógeno o CN.

20. El método de la Reivindicación 19 donde  $R^7$  es una piridina opcionalmente sustituida con alquilo  $C_1-C_4$ , haloalquilo  $C_1-C_4$ , halógeno o CN.

21. El método de la Reivindicación 1 que comprende un compuesto de Fórmula I seleccionado de entre el grupo consistente en:

3-metil-N-(1-metiletil)-2-[[4-(trifluorometil)benzoil]amino]-benzamida,

2-metil-N-(2-metil-6-[[1-metiletil]amino]carbonil]fenil)-4-(trifluorometil)benzamida,

2-metil-N-[2-metil-6-[[1-metiletil]amino]carbonil]fenil]-6-(trifluorometil)-3-piridincarboximida,

1-etil-N-[2-metil-6-[[1-metiletil]amino]carbonil]fenil]-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-carboximida,

1-(2-fluorofenil)-N-[2-metil-6-[[1-metiletil]amino]carbonil]fenil]-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-carboximida,

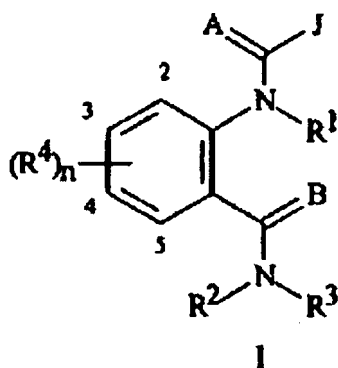
1-(3-cloro-2-piridinil)-N-[2-metil-6-[[1-metiletil]amino]carbonil]fenil]-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-carboximida,

N-[2-cloro-6-[[1-metiletil]amino]carbonil]fenil]-3-(trifluorometil)-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-carboximida,

3-bromo-1-(2-clorofenil)-N-[2-metil-6-[[1-metiletil]amino]carbonil]fenil]-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-carboximida, y

3-bromo-N-[2-cloro-6-[[1-metiletil]amino]carbonil]fenil]-1-(2-clorofenil)-1H-pirazol-5-carboximida.

22. Un compuesto de Fórmula I, sus N-óxidos y sales apropiadas para el uso agrícola



donde

A y B son de forma independiente O o S;

cada J es de forma independiente un grupo fenilo o naftilo sustituido con de 1 a 2  $R^5$  y opcionalmente sustituido con de 1 a 3  $R^6$ ;

o cada J es de forma independiente un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros o un sistema de anillos heterocíclicos fusionado de 8, 9 o 10 miembros donde cada anillo o sistema de anillos está opcionalmente sustituido con de 1 a 4  $R^7$ ;

n es de 1 a 4;

## ES 2 278 738 T3

R<sup>1</sup> es H; o alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquino C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> o cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> cada uno opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de entre el grupo formado por halógeno, CN, NO<sub>2</sub>, hidroxilo, alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, dialquilamino C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub> y cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>; o

5

R<sup>1</sup> es alquilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquilaminocarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, dialquilaminocarbonilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> o C (=A) J;

R<sup>2</sup> es H, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquino C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, dialquilamino C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>, cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> o alquilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>;

10

R<sup>3</sup> es H; alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquino C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, cada uno opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de entre el grupo formado por halógeno, G, CN, NO<sub>2</sub>, hidroxilo, alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, trialquilsililo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub> o anillo fenoxilo opcionalmente sustituido con de uno a tres sustituyentes seleccionados de forma independiente de entre el grupo formado por alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alquino C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalqueno C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquino C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, halocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, halógeno, CN, NO<sub>2</sub>, alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, dialquilamino C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>, cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, (alquil) cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alquilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquilaminocarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, dialquilaminocarbonilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> y trialquilsililo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>; alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>; alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>; dialquilamino C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>; cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>; C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> alcoxilcarbonilo o alquilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>; o

15

20

R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> se pueden tomar conjuntamente con el nitrógeno al cual están unidos para formar un anillo que contiene de 2 a 6 átomos de carbono y opcionalmente un átomo adicional de nitrógeno, azufre o oxígeno, dicho anillo puede estar opcionalmente sustituido con de 1 a 4 sustituyentes seleccionados de entre el grupo formado por alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>, halógeno, CN, NO<sub>2</sub> y alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>;

