



**Industria y Comercio**

SUPERINTENDENCIA

OP

Delegatura de propiedad Industrial

División de Nuevas Creaciones

**PCT**  
SOLICITUD

**PATENTE DE INVENCION**

- PCT ENTRADA EN FASE NACIONAL -

21. EXPEDIENTE No.

**06.129099**

54. TÍTULO

☒ COMPUESTOS QUIMICOS

51. CLASIFICACIÓN INTERNACIONAL

71. SOLICITANTE

SYNGENTA PARTICIPATIONS AG

DOMICILIO

Schwarzwaldallee 215, CH-4058 Basilea - SUIZA

74. APODERADO

DRA. MARGARITA CASTELLANOS ABONDANO

22. BOGOTÁ, D. C.,

**26 DIC. 2006**

**FORMULARIO UNICO DE SOLICITUD DE PATENTE  
PCT  
ENTRADA EN FASE NACIONAL**

## SOLICITUD DE:

①

☒ Patente de Invención.☐ Patente de Modelo de Utilidad.☒ Capítulo I☐ Capítulo II

②

SOLICITANTE (71)

Nombre SYNGENTA PARTICIPATIONS AG

Dirección Schwarzwaldallee 215, CH-4058  
Basilea - SUIZA

Nacionalidad o Domicilio Basilea.- SUIZA

Lugar de Constitución Basilea - SUIZA

Teléfono Fax

E-mail

## IDENTIFICACIÓN

C C. ☐ NIT ☐C E ☐ Otro ☐

Cual

Número

③

REPRESENTANTE  
O APODERADO (74)

Nombre MARGARITA CASTELLANOS A.

Dirección CALLE 94A No. 7A-09

Teléfono 610 7420 Fax 610 0706

E-mail [info@castellanosyco.com](mailto:info@castellanosyco.com)

## IDENTIFICACIÓN

C C ☒ NIT ☐C E ☐ Otro ☐

Cual

Número 39'779.654 TPA 70.819

④

INVENTOR (ES) (72)

Nombre PETER MAIENFISCH, LOUIS-PIERRE MOLLEYRES, JEROME CASSAYRE,  
FREDRIK CEDER-BAUM, CAMILLA CORSI, THOMAS PITTERNA  
Dirección Syngenta Crop Protection AG, Werk Rosental, Schwarzwaldallee 215,  
CH-4058 Basilea, SUIZA

Nacionalidad o Domicilio SUIZA, SUIZA, FRANCESA, SUECA, ITALIANA, AUSTRIACA

⑤

PCT (86)

Solicitud Internacional No PCT/IB2005/002002 Fecha 22/06/2005

Publicación Internacional No. WO 2006/003494 Fecha 12/01/2006

⑥

Título (54) COMPUESTOS QUIMICOS

⑦

Clasificación Internacional (51) A01N 43/40, C07D 213/04, C07D 401/12, C07D 211/68, C07D 401/04, C07D 211/06  
C07D 401/14

⑧

Prioridad

(33) País de Origen

(32) Fecha

(31) Número de Solicitud

SI ☒ NO ☐

GB

28/08/2004

0414438.2

⑨

Comprobante de pago No. 06- 97,546

Fecha Diciembre 20, 2006

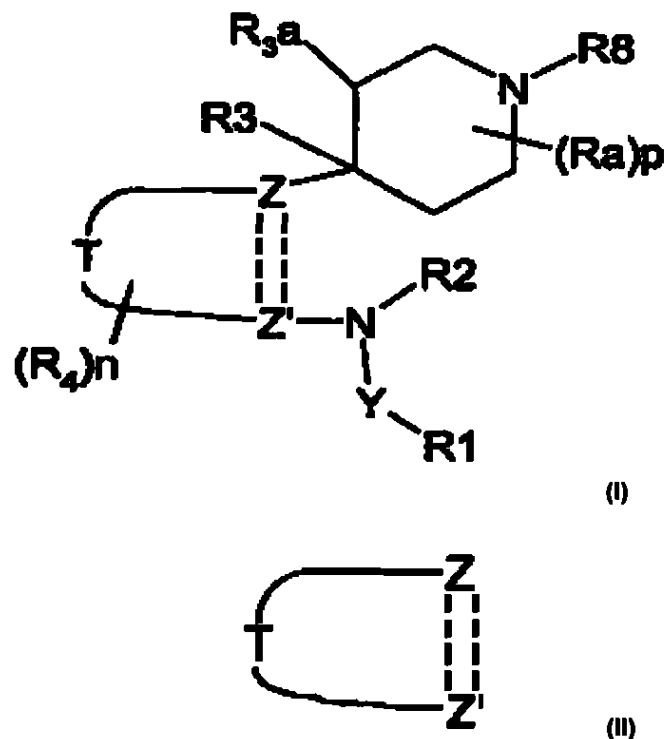
Instrucciones para el diligenciamiento del presente formulario, ver reverso de esta página

10

## Anexos

- ☒ Comprobante de pago de la tasa de presentación de la solicitud  
☒ Documento que acredite la existencia y representación legal cuando el solicitante sea persona jurídica  
☒ Poderes, si fuere el caso, junto con la sustitución del mismo a mi favor  
☐ Documento de cesión del inventor al solicitante o a su causante  
☐ Declaraciones  
☒ Copia de la solicitud internacional (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos)  
☒ Traducción de la solicitud internacional al castellano (Resumen, descripción, reivindicaciones, dibujos)  
☐ Copia del examen preliminar internacional efectuado por la Autoridad Internacional de Examen Preliminar (IPEA)  
☐ Traducción del examen preliminar internacional efectuado por la IPEA  
☐ De ser el caso, copia del contrato de acceso  
☐ De ser el caso, documento que acredite la licencia o autorización de uso de conocimientos tradicionales de las comunidades indígenas  
☐ De ser el caso, certificado de depósito del material biológico  
☒ Arte final 12x12  
☐ De ser el caso, información sobre otras solicitudes de patente o títulos obtenidos en el extranjero por el mismo titular o su causante, relacionadas parcial o totalmente con la invención de esta solicitud  
☐ De ser el caso, modificaciones efectuadas a la solicitud internacional  
☒ Otros Tarjeta de Propietario, Tarjeta Temática, Extracto para la publicación, disquet con el extracto para la publicación y Formato PCT/B/304

## 11 FIGURA CARACTERISTICA:



## 12 Solicito la concesión de la patente,

NOMBRE MARGARITA CASTELLANOS ABONDANO

FIRMA.

C.C No 39.779.654 Usaquén - TPA 70.819 C.S.J.

26 DIC. 2006

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO

NIT : 800176089-2

SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO  
Rad 06-129099- -00000-0000  
Fec: 2008-12-26 14:55:18 Dep. 2020 NUECREACIONE  
Tra 11 PATENTEYII  
Eve. 3/8 FASENACIONALI  
Act 411 PRESENTACION Folios 202

RECIBO OFICIAL DE CAJA : C6 - 97,546  
FECHA : DICIEMBRE 20 DE 2006

\*\*\*\*\* CONSIGNACION \*\*\*\*\*

| DEPOSITANTE        | TIPO PASO    | BANCO         | CUENTA      | No. PASO | FECHA PASO | Vr. PASO     |
|--------------------|--------------|---------------|-------------|----------|------------|--------------|
| ALVARO CASTELLANOS | CONSIGNACION | BANCO POPULAR | 050-00110-6 | 50962590 | 20/12/2006 | 2,063,000.00 |

\*\*\*\*\* CONCEPTO \*\*\*\*\*

| CANT. RENTISTICO          | CONCEPTO                            | TOTAL CONCEPTO |
|---------------------------|-------------------------------------|----------------|
| 1 50005-01-01 SOLICITUDES | 1 TRAMITES DE SOL. DE PATENTE DE IN | 463,000.00     |
|                           | TOTAL :                             | \$ 463,000.00  |

SOM: CUATROCIENTOS SESENTA Y TRES MIL PESOS

RESPONSABLE : \_\_\_\_\_

RECIBO DE CAJA APLICADO AL EXPEDIENTE No. \_\_\_\_\_

Señor

**Jefe de la División de Nuevas Creaciones**

**Superintendencia de Industria y Comercio**

**Ministerio de Comercio, Desarrollo, Industria y Turismo**

E. S. D

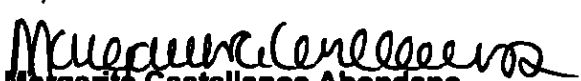
Ref.: **PODER** conferido por la sociedad **SYNGENTA PARTICIPATIONS AG**