25

cada R<sup>4</sup> es de forma independiente H, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquino C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquino C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, halocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, halógeno, CN, NO<sub>2</sub>, hidroxilo, alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilsulfino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, dialquilamino C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>, cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, o trialquilsililo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>;

30

o

35

cada R<sup>4</sup> es de forma independiente fenilo, bencilo o fenoxilo, cada uno opcionalmente sustituido con alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alquino C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalqueno C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquino C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, halocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, halógeno, CN, NO<sub>2</sub>, alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, dialquilamino C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>, cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, (alquil)cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alquilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquilaminocarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, dialquilaminocarbonilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> o trialquilsililo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>;

40

cada R<sup>5</sup> es de forma independiente haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquino C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, halocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, CN, NO<sub>2</sub>, haloalcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, tialquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilsulfino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, dialquilamino C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>, o cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alquilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquilaminocarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, o dialquilaminocarbonilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>; o

45

(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub> cuando están unidos a átomos de carbono adyacentes se pueden tomar conjuntamente como -OCF<sub>2</sub>O-, -CF<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>O-, o -OCF<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>O-;

50

cada R<sup>6</sup> es de forma independiente H, halógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquino C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o alcoxilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>; o

cada R<sup>6</sup> es de forma independiente fenilo, bencilo, fenoxilo, anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros o un sistema heterobíciclico fusionado de 8, 9 o 10 miembros aromático, cada anillo opcionalmente sustituido con de uno a tres sustituyentes seleccionados de forma independiente de entre el grupo formado por alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alquino C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalqueno C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquino C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, halocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, halógeno, CN, NO<sub>2</sub>, alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, dialquilamino C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>, cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, (alquil)cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alquilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquilaminocarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, dialquilaminocarbonilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> y trialquilsililo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>;

55

60

cada R<sup>7</sup> es de forma independiente H, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquino C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, haloalqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquino C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, halocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, halógeno, CN, CO<sub>2</sub>H, CONH<sub>2</sub>, NO<sub>2</sub>, hidroxilo, alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilsulfino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, dialquilamino C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>, cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alquilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alcoxilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquilaminocarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, dialquilaminocarbonilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>, trialquilsililo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>;

65

## ES 2 278 738 T3

o cada R<sup>7</sup> es de forma independiente fenilo, bencilo, benzoilo, fenoxilo, anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros o un sistema heterobicclico fusionado de 8, 9 o 10 miembros aromático, cada anillo opcionalmente sustituido con de uno a tres sustituyentes seleccionados de forma independiente de entre el grupo formado por alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alquino C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalqueno C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquino C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, halocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, halógeno, CN, NO<sub>2</sub>, alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfinilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, dialquilamino C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>, cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, (alquil)cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alquilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquilaminocarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, dialquilaminocarbonilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> o trialquilsililo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>;

10 mientras que

(i) al menos un R<sup>4</sup> y al menos un R<sup>7</sup> sean distintos de H;

(ii) J sea distinto de un 1,2,3-tiadizaol opcionalmente sustituido;

15 (iii) cuando J sea una piridina opcionalmente sustituida y R<sup>2</sup> sea H, R<sup>3</sup> sea distinto de H o CH<sub>3</sub>;

(iv) cuando J sea una piridina opcionalmente sustituida, entonces R<sup>7</sup> no puede ser CONH<sub>2</sub>, alquilaminocarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> o dialquilaminocarbonilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub>;

20 (v) cuando J sea un pirazol, tetrazol o pirimidina opcionalmente sustituido, entonces R<sup>2</sup> y R<sup>3</sup> no pueden ser ambos hidrógeno.

23. El compuesto de la Reivindicación 22 donde J es un grupo fenilo sustituido con de 1 a 2 R<sup>5</sup> y opcionalmente sustituido con de 1 a 3 R<sup>6</sup>.

24. El compuesto de la Reivindicación 23 donde

A y B son ambos O;

30 n es de 1 a 2;

R<sup>1</sup> es H; o alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alquino C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alquilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> o alcoxilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>;

35 R<sup>2</sup> es H, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alquino C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alquilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> o alcoxilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>;

40 R<sup>3</sup> es alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub>, alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquino C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub> o cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, cada uno opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de entre el grupo formado por halógeno, CN, alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>, alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>, alquilsulfinilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> y alquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub>;

45 uno de los grupos R<sup>4</sup> está unido al anillo fenilo en la posición 2 o en la posición 5, y dicho R<sup>4</sup> es alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, halógeno, CN, NO<sub>2</sub>, alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfinilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilsulfinilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, o haloalquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>;

50 cada R<sup>5</sup> es de forma independiente haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, CN, NO<sub>2</sub>, haloalcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfinilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilsulfinilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> o alcoxilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>; o

(R<sup>5</sup>)<sub>2</sub> cuando están unidos a átomos de carbono adyacentes se pueden tomar conjuntamente como -OCF<sub>2</sub>O-, -CF<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>O-, o -OCF<sub>2</sub>CF<sub>2</sub>O-;

55 cada R<sup>6</sup> es de forma independiente H, halógeno, alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>2</sub> o alcoxilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>; o

60 cada R<sup>6</sup> es de forma independiente fenilo o un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, cada anillo opcionalmente sustituido con alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alquino C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalqueno C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquino C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, halocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, halógeno, CN, NO<sub>2</sub>, alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfinilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, dialquilamino C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>, cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, (alquil)cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alquilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquilaminocarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, dialquilaminocarbonilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> y trialquilsililo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>.

25. El compuesto de la Reivindicación 24 donde

65 R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> son ambos H;

R<sup>3</sup> es alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, opcionalmente sustituido con halógeno, CN, OCH<sub>3</sub>, o S(O)pCH<sub>3</sub>;

## ES 2 278 738 T3

cada  $R^4$  es de forma independiente H,  $CH_3$ ,  $CF_3$ ,  $OCF_3$ ,  $OCHF_2$ ,  $S(O)pCF_3$ ,  $S(O)pCHF_2$ , CN o halógeno;

cada  $R^5$  es de forma independiente  $CF_3$ ,  $OCF_3$ ,  $OCHF_2$ ,  $S(O)pCF_3$ ,  $S(O)pCHF_2$ ,  $OCH_2CF_3$ ,  $OCF_2CHF_2$ ,  $S(O)pCH_2CF_3$  o  $S(O)pCF_2CHF_2$ ;

cada  $R^6$  es de forma independiente H, halógeno o metilo; o fenilo, pirazol, imidazol, triazol, piridina o pirimidina, estando cada anillo sustituido opcionalmente con alquilo  $C_1-C_4$ , haloalquilo  $C_1-C_4$ , halógeno o CN; y

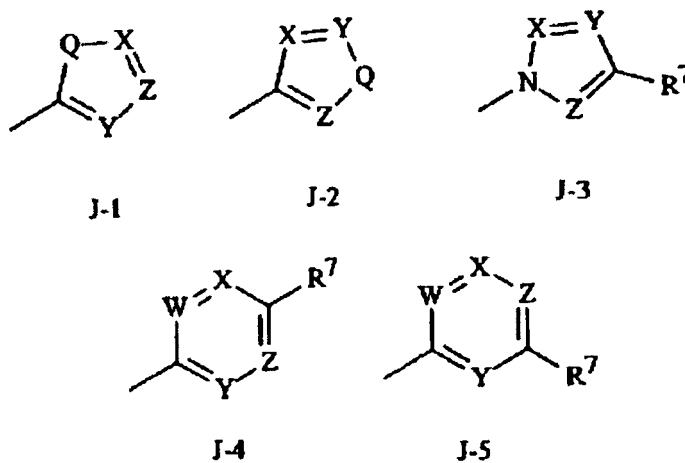
p es 0, 1 o 2.

26. El compuesto de la Reivindicación 25 donde  $R^3$  es i-propilo o t-butilo.

27. El compuesto de la Reivindicación 22 donde J es un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros sustituido opcionalmente con de 1 a 4  $R^7$ .

28. El compuesto de la Reivindicación 27 donde

J es un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros seleccionado de entre el grupo consistente en J-1, J-2, J-3, J-4 y J-5, estando cada J opcionalmente sustituido con de 1 a 3  $R^7$



Q es O, S o  $NR^7$ ; y

W, X, Y y Z son de forma independiente N o  $CR^7$ , mientras que en J-4 y J-5 al menos uno de entre W, X, Y y Z sea N.