Yo, **XIMENA CASTELLANOS ABONDANO**, mayor de edad, identificada y domiciliada como aparece al pie de mi firma, atentamente manifiesto a Uds. que sustituyo en la Dra **MARGARITA CASTELLANOS ABONDANO**, el poder que me confirió la sociedad **SYNGENTA PARTICIPATIONS AG**, con domicilio en **Schwarzwaldallee 215, CH-4058 Basilea, SUIZA**, debidamente legalizado por Apostilla, bajo el No. 8117 el día 1° de Abril de 2004, con las mismas facultades que me fueron conferidas, para tramitar la solicitud de Patente PCT Entrada en Fase Nacional, en Colombia, para. **"COMPUESTOS QUIMICOS"**.-

Del Señor Jefe,

**Acepto**

  
**Ximena Castellanos Abondano**  
C C No 39.773.330 de Usaquén  
T P A No. 58.236 del C S J.  
Calle 94 A No 7 A-09 – Bogotá, D C.  
PBX. 6107420

  
**Margarita Castellanos Abondano**  
C.C. No. 39.779.654 de Usaquén  
T.P.A. No 70.819 del C.S.J  
Calle 94 A No 7 A-09 – Bogotá, D.C  
PBX. 6107420

Bogotá, D.C.  
XCA/MCA/gcb/P1442

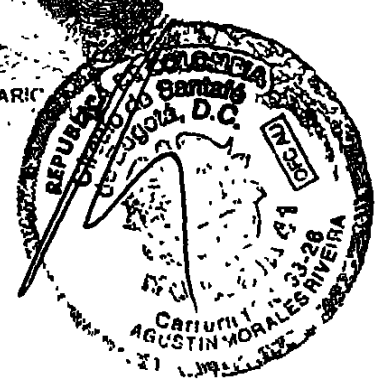
**AUTENTICACION DE FIRMA  
MEDIANTE COMPARECENCIA PERSONAL**  
(Art. 84 C.R.C. mod. Decr. 2282 de 1989, art. 1 mod. 36)

Antes, el Notario Cuarenta y Uno (41) del círculo de esta ciudad compareció personalmente:  
**Ximena Castellanos Lombardo**  
 identificado con C.C. **39 723 330**  
 expedida en: **Usaquen** y tarjeta profesional de abogado(a) No. **38 236** del Consejo Superior de la Judicatura, con documento dirigido a **Superintendencia y CIO**  
 y declaro que la firma puesta en este escrito es suya.

*Ximena Castellanos Lombardo*

Firma del declarante

En Bogotá D.C. a **20 DIC 2006**  
 AUTORIZO ESTA DILIGENCIA EL SUSCRITO NOTARIO



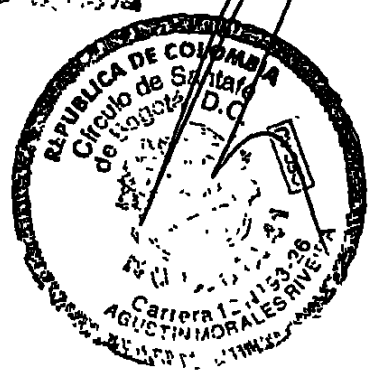
**AUTENTICACION DE FIRMA  
MEDIANTE COMPARECENCIA PERSONAL**  
(Art. 84 C.R.C. mod. Decr. 2282 de 1989, art. 1 mod. 36)

Antes, el Notario Cuarenta y Uno (41) del círculo de esta ciudad compareció personalmente:  
**Margarita Castellanos**  
 identificado con C.C. **39 729 654**  
 expedida en: **Usaquen** y tarjeta profesional de abogado(a) No. **70 819** del Consejo Superior de la Judicatura, con documento dirigido a **Superintendencia y CIO**  
 y declaro que la firma puesta en este escrito es suya.

*Margarita Castellanos*

Firma del declarante

En Bogotá D.C. a **20 DIC 2006**  
 AUTORIZO ESTA DILIGENCIA EL SUSCRITO NOTARIO



**PODER**

El (los) Gregory W. Warren  
SYNGENTA PARTICIPATIONS AG

Nombran por el presente a XIMENA CASTELLANOS A. y/o MARGARITA CASTELLANOS A. abogadas con oficinas en la Carrera 9 No 93-09, Bogotá-Colombia para

y para obtener la protección de mi (nuestra) propiedad Industrial y con este fin autorizamos a dichos apoderados para que nos representen ante cualesquiera autoridades o personas de los órdenes administrativo, contencioso-administrativo y judicial en todo lo relacionado con los siguientes actos y gestiones

a) Obtención de patentes de invención, modelos y dibujos industriales; registro de marcas de fábrica, de servicio, colectivas o defensivas y de denominaciones de origen, depósito de nombres y enseñas comerciales, su renovación, prórroga, inscripción de traspaso y cambio de nombre o domicilio, cancelación voluntaria y el registro de licencias de uso de esos derechos, b) Para la obtención de registros sanitarios; c) Acciones de oposición, observación, cancelación, nulidad, medidas cautelares y en general los juicios civiles, penales, administrativos o contencioso-administrativos que promovamos o se nos promuevan, pudiendo en todos los actos y gestiones arriba mencionados sustituir éste mandato, transigir, desistir, recibir, cancelar, renunciar, aceptar notificaciones y nombrar apoderados judiciales y extrajudiciales

Dado y firmado hoy 24 de Marzo de 2004

en Research Triangle Park, Carolina  
del Norte 27709  
por Gregory W. Warren

(El notario debe suscribir el documento en la pagina siguiente)

(Se requiere legalización consular)

**POWER OF ATTORNEY**

I (we) the undersigned Gregory W. Warren  
Syngenta Participations AG

hereby grant(s) Power of Attorney to XIMENA CASTELLANOS A. and for MARGARITA CASTELLANOS a. attorneys residing at Carrera 9 No 93-09, Bogota- Colombia, to prosecute

and to obtain the protection of my (our) Industrial Property, for which purpose we authorize the said attorneys to represent us before any authorities, or persons, specially those, administrative, contentious and judicial, in all matters concerning the following

a) Obtention of patents, models and designs, registration of trademarks, service, collective and defensive marks, and of designations of origin; the deposit of trade names and emblems; its renewal, extension, recordal of assignments, change of name or domicile, voluntary cancellation, and the registration of licenses of use of the above rights, b) For the obtention of Sanitary registrations; c) Actions of opposition, cancellation, nullity, infringement, granting of licenses, and in general the civil, criminal and administrative suits related to those rights, actions and suits instituted by us or against us; and that in all the above matters they may substitute this power of attorney, compromise, desist, cancel, receive, renounce, accept notifications and appoint attorneys in fact, in or out of court

Given and signed this 24<sup>th</sup> March 2004

in Research Triangle Park, North Carolina 27709

by Gregory W. Warren

*Gregory W. Warren*

(Notary shall execute on the other side)

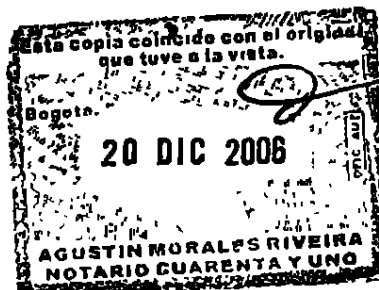
(Consular legalization required)

**ALVARO CASTELLANOS M. & CIA.**

ABOGADOS COLOMBIA

Carrera 9 No 93-09 - P.O. Box 8349 - Bogotá, Colombia  
Tels (571) 610 74 20 / 80 / 80 - Fax (571) 610 07 06 - e-mail: acastellanos@mpsa.net.co

XC/tn



COLOMBIA

**CERTIFICADO NOTARIAL (Sociedad)**

Hoy 24 de Marzo del año 2004  
compareció(eron) personalmente Gregory W. Warren  
a quienes conozco como la(s) personas que firma(n) en  
representación de la Sociedad (Compañía denominada  
Certifico Syngenta Participations AG  
a) Que es una sociedad/Compañía legalmente  
constituida y existente de acuerdo con las leyes de  
b) Que el domicilio de dicha Sociedad/Compañía es Basel, Suiza  
c) Que el objeto u objetos para los cuales se otorga el  
presente poder están comprendidos dentro del objeto  
social de la mencionada Sociedad /Compañía  
d) Que el Sr. Gregory W. Warren  
esta autorizado para otorgar el presente poder Lo anterior  
esta probado por medio de los siguientes documentos, que  
certifico he visto\*

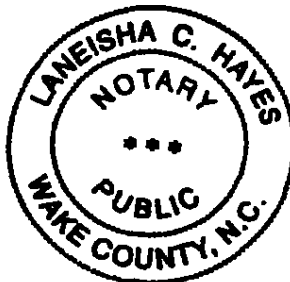
(Ciudad) REsearch Triangle Park

(Estado) Carolina del Norte 27709

Hoy del 24 de Marzo de 2004

(Notario Público) LANEISHA C. HAYES

\*Los documentos debe identificarse con fecha y origen.