29. El compuesto de las Reivindicaciones 27 o 28 donde

A y B son O;

n es de 1 a 2;

$R^1$  es H; o alquilo  $C_1-C_4$ , alqueno  $C_2-C_4$ , alquino  $C_2-C_4$ , alquilcarbonilo  $C_2-C_6$  o alcoxilcarbonilo  $C_2-C_6$ ;

$R^2$  es H, alquilo  $C_1-C_4$ , alqueno  $C_2-C_4$ , alquino  $C_2-C_4$ , cicloalquilo  $C_3-C_6$ , alquilcarbonilo  $C_2-C_6$  o alcoxilcarbonilo  $C_2-C_6$ ;

$R^3$  es H; o alquilo  $C_1-C_6$ , alqueno  $C_2-C_6$ , alquino  $C_2-C_6$  o cicloalquilo  $C_3-C_6$ , cada uno opcionalmente sustituido con uno o más sustituyentes seleccionados de entre el grupo formado por halógeno, CN, alcoxilo  $C_1-C_2$ , alquiltio  $C_1-C_2$ , alquilsulfinilo  $C_1-C_2$  y alquilsulfonilo  $C_1-C_2$ ;

uno de los grupos  $R^4$  está unido al anillo fenilo en la posición 2, y dicho  $R^4$  es alquilo  $C_1-C_4$ , haloalquilo  $C_1-C_4$ , halógeno, CN,  $NO_2$ , alcoxilo  $C_1-C_4$ , haloalcoxilo  $C_1-C_4$ , alquiltio  $C_1-C_4$ , alquilsulfinilo  $C_1-C_4$ , alquilsulfonilo  $C_1-C_4$ , haloalquiltio  $C_1-C_4$ , haloalquilsulfinilo  $C_1-C_4$ , o haloalquilsulfonilo  $C_1-C_4$ ; y

cada  $R^7$  es de forma independiente H, alquilo  $C_1-C_4$ , haloalquilo  $C_1-C_4$ , halógeno, CN,  $NO_2$ , alcoxilo  $C_1-C_4$ , haloalcoxilo  $C_1-C_4$ , alquiltio  $C_1-C_4$ , alquilsulfinilo  $C_1-C_4$ , alquilsulfonilo  $C_1-C_4$ , haloalquiltio  $C_1-C_4$ , haloalquilsulfinilo  $C_1-C_4$ , haloalquilsulfonilo  $C_1-C_4$  o alcoxilcarbonilo  $C_2-C_4$ ; o un fenilo o un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros

## ES 2 278 738 T3

bros, cada anillo opcionalmente sustituido con alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alqueno C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alquino C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, cicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalqueno C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquino C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, halocicloalquilo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, halógeno, CN, NO<sub>2</sub>, alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfinilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilamino C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, dialquilamino C<sub>2</sub>-C<sub>8</sub>, cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, (alquil)cicloalquilamino C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>, alquilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxilcarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, alquilaminocarbonilo C<sub>2</sub>-C<sub>6</sub>, dialquilaminocarbonilo C<sub>3</sub>-C<sub>8</sub> y trialquilsililo C<sub>3</sub>-C<sub>6</sub>.

30. El compuesto de la Reivindicación 29 donde J se selecciona de entre el grupo consistente en piridina, pirimidina, pirazol, imidazol, triazol, tiofeno, tiazol y oxazol, furano, isotiazol e isoxazol, cada uno opcionalmente sustituido con de 1 a 3 R<sup>7</sup>.

31. El compuesto de la Reivindicación 30 donde

J se selecciona de entre el grupo consistente en piridina, pirimidina, pirazol, tiofeno y tiazol, cada uno opcionalmente sustituido con de 1 a 3 R<sup>7</sup>;

R<sup>1</sup> y R<sup>2</sup> son ambos H;