**NOTARIAL (Corporation)**

On this 24th day of March of 2004 personally appeared  
Gregory W. Warren whom I know to be the  
person(s) who signed this document as representative(s)  
of the Corporation /Company named Syngenta  
Participations AG

I certify:

- a) That Syngenta Participations AG is a corporation  
(Company legally constituted and in existence in  
accordance with the laws of Basel, Switzerland
- b) That the domicile of said Corporation/Company is  
Basel, Switzerland
- c) That the purpose or purposes for which the present  
Power of Attorney is granted are comprised within the  
object set forth in the charter of the mentioned  
Corporation/Company
- d) That Mr. Gregory W. Warren  
is (are) authorized to grant the present Power of Attorney.  
The aforementioned was duly proven through the following  
documents and I duly certify having seen them\* on the  
24th day of March, 2004 in Research Triangle Park, North  
Carolina 27709

(City) Research Triangle Park

(State) North Carolina, 27709

this 24th day of March of the year 2004

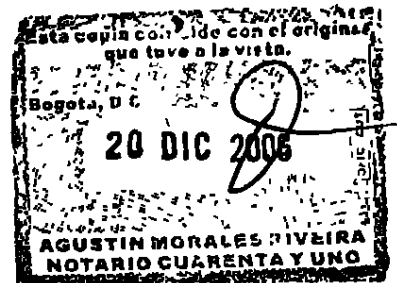
(Notary Public) *Laneisha C. Hayes*  
\*Documents must be identified with date and origin  
*3/24/04 - Research Triangle  
Park, North Carolina  
27709 -  
Syngenta Biotech, Inc.*

**ALVARO CASTELLANOS M. & CIA.**

ABOGADOS COLOMBIA

Carrera 9 No. 83-09 - P.O. Box 6349 - Bogotá, Colombia  
Tels (571) 610 74 20 / 60 / 80 - Fax (571) 610 07 06 - e-mail acastell@impset.net.co

XC/cm





Wake County Register of Deeds  
Post Office Box 1897  
Raleigh, North Carolina 27602-1897

Laura M. Riddick  
Register Of Deeds

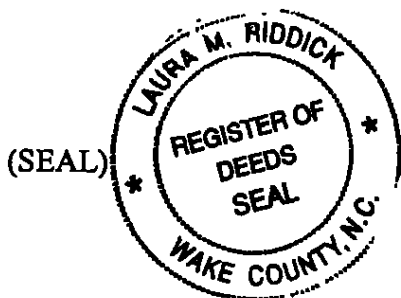
STATE OF NORTH CAROLINA

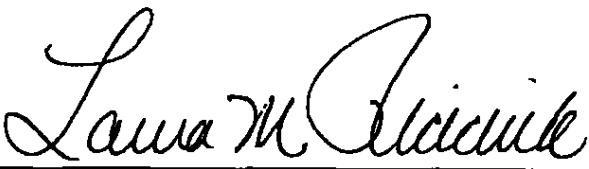
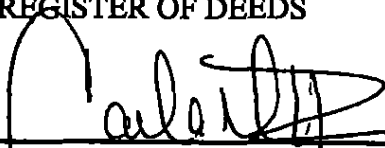
WAKE COUNTY

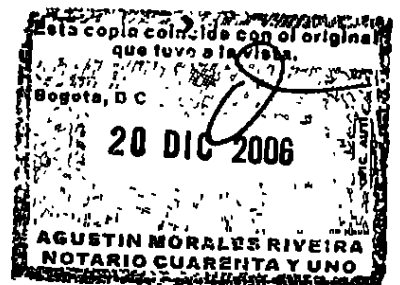
**CERTIFICATE OF REGISTER OF DEEDS THAT  
NOTARY PUBLIC WAS ACTING NOTARY  
AT TIME OF SIGNATURE**

I, LAURA M. RIDDICK, REGISTER OF DEEDS OF THE AFORESAID COUNTY AND STATE, DO HEREBY CERTIFY THAT Laneisha C. Hayes WAS, AT THE TIME OF SIGNING THE FOREGOING (OR ANNEXED) CERTIFICATE, A DULY COMMISSIONED AND QUALIFIED NOTARY PUBLIC IN AND FOR THE COUNTY OF WAKE, STATE OF NORTH CAROLINA, AND AS SUCH FULL FAITH AND CREDIT IS DUE TO HIS OFFICIAL ACTS; AND, FURTHER, THAT HIS SIGNATURE THERETO IS IN HIS OWN PROPER HANDWRITING.

IN TESTIMONY WHEREOF, I HAVE HEREUNTO SET MY HAND AND SEAL OF OFFICE THIS, THE 30TH DAY OF MARCH, 2004.



  
REGISTER OF DEEDS  
  
DEPUTY / ASSISTANT



**APOSTILLE**  
(Convention de La Haye 5 octobre 1961)

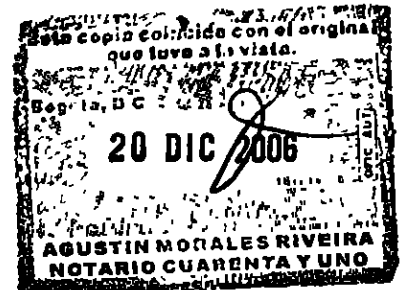
1. COUNTRY: **UNITED STATES OF AMERICA**
2. This Public Document has been signed by CARLA N. BROWN
3. acting in the capacity of DEPUTY REGISTER OF DEEDS  
LAURA M. RIDDICK, REGISTER OF DEEDS
4. bears the seal/stamp of COUNTY OF WAKE, NORTH CAROLINA

**CERTIFIED**

5. at Raleigh, North Carolina
6. the 1ST DAY OF APRIL, 2004
7. by Deputy Secretary of State, State of North Carolina
8. No. 8117
9. Seal/Stamp:
10. Signature



*Roberto S. Medelot*



-----TRADUCCION OFICIAL No. -040417-----

de un documento escrito en INGLES, el cual para su identificación  
lleva el sello de la Traductora e Intérprete oficial, Res. 2755/68 y  
01144/97 de Minjusticia, al igual que la presente.-----

------(Anexos a un poder otorgado por Syngenta

Participations AG)

(fdo) ilegible

3/24/04 Research Triangle Park, NC 27709

ESTADO DE CAROLINA DEL NORTE

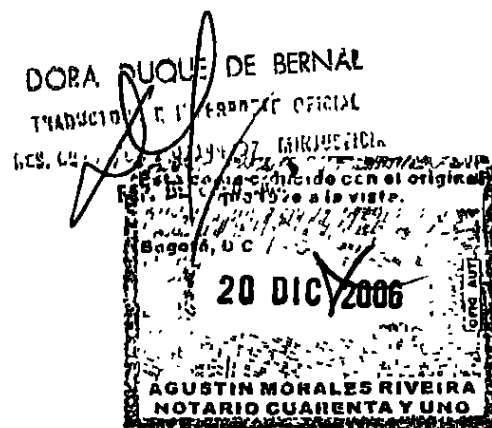
CONDADO DE WAKE

Yo, Laura M. Riddick, Registrador de Escrituras del condado y estado  
antes mencionados, certifico por medio del presente que Laneisha C.  
Hayes, al momento de firmar este documento era un Notario Público  
debidamente comisionado y habilitado en y para el Condado de Wake,  
Estado de Carolina del Norte, y como tal debe dars plena fe y crédito a  
sus actos oficiales, y además, que su firma en el mismo es de su propia  
letra.

En testimonio de lo cual, he impuesto aquí mi firma y sello de oficio,  
hoy día 30 de Marzo de 2004.

Laura M. Riddick, Registrador de Escrituras

Por (fdo) ilegible



Delegado

### APOSTILLA

(Convención de La Haya de octubre 5, 1961)

1. País: Estados Unidos de América
2. Este documento público ha sido firmado por CARLA N. BROWN
3. actuando en su carácter de Delegado del Registrador de Escrituras
4. lleva el sello de Laura M. Riddick, Registrador de Escrituras

Condado de Wake, Carolina del Norte

### CERTIFICADO

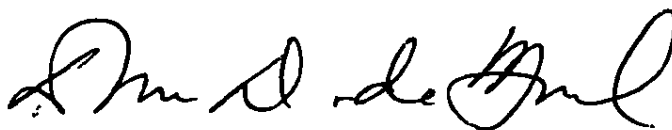
5. En Raleigh, Carolina del Norte
6. el día 1 de Abril de 2004
7. por el Secretario de Estado Delegado, Estado de Carolina del Norte
8. No. 8117
9. Sello: (sello en oblea ocre)

10. Firma

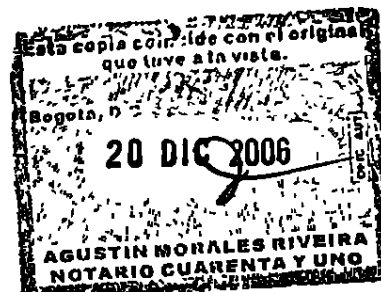
(fdo) Rodney S. Maddox

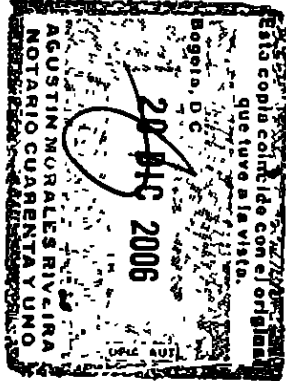
ES TRADUCCION FIEL Y COMPLETA, a la cual me remito,

Bogotá, Abril 15, 2004



DORA DUQUE DE BERNAL  
 TRADUCTORA E INTERPRETE OFICIAL  
 RES. 02755/63 Y 01144/97 - MINJUSTICIA  
 REP. DE COLOMBIA





RELACIONES DE  
MIRASOL DE

21 DEC 2  
Dora Duque  
CJVA FERIA 14/12/2006  
BOGETIA, D.C.  
LAS FUNCIONES INDICADAS

24 DEC 2006  
24 DEC 2006  
24 DEC 2006

(19) World Intellectual Property Organization  
International Bureau(43) International Publication Date  
12 January 2006 (12.01.2006)

PCT

(10) International Publication Number  
WO 2006/003494 A2(51) International Patent Classification: A01N 43/40,  
C07D 401/12, 401/04, 401/14, 293/04, 211/68, 211/06Crop Protection AG, Werk Rosental, Schwarzwaldallee  
215, CH-4058 Basel (CH)(21) International Application Number:  
PCT/IB2005/002002(74) Agents: WATERMAN, John, Richard et al, Intellectual  
Property Department, Syngenta Limited, Jealott's Hill  
International Research Centre, PO Box 3538, Bracknell,  
Berkshire RG42 6YA (GB)

(22) International Filing Date: 22 June 2005 (22.06.2005)

(25) Filing Language: English

(26) Publication Language: English

(30) Priority Data:  
0414438 2 28 June 2004 (28.06.2004) GB(71) Applicant (for all designated States except US): SYN-  
GENTA PARTICIPATIONS AG [CH/CH], Schwarzwald-  
allee 215, CH-4058 Basel (CH)

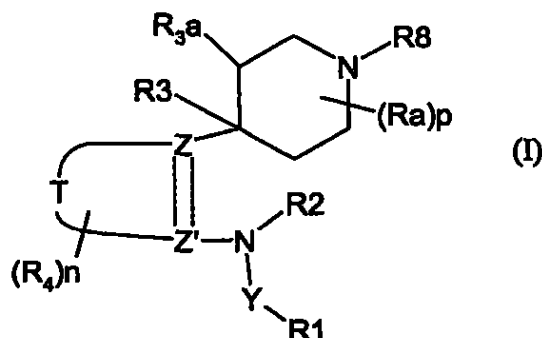
(72) Inventors; and

(75) Inventors/Applicants (for US only): MAIENFISCH,  
Peter [CH/CH], Syngenta Crop Protection AG, Werk  
Rosental, Schwarzwaldallee 215, CH-4058 Basel (CH).  
MOLLEYRES, Louis-Pierre [CH/CH], Syngenta Crop  
Protection AG, Werk Rosental, Schwarzwaldallee  
215, CH-4058 Basel (CH). CASSAYRE, Jérôme  
[FR/CH], Syngenta Crop Protection AG, Werk Rosental,  
Schwarzwaldallee 215, CH-4058 Basel (CH). CEDER-  
BAUM, Fredrik [SE/CH], Syngenta Crop Protection AG,  
Werk Rosental, Schwarzwaldallee 215, CH-4058 Basel  
(CH). CORSI, Camilla [IT/CH], Syngenta Crop Protec-  
tion AG, Werk Rosental, Schwarzwaldallee 215, CH-4058  
Basel (CH). PITTERNA, Thomas [AT/CH], Syngenta(81) Designated States (unless otherwise indicated, for every  
kind of national protection available): AE, AG, AL, AM,  
AT, AU, AZ, BA, BB, BG, BR, BW, BY, BZ, CA, CH, CN,  
CO, CR, CU, CZ, DE, DK, DM, DZ, EC, EE, EG, ES, FI,  
GB, GE, GH, GM, HR, HU, ID, IL, IN, IS, JP, KE,  
KG, KM, KP, KR, KZ, LC, LK, LR, LS, LT, LU, LV, MA,  
MD, MG, MK, MN, MW, MX, MZ, NA, NG, NI, NO, NZ,  
OM, PG, PH, PL, PT, RO, RU, SC, SD, SE, SG, SK, SL,  
SM, SY, TJ, TM, TN, TR, TT, TZ, UA, UG, US, UZ, VC,  
VN, YU, ZA, ZM, ZW(84) Designated States (unless otherwise indicated, for every  
kind of regional protection available): ARIPO (BW, GH,  
GM, KE, LS, MW, MZ, NA, SD, SL, SZ, TZ, UG, ZM,  
ZW), Eurasian (AM, AZ, BY, KG, KZ, MD, RU, TJ, TM),  
European (AT, BE, BG, CH, CY, CZ, DE, DK, EE, ES, FI,  
FR, GB, GR, HU, IE, IS, IT, LT, LU, MC, NL, PL, PT, RO,  
SE, SI, SK, TR), OAPI (BF, BJ, CF, CG, CI, CM, GA, GN,  
GQ, GW, ML, MR, NE, SN, TD, TG)

Published:

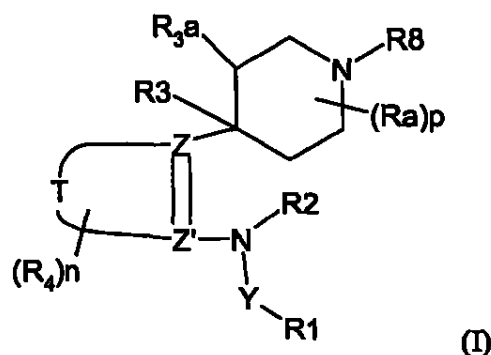
— without international search report and to be republished  
upon receipt of that reportFor two-letter codes and other abbreviations, refer to the "Guid-  
ance Notes on Codes and Abbreviations" appearing at the begin-  
ning of each regular issue of the PCT Gazette

(54) Title: CHEMICAL COMPOUNDS

(57) Abstract: The use of a compound of formula I, Y is a sin-  
gle bond, C=O, C=S or S(O)<sub>m</sub> where m is 0, 1 or 2, the ring is a 6  
membered aromatic ring or is a 5 or 6 membered heteroaromatic  
ring, Z and Z' are =C- or -N- provided that both are not N, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>,  
R<sup>3</sup>, R<sup>3a</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>8</sup> and Ra are specified organic groups and n and p are  
independently 0, 1, 2, 3 or 4, or salts or N-oxides thereof or compo-  
sitions containing them in controlling insects, acarines, nematodes  
or molluscs. Novel compounds are also provided

## CLAIMS

1. A method of combating and controlling insects, acarines, nematodes or molluscs which comprises applying to a pest, to a locus of a pest, or to a plant susceptible to attack by a pest an insecticidally, acaricidally, nematocidally or molluscicidally effective amount of a compound of formula I



where Y is a single bond, C=O, C=S or S(O)<sub>m</sub> where m is 0, 1 or 2;

the ring



is a 6 membered aromatic ring or is a 5 or 6 membered heteroaromatic ring;