R<sup>3</sup> es alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub> opcionalmente sustituido con halógeno, CN, OCH<sub>3</sub>, o S(O)pCH<sub>3</sub>;

cada R<sup>4</sup> es de forma independiente H, CH<sub>3</sub>, CF<sub>3</sub>, OCF<sub>3</sub>, OCHF<sub>2</sub>, S(O)pCF<sub>3</sub>, S(O)pCHF<sub>2</sub>, CN o halógeno;

cada R<sup>7</sup> es de forma independiente H, halógeno, CH<sub>3</sub>, CF<sub>3</sub>, OCF<sub>3</sub>, OCHF<sub>2</sub>, S(O)pCF<sub>3</sub>, S(O)pCHF<sub>2</sub>, OCH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub>, OCF<sub>2</sub>CHF<sub>2</sub>, S(O)pCH<sub>2</sub>CF<sub>3</sub> o S(O)pCF<sub>2</sub>CHF<sub>2</sub>; o fenilo, pirazol, imidazol, triazol, piridina o pirimidina, estando cada anillo sustituido opcionalmente con alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alcoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalxoxilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquiltio C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfinilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, alquilsulfonilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, halógeno o CN; y

p es 0, 1 o 2.

32. El compuesto de la Reivindicación 31 donde J es una piridina opcionalmente sustituida con de 1 a 3 R<sup>7</sup>.

33. El compuesto de la Reivindicación 32 donde un R<sup>7</sup> es un fenilo opcionalmente sustituido con alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, halógeno o CN.

34. El compuesto de la Reivindicación 32 donde un R<sup>7</sup> es pirazol, imidazol, triazol, piridina o pirimidina, estando cada anillo sustituido con alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, halógeno o CN.

35. El compuesto de la Reivindicación 31 donde J es una pirimidina opcionalmente sustituida con de 1 a 3 R<sup>7</sup>.

36. El compuesto de la Reivindicación 35 donde un R<sup>7</sup> es un fenilo opcionalmente sustituido con alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, halógeno o CN.

37. El compuesto de la Reivindicación 35 donde un R<sup>7</sup> es pirazol, imidazol, triazol, piridina o pirimidina, estando cada anillo sustituido con alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, halógeno o CN.

38. El compuesto de la Reivindicación 31 donde J es un pirazol opcionalmente sustituida con de 1 a 3 R<sup>7</sup>.

39. El compuesto de la Reivindicación 38 donde un R<sup>7</sup> es un fenilo opcionalmente sustituido con alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, halógeno o CN.

40. El compuesto de la Reivindicación 38 donde un R<sup>7</sup> es pirazol, imidazol, triazol, piridina o pirimidina, estando cada anillo sustituido con alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, halógeno o CN.

41. El compuesto de la Reivindicación 40 donde R<sup>7</sup> es una piridina opcionalmente sustituida con alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, haloalquilo C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>, halógeno o CN.

42. El compuesto de la Reivindicación 22 que comprende un compuesto de Fórmula I seleccionado de entre el grupo consistente en:

3-metil-N-(1-metiletil)-2-[[4-(trifluorometil)benzofl]amino]-benzamida,

2-metil-N-(2-metil-6-[[1-metiletil]amino]carbonil]fenil)-4-(trifluorometil)benzamida,

2-metil-N-[2-metil-6-[[1-metiletil]amino]carbonil]fenil]-6-(trifluorometil)-3-piridincarboximida,

1-etil-N-[2-metil-6-[[1-metiletil]amino]carbonil]fenil]-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-carboximida,

1-(2-fluorofenil)-N-[2-metil-6-[[1-metiletil]amino]carbonil]fenil]-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-carboximida,

## ES 2 278 738 T3

1-(3-cloro-2-piridinil)-N-[2-metil-6-[[1-(metiletil)amino]carbonil]fenil]-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-carboximida,

5 N-[2-cloro-6-[[1-(metiletil)amino]carbonil]fenil]-1-(3-cloro-2-piridinil)-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-carboximida,

3-bromo-1-(2-clorofenil)-N-[2-metil-6-[[1-(metiletil)amino]carbonil]fenil]-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-carboximida, y

10 3-bromo-N-[2-cloro-6-[[1-(metiletil)amino]carbonil]fenil]-1-(2-clorofenil)-1H-pirazol-5-carboximida.

43. Una composición artropodocida que contiene una cantidad con eficacia artropodocida de un compuesto de Fórmula I tal como se describe en cualquiera de las Reivindicaciones 22 a 42 y al menos un componente adicional seleccionado de entre el grupo consistente en surfactantes, diluyentes sólidos y diluyentes líquidos.

15

20

25

30

35

40

45

50

55

60

65