Z and Z' are joined by a single or a double bond and are =C- or -N- provided that both are not N;

R<sup>1</sup> is hydrogen, optionally substituted alkyl, optionally substituted alkoxy carbonyl, optionally substituted alkyl carbonyl, aminocarbonyl, optionally substituted alkyl aminocarbonyl, optionally substituted dialkyl aminocarbonyl, optionally substituted aryl, optionally substituted heteroaryl, optionally substituted alkoxy, optionally substituted aryloxy, optionally substituted heteroaryloxy, optionally substituted heterocycloxy, cyano, optionally substituted alkenyl, optionally substituted alkynyl, optionally substituted cycloalkyl, optionally substituted cycloalkenyl, formyl, optionally substituted heterocyclyl, optionally substituted alkylthio, NO or NR<sup>13</sup>R<sup>14</sup> where R<sup>13</sup> and R<sup>14</sup> are independently hydrogen, COR<sup>15</sup>, optionally substituted alkyl, optionally substituted aryl, optionally substituted

heteroaryl, optionally substituted heterocyclyl or  $R^{13}$  and  $R^{14}$  together with the N atom to which they are attached form a group  $-N=C(R^{16})-NR^{17}R^{18}$  or  $R^{13}$  and  $R^{14}$  together with the N atom to which they are attached form a five, six or seven-membered heterocyclic ring which may contain one or two further heteroatoms selected from O, N or S and which may be optionally substituted by one or two  $C_{1-6}$  alkyl groups;  $R^{15}$  is H, optionally substituted alkyl, optionally substituted alkoxy, optionally substituted aryl, optionally substituted aryloxy optionally substituted heteroaryl, optionally substituted heteroaryloxy or  $NR^{19}R^{20}$ ;  $R^{16}$ ,  $R^{17}$  and  $R^{18}$  are each independently H or lower alkyl;  $R^{19}$  and  $R^{20}$  are independently optionally substituted alkyl, optionally substituted aryl or optionally substituted heteroaryl;

$R^2$  is H, hydroxy, optionally substituted alkoxy or optionally substituted alkyl; or  $R^1$  and  $R^2$  together with the groups Y and N form a 5-or 6-membered heterocyclic ring which may optionally contain one further heteroatom selected from O, N or S and which may be optionally substituted by  $C_{1-4}$  alkyl,  $C_{1-4}$  haloalkyl or halogen;

$R^3$  is H, OH, halogen or optionally substituted alkyl;

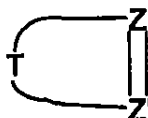
$R^{3a}$  is H or  $R^3$  and  $R^{3a}$  together form a bond;

each  $R^4$  is independently halogen, nitro, cyano, optionally substituted  $C_{1-8}$  alkyl, optionally substituted  $C_{2-6}$  alkenyl, optionally substituted  $C_{2-6}$  alkynyl, optionally substituted alkoxycarbonyl, optionally substituted alkylcarbonyl, optionally substituted alkylaminocarbonyl, optionally substituted dialkylaminocarbonyl, optionally substituted  $C_{3-7}$  cycloalkyl, optionally substituted aryl, optionally substituted heteroaryl, optionally substituted heterocyclyl, optionally substituted alkoxy, optionally substituted aryloxy, optionally substituted heteroaryloxy, optionally substituted alkylthio or  $R^{21}R^{22}N$  where  $R^{21}$  and  $R^{22}$  are, independently, hydrogen,  $C_{1-8}$  alkyl,  $C_{3-7}$  cycloalkyl,  $C_{3-6}$  alkenyl,  $C_{3-6}$  alkynyl,  $C_{3-7}$  cycloalkyl( $C_{1-4}$ )alkyl,  $C_{2-6}$  haloalkyl,  $C_{1-6}$  alkoxy( $C_{1-6}$ )alkyl,  $C_{1-6}$  alkoxycarbonyl or  $R^{21}$  and  $R^{22}$  together with the N atom to which they are attached form a five, six or seven-membered heterocyclic ring which may contain one or two further heteroatoms selected from O, N or S and which may be optionally substituted by one or two  $C_{1-6}$  alkyl groups, or 2 adjacent groups  $R^4$  together with the carbon atoms to which they are attached form a 4, 5, 6, or 7 membered carbocyclic or heterocyclic ring which may be optionally substituted by halogen; n is 0, 1, 2, 3 or 4;

$R^8$  is optionally substituted alkyl, optionally substituted alkenyl, optionally substituted alkynyl, optionally substituted cycloalkyl, optionally substituted aryl, optionally substituted alkoxy, optionally substituted aryloxy, optionally substituted alkoxycarbonyl, optionally substituted alkylcarbonyl or optionally substituted alkenylcarbonyl;

each  $R_a$  is independently halogen, hydroxy, cyano, optionally substituted  $C_{1-8}$  alkyl, optionally substituted  $C_{2-6}$  alkenyl, optionally substituted  $C_{2-6}$  alkynyl, optionally substituted alkoxycarbonyl, optionally substituted alkylcarbonyl, optionally substituted alkylaminocarbonyl, optionally substituted dialkylaminocarbonyl, optionally substituted  $C_{3-7}$  cycloalkyl, optionally substituted aryl, optionally substituted heteroaryl, optionally substituted heterocyclyl, optionally substituted alkoxy, optionally substituted aryloxy, optionally substituted heteroaryloxy, optionally substituted alkylthio, optionally substituted arylthio or  $R^{23}R^{24}N$  where  $R^{23}$  and  $R^{24}$  are, independently, hydrogen,  $C_{1-8}$  alkyl,  $C_{3-7}$  cycloalkyl,  $C_{3-6}$  alkenyl,  $C_{3-6}$  alkynyl,  $C_{3-7}$  cycloalkyl( $C_{1-4}$ )alkyl,  $C_{2-6}$  haloalkyl,  $C_{1-6}$  alkoxy( $C_{1-6}$ )alkyl,  $C_{1-6}$  alkoxycarbonyl or  $R^{23}$  and  $R^{24}$  together with the N atom to which they are attached form a five, six or seven-membered heterocyclic ring which may contain one or two further heteroatoms selected from O, N or S and which may be optionally substituted by one or two  $C_{1-6}$  alkyl groups, or two  $R_a$  groups attached to the same carbon atom are  $=O$ ,  $=S$ ,  $=NR^b$ ,  $=CR^cR^d$  where  $R^b$ ,  $R^c$  and  $R^d$  are independently H or optionally substituted alkyl; p is 0, 1, 2, 3 or 4 or salts or N-oxides thereof.

2. A method according to claim 1 wherein the ring



is a 6-membered aromatic ring or is 5 or 6 membered heteroaromatic ring wherein the ring members are each independently CH, S, N,  $NR^4$ , O, or  $CR^4$  provided that at least one ring member is other than CH or  $CR^4$  and that there are no more than one O or S atoms present in the ring.

3. A method according to claim 1 or claim 2 wherein Y is a single bond,  $C=O$  or  $C=S$ .

4. A method according to any preceding claim wherein R<sup>1</sup> is hydrogen, C<sub>1-6</sub> alkyl, C<sub>1-6</sub> cyanoalkyl, C<sub>1-6</sub> haloalkyl, C<sub>3-7</sub> cycloalkyl(C<sub>1-4</sub>)alkyl, C<sub>1-6</sub> alkoxy(C<sub>1-6</sub>)alkyl, heteroaryl(C<sub>1-6</sub>)alkyl (wherein the heteroaryl group may be optionally substituted by halo, nitro, cyano, C<sub>1-6</sub> alkyl, C<sub>1-6</sub> haloalkyl, C<sub>1-6</sub> alkoxy, C<sub>1-6</sub> haloalkoxy, C<sub>1-6</sub> alkylsulfonyl, C<sub>1-6</sub> alkylsulfinyl, C<sub>1-6</sub> alkylthio, C<sub>1-6</sub> alkoxycarbonyl, C<sub>1-6</sub> alkylcarbonylamino, arylcarbonyl, or two adjacent positions on the heteroaryl system may be cyclised to form a 5, 6 or 7 membered carbocyclic or heterocyclic ring, itself optionally substituted with halogen), aryl(C<sub>1-6</sub>)alkyl (wherein the aryl group may be optionally substituted by halo, nitro, cyano, C<sub>1-6</sub> alkyl, C<sub>1-6</sub> haloalkyl, C<sub>1-6</sub> alkoxy, C<sub>1-6</sub> haloalkoxy, C<sub>1-6</sub> alkylsulfonyl, C<sub>1-6</sub> alkylsulfinyl, C<sub>1-6</sub> alkylthio, C<sub>1-6</sub> alkoxycarbonyl, C<sub>1-6</sub> alkylcarbonylamino, arylcarbonyl, or two adjacent positions on the aryl system may be cyclised to form a 5, 6 or 7 membered carbocyclic or heterocyclic ring, itself optionally substituted with halogen), C<sub>1-6</sub> alkylcarbonylamino(C<sub>1-6</sub>)alkyl, aryl (which may be optionally substituted by halo, nitro, cyano, C<sub>1-6</sub> alkyl, C<sub>1-6</sub> haloalkyl, C<sub>1-6</sub> alkoxy, C<sub>1-6</sub> haloalkoxy, C<sub>1-6</sub> alkylsulfonyl, C<sub>1-6</sub> alkylsulfinyl, C<sub>1-6</sub> alkylthio, C<sub>1-6</sub> alkoxycarbonyl, C<sub>1-6</sub> alkylcarbonylamino, arylcarbonyl, or two adjacent positions on the aryl system may be cyclised to form a 5, 6 or 7 membered carbocyclic or heterocyclic ring, itself optionally substituted with halogen), heteroaryl (which may be optionally substituted by halo, nitro, cyano, C<sub>1-6</sub> alkyl, C<sub>1-6</sub> haloalkyl, C<sub>1-6</sub> alkoxy, C<sub>1-6</sub> haloalkoxy, C<sub>1-6</sub> alkylsulfonyl, C<sub>1-6</sub> alkylsulfinyl, C<sub>1-6</sub> alkylthio, C<sub>1-6</sub> alkoxycarbonyl, C<sub>1-6</sub> alkylcarbonylamino, arylcarbonyl, or two adjacent positions on the heteroaryl system may be cyclised to form a 5, 6 or 7 membered carbocyclic or heterocyclic ring, itself optionally substituted with halogen), C<sub>1-6</sub> alkoxy, C<sub>1-6</sub> haloalkoxy, phenoxy (wherein the phenyl group is optionally substituted by halogen, C<sub>1-4</sub> alkyl, C<sub>1-4</sub> alkoxy, C<sub>1-4</sub> haloalkyl, C<sub>1-4</sub> haloalkoxy, CN, NO<sub>2</sub>, aryl, heteroaryl, amino or dialkylamino), heteroaryloxy (optionally substituted by halo, nitro, cyano, C<sub>1-6</sub> alkyl, C<sub>1-6</sub> haloalkyl, C<sub>1-6</sub> alkoxy or C<sub>1-6</sub> haloalkoxy), heterocyclyloxy (optionally substituted by halo, C<sub>1-6</sub> alkyl, C<sub>1-6</sub> haloalkyl, C<sub>1-6</sub> alkoxy or C<sub>1-6</sub> haloalkoxy), cyano, C<sub>2-6</sub> alkenyl, C<sub>2-6</sub> alkynyl, C<sub>3-6</sub> cycloalkyl, C<sub>5-7</sub> cycloalkenyl, heterocyclyl (optionally substituted by halo, nitro, cyano, C<sub>1-6</sub> alkyl, C<sub>1-6</sub> haloalkyl, C<sub>1-6</sub> alkoxy or C<sub>1-6</sub> haloalkoxy), C<sub>1-6</sub>

alkylthio, C<sub>1-6</sub> haloalkylthio or NR<sup>13</sup>R<sup>14</sup> where R<sup>13</sup> and R<sup>14</sup> are independently hydrogen, C<sub>1-6</sub> alkyl, C<sub>1-6</sub> haloalkyl, C<sub>1-6</sub> alkoxy(C<sub>1-6</sub>)alkyl, phenyl (which may be optionally substituted by halogen, C<sub>1-4</sub> alkyl, C<sub>1-4</sub> alkoxy, C<sub>1-4</sub> haloalkyl, C<sub>1-4</sub> haloalkoxy, CN, NO<sub>2</sub>, aryl, heteroaryl, amino, dialkylamino or C<sub>1-4</sub> alkoxycarbonyl), phenyl (C<sub>1-6</sub>)alkyl (wherein the phenyl group may be optionally substituted by halogen, C<sub>1-4</sub> alkyl, C<sub>1-4</sub> alkoxy, C<sub>1-4</sub> haloalkyl, C<sub>1-4</sub> haloalkoxy, CN, NO<sub>2</sub>, aryl, heteroaryl, amino, dialkylamino, C<sub>1-6</sub> alkylsulfonyl, C<sub>1-6</sub> alkoxycarbonyl, or two adjacent positions on the phenyl ring may be cyclised to form a 5, 6 or 7 membered carbocyclic or heterocyclic ring, itself optionally substituted with halogen), heteroaryl (C<sub>1-6</sub>)alkyl (wherein the heteroaryl group may be optionally substituted by halo, nitro, cyano, C<sub>1-6</sub> alkyl, C<sub>1-6</sub> haloalkyl, C<sub>1-6</sub> alkoxy, C<sub>1-6</sub> haloalkoxy, C<sub>1-6</sub> alkylsulfonyl, C<sub>1-6</sub> alkylsulfinyl, C<sub>1-6</sub> alkylthio, C<sub>1-6</sub> alkoxycarbonyl, C<sub>1-6</sub> alkylcarbonylamino, arylcarbonyl, or two adjacent positions on the heteroaryl system may be cyclised to form a 5, 6 or 7 membered carbocyclic or heterocyclic ring, itself optionally substituted with halogen) or heteroaryl (which may be optionally substituted by halo, nitro, cyano, C<sub>1-6</sub> alkyl, C<sub>1-6</sub> haloalkyl, C<sub>1-6</sub> alkoxy or C<sub>1-6</sub> haloalkoxy, C<sub>1-4</sub> alkoxycarbonyl C<sub>1-6</sub> alkylcarbonylamino, phenyloxycarbonylamino (wherein the phenyl group is optionally substituted by halogen, C<sub>1-4</sub> alkyl, C<sub>1-4</sub> alkoxy, C<sub>1-4</sub> haloalkyl, C<sub>1-4</sub> haloalkoxy, CN, NO<sub>2</sub>, aryl, heteroaryl, amino or dialkylamino), amino, C<sub>1-6</sub> alkylamino or phenylamino (wherein the phenyl group is optionally substituted by halogen, C<sub>1-4</sub> alkyl, C<sub>1-4</sub> alkoxy, C<sub>1-4</sub> haloalkyl, C<sub>1-4</sub> haloalkoxy, CN, NO<sub>2</sub>, aryl, heteroaryl, amino or dialkylamino)).

5. A method according to any preceding claim wherein R<sup>2</sup> is hydrogen, hydroxy, C<sub>1-6</sub> alkyl or C<sub>1-6</sub> haloalkyl.
6. A method according to any preceding claim wherein each R<sup>4</sup> is independently halogen, cyano, C<sub>1-8</sub> alkyl, C<sub>1-8</sub> haloalkyl, C<sub>1-6</sub> cyanoalkyl, C<sub>1-6</sub> alkoxy(C<sub>1-6</sub>)alkyl, C<sub>3-7</sub> cycloalkyl(C<sub>1-6</sub>)alkyl, C<sub>3-6</sub> cycloalkenyl(C<sub>1-6</sub>)alkyl, C<sub>3-6</sub> alkenyloxy(C<sub>1-6</sub>)alkyl, C<sub>3-6</sub> alkynyloxy(C<sub>1-6</sub>)alkyl, aryloxy(C<sub>1-6</sub>)alkyl, C<sub>1-6</sub> carboxyalkyl, C<sub>1-6</sub> alkylcarbonyl(C<sub>1-6</sub>)alkyl, C<sub>2-6</sub> alkenylcarbonyl(C<sub>1-6</sub>)alkyl, C<sub>2-6</sub> alkynylcarbonyl(C<sub>1-6</sub>)alkyl, C<sub>1-6</sub> alkoxycarbonyl(C<sub>1-6</sub>)alkyl, C<sub>3-6</sub> alkenyloxycarbonyl(C<sub>1-6</sub>)alkyl, C<sub>3-6</sub>

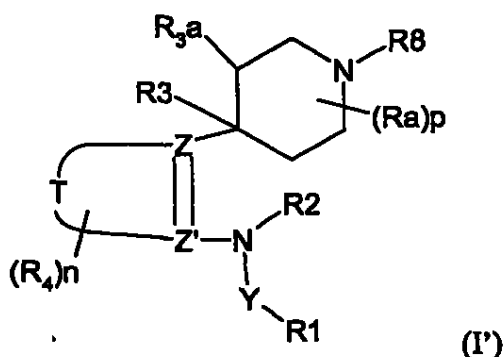
alkynyloxycarbonyl(C<sub>1-6</sub>)alkyl, aryloxycarbonyl(C<sub>1-6</sub>)alkyl, C<sub>1-6</sub> alkylthio(C<sub>1-6</sub>)alkyl,  
 C<sub>1-6</sub> alkylsulfinyl(C<sub>1-6</sub>)alkyl, C<sub>1-6</sub> alkylsulfonyl(C<sub>1-6</sub>)alkyl, aminocarbonyl(C<sub>1-6</sub>)alkyl,  
 C<sub>1-6</sub> alkylaminocarbonyl(C<sub>1-6</sub>)alkyl, di(C<sub>1-6</sub>)alkylaminocarbonyl(C<sub>1-6</sub>)alkyl,  
 phenyl(C<sub>1-4</sub>)alkyl (wherein the phenyl group is optionally substituted by halogen, C<sub>1-4</sub>  
 5 alkyl, C<sub>1-4</sub> alkoxy, C<sub>1-4</sub> haloalkyl, C<sub>1-4</sub> haloalkoxy, CN, NO<sub>2</sub>, aryl, heteroaryl, amino  
 or dialkylamino), heteroaryl(C<sub>1-4</sub>)alkyl (wherein the heteroaryl group is optionally  
 substituted by halo, nitro, cyano, C<sub>1-6</sub> alkyl, C<sub>1-6</sub> haloalkyl, C<sub>1-6</sub> alkoxy or C<sub>1-6</sub>  
 haloalkoxy), heterocyclyl(C<sub>1-4</sub>)alkyl (wherein the heterocyclyl group is optionally  
 substituted by halo, nitro, cyano, C<sub>1-6</sub> alkyl, C<sub>1-6</sub> haloalkyl, C<sub>1-6</sub> alkoxy or C<sub>1-6</sub>  
 10 haloalkoxy), C<sub>2-6</sub> alkenyl, aminocarbonyl(C<sub>2-6</sub>)alkenyl, C<sub>1-6</sub> alkylaminocarbonyl(C<sub>2-6</sub>)  
 alkenyl, di(C<sub>1-6</sub>)alkylaminocarbonyl(C<sub>2-6</sub>)alkenyl, phenyl(C<sub>2-4</sub>)-alkenyl, (wherein the  
 phenyl group is optionally substituted by halogen, C<sub>1-4</sub> alkyl, C<sub>1-4</sub> alkoxy, C<sub>1-4</sub>  
 haloalkyl, C<sub>1-4</sub> haloalkoxy, CN, NO<sub>2</sub>, aryl, heteroaryl, amino or dialkylamino), C<sub>2-6</sub>  
 alkynyl, trimethylsilyl(C<sub>2-6</sub>)alkynyl, aminocarbonyl(C<sub>2-6</sub>)alkynyl, C<sub>1-6</sub>  
 15 alkylaminocarbonyl(C<sub>2-6</sub>)alkynyl, di(C<sub>1-6</sub>)alkylaminocarbonyl(C<sub>2-6</sub>)alkynyl, C<sub>1-6</sub>  
 alkoxycarbonyl, C<sub>3-7</sub> cycloalkyl, C<sub>3-7</sub> halocycloalkyl, C<sub>3-7</sub> cyanocycloalkyl, C<sub>1-3</sub>  
 alkyl(C<sub>3-7</sub>)-cycloalkyl, C<sub>1-3</sub> alkyl(C<sub>3-7</sub>)halocycloalkyl, phenyl (optionally substituted by  
 halogen, C<sub>1-4</sub> alkyl, C<sub>1-4</sub> alkoxy, C<sub>1-4</sub> haloalkyl, C<sub>1-4</sub> haloalkoxy, CN, NO<sub>2</sub>, aryl,  
 heteroaryl, amino or dialkylamino), heteroaryl (optionally substituted by halo, nitro,  
 20 cyano, C<sub>1-6</sub> alkyl, C<sub>1-6</sub> haloalkyl, C<sub>1-6</sub> alkoxy or C<sub>1-6</sub> haloalkoxy), heterocyclyl  
 (wherein the heterocyclyl group is optionally substituted by halo, nitro, cyano, C<sub>1-6</sub>  
 alkyl, C<sub>1-6</sub> haloalkyl, C<sub>1-6</sub> alkoxy or C<sub>1-6</sub> haloalkoxy), or 2 adjacent groups R<sup>4</sup> together  
 with the carbon atoms to which they are attached form a 4, 5, 6 or 7 membered  
 carbocyclic or heterocyclic ring which may be optionally substituted by halogen, C<sub>1-3</sub>  
 25 alkoxy, C<sub>1-6</sub> haloalkoxy, phenoxy (optionally substituted by halo, nitro, cyano, C<sub>1-6</sub>  
 alkyl, C<sub>1-6</sub> haloalkyl, C<sub>1-6</sub> alkoxy or C<sub>1-6</sub> haloalkoxy), heteroaryloxy (optionally  
 substituted by halo, nitro, cyano, C<sub>1-6</sub> alkyl, C<sub>1-6</sub> haloalkyl, C<sub>1-6</sub> alkoxy or C<sub>1-6</sub>  
 haloalkoxy), C<sub>1-3</sub> alkylthio or R<sup>19</sup>R<sup>20</sup>N where R<sup>19</sup> and R<sup>20</sup> are, independently,  
 hydrogen, C<sub>1-3</sub> alkyl, C<sub>3-7</sub> cycloalkyl, C<sub>3-6</sub> alkenyl, C<sub>3-6</sub> alkynyl, C<sub>2-6</sub> haloalkyl, C<sub>1-6</sub>  
 30 alkoxycarbonyl or R<sup>19</sup> and R<sup>20</sup> together with the N atom to which they are attached  
 form a five, six or seven-membered heterocyclic ring which may contain one or two

further heteroatoms selected from O, N or S and which may be optionally substituted by one or two C<sub>1-6</sub> alkyl groups; n is 0, 1, 2 or 3.

7. A method according to any preceding claim wherein R<sup>8</sup> is C<sub>1-10</sub> alkyl, C<sub>1-10</sub> haloalkyl, aryl(C<sub>1-6</sub>)alkyl (wherein the aryl group is optionally substituted by halogen, C<sub>1-4</sub> alkyl, C<sub>1-4</sub> alkoxy, C<sub>1-4</sub> haloalkyl, C<sub>1-4</sub> haloalkoxy, CN, NO<sub>2</sub>, aryl, heteroaryl, amino or dialkylamino), heteroaryl(C<sub>1-6</sub>)alkyl (wherein the heteroaryl group is optionally substituted by halogen, C<sub>1-4</sub> alkyl, C<sub>1-4</sub> alkoxy, C<sub>1-4</sub> haloalkyl, C<sub>1-4</sub> haloalkoxy, CN, NO<sub>2</sub>, aryl, heteroaryl, amino or dialkylamino), arylcarbonyl-(C<sub>1-6</sub>)alkyl (wherein the aryl group may be optionally substituted by halogen, C<sub>1-4</sub> alkyl, C<sub>1-4</sub> alkoxy, C<sub>1-4</sub> haloalkyl, C<sub>1-4</sub> haloalkoxy, CN, NO<sub>2</sub>, aryl, heteroaryl, amino or dialkylamino and the alkyl group may be optionally substituted by aryl), C<sub>2-8</sub> alkenyl, C<sub>2-8</sub> haloalkenyl, aryl(C<sub>2-6</sub>)-alkenyl (wherein the aryl group is optionally substituted halogen, C<sub>1-4</sub> alkyl, C<sub>1-4</sub> alkoxy, C<sub>1-4</sub> haloalkyl, C<sub>1-4</sub> haloalkoxy, CN, NO<sub>2</sub>, aryl, heteroaryl, amino or dialkylamino, C<sub>1-6</sub> alkoxycarbonyl, or two adjacent substituents can cyclise to form a 5, 6 or 7 membered carbocyclic or heterocyclic ring), heteroaryl(C<sub>2-6</sub>)-alkenyl (wherein the heteroaryl group is optionally substituted halogen, C<sub>1-4</sub> alkyl, C<sub>1-4</sub> alkoxy, C<sub>1-4</sub> haloalkyl, C<sub>1-4</sub> haloalkoxy, CN, NO<sub>2</sub>, aryl, heteroaryl, amino or dialkylamino, C<sub>1-6</sub> alkoxycarbonyl, or two adjacent substituents can cyclise to form a 5, 6 or 7 membered carbocyclic or heterocyclic ring), C<sub>2-6</sub> alkynyl, phenyl(C<sub>2-6</sub>)alkynyl (wherein the phenyl group is optionally substituted by halogen, C<sub>1-4</sub> alkyl, C<sub>1-4</sub> alkoxy, C<sub>1-4</sub> haloalkyl, C<sub>1-4</sub> haloalkoxy, CN, NO<sub>2</sub>, aryl, heteroaryl, amino or dialkylamino), C<sub>3-7</sub> cycloalkyl, C<sub>1-6</sub> alkoxycarbonyl, C<sub>1-6</sub> alkylcarbonyl, C<sub>1-6</sub> haloalkylcarbonyl or aryl(C<sub>2-6</sub>)alkenylcarbonyl (wherein the aryl group may be optionally substituted halogen, C<sub>1-4</sub> alkyl, C<sub>1-4</sub> alkoxy, C<sub>1-4</sub> haloalkyl, C<sub>1-4</sub> haloalkoxy, CN, NO<sub>2</sub>, aryl, heteroaryl, amino or dialkylamino), or -C(R<sup>51</sup>)(R<sup>52</sup>)-[CR<sup>53</sup>=CR<sup>54</sup>]<sub>z</sub>-R<sup>55</sup> where z is 1 or 2, R<sup>51</sup> and R<sup>52</sup> are each independently H, halo or C<sub>1-2</sub> alkyl, R<sup>53</sup> and R<sup>54</sup> are each independently H, halogen, C<sub>1-4</sub> alkyl or C<sub>1-4</sub> haloalkyl and R<sup>55</sup> is optionally substituted aryl or optionally substituted heteroaryl.
8. A method according to any preceding claim wherein Ra is independently halo, cyano, C<sub>1-3</sub> alkyl, hydroxy or two Ra groups together with the carbon atom to which they are

attached form =O, =S, =NR<sub>b</sub>, =CR<sub>c</sub>R<sub>d</sub> where R<sub>b</sub>, R<sub>c</sub> and R<sub>d</sub> are independently H or optionally substituted alkyl, and p is 0, 1 or 2.

9. A method according to any preceding claim wherein R<sup>3</sup> is hydrogen, hydroxy,  
 5 halogen, C<sub>1-6</sub> alkyl or C<sub>1-6</sub> haloalkyl and R<sup>3a</sup> is hydrogen or R<sup>3</sup> and R<sup>3a</sup> together form a double bond.
10. A compound of formula I'



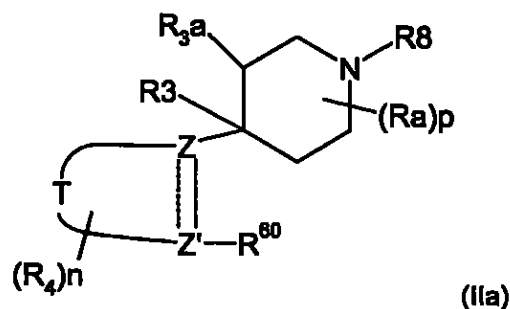
wherein ; the ring



and R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>3a</sup>, R<sup>4</sup>, R<sub>a</sub>, Y, n and p are as defined in relation to formula I in claim 1 and R<sup>8</sup> is -C(R<sup>51</sup>)(R<sup>52</sup>)-[CR<sup>53</sup>=CR<sup>54</sup>]<sub>z</sub>-R<sup>55</sup> where z is 1 or 2, R<sup>51</sup> and R<sup>52</sup> are each  
 15 independently H or C<sub>1-2</sub> alkyl, R<sup>53</sup> and R<sup>54</sup> are each independently H, halogen, C<sub>1-4</sub> alkyl or C<sub>1-4</sub> haloalkyl and R<sup>55</sup> is phenyl substituted by halogen, C<sub>1-4</sub> alkyl, C<sub>1-4</sub> alkoxy, C<sub>1-4</sub> haloalkyl, C<sub>1-4</sub> haloalkoxy, CN, NO<sub>2</sub>, aryl, heteroaryl, amino or  
 20 dialkylamino or heteroaryl substituted by halogen, C<sub>1-4</sub> alkyl, C<sub>1-4</sub> alkoxy, C<sub>1-4</sub> haloalkyl, C<sub>1-4</sub> haloalkoxy, CN, NO<sub>2</sub>, aryl, heteroaryl, amino or dialkylamino or salts or N-oxides thereof.

11. A compound of formula IIa

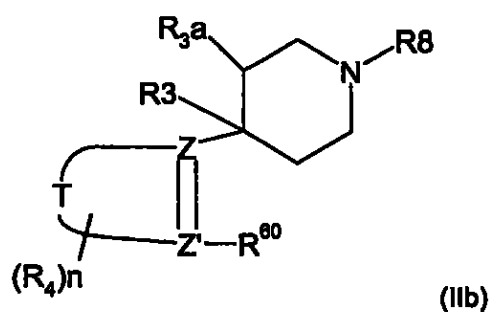
- 160 -



wherein ; the ring



and  $R^3$ ,  $R^{3a}$ ,  $R^4$ ,  $R^8$ ,  $Ra$ ,  $n$  and  $p$  are as defined in relation to formula I' in claim 10  
 5 and  $R^{60}$  is  $NH_2$ ,  $NO_2$  or halogen; or  
 a compound of formula (IIb)



wherein ; the ring



10 and  $R^4$ ,  $R^{60}$  and  $n$  are as defined in relation to formula IIa,  $R^3$  and  $R^{3a}$  are both H or together form a bond and  $R^8$  is methyl, benzyl or  $COOC_{1-6}alkyl$  provided that the compound is not tert-butyl 4-(2-aminophenyl)piperidine-1-carboxylate or 2,4-diamino-5-(1-benzyl-4-piperidinyl)-pyrimidine.

- 15 12. An insecticidal acaricidal and nematocidal composition comprising an insecticidally, acaricidally or nematocidally effective amount of a compound of formula I as defined in claim 1.

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No  
PCT/IB2005/002002

## A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER

A01N43/40 C07D401/12 C07D401/04 C07D401/14 C07D213/04  
C07D211/68 C07D211/06

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

## B. FIELDS SEARCHED

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

A01N C07D

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the International search (name of data base and, where practical, search terms used)

EPO-Internal, WPI Data, CHEM ABS Data, BEILSTEIN Data

## C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

| Category * | Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages                                                                                                                                                                                                                       | Relevant to claim No. |
|------------|----------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-----------------------|
| X          | WO 03/009847 A (AMGEN, INC)<br>6 February 2003 (2003-02-06)<br>examples 1-26; tables 1-3,5,6,8<br>-----                                                                                                                                                                                                  | 12                    |
| X          | US 3 041 342 A (JUCKER ERNST ET AL)<br>26 June 1962 (1962-06-26)<br>column 2, line 43 - column 3, line 49;<br>examples; compounds I-VIII<br>-----                                                                                                                                                        | 12                    |
| X          | ELLIOTT J M ET AL: "Serine derived NK1<br>antagonists 2: a pharmacophore model for<br>arylsulfonamide binding"<br>BIOORGANIC & MEDICINAL CHEMISTRY LETTERS,<br>OXFORD, GB,<br>vol. 8, no. 14, 21 July 1998 (1998-07-21),<br>pages 1851-1856, XP004137143<br>ISSN: 0960-894X<br>figure 2<br>-----<br>-/-- | 12                    |

☒ Further documents are listed in the continuation of box C.

☒ Patent family members are listed in annex.

## \* Special categories of cited documents

"A" document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance

"E" earlier document but published on or after the International filing date

"L" document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)

"O" document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means

"P" document published prior to the International filing date but later than the priority date claimed

"T" later document published after the International filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention

"X" document of particular relevance, the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone

"Y" document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.

"Z" document member of the same patent family

Date of the actual completion of the International search

16 September 2005

Date of mailing of the international search report

08.02.2006

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.B. 5818 Patentkanal 2  
NL - 2280 HV Rijswijk  
Tel: (+31-70) 340-2040, Tx 31 651 epo nl,  
Fax: (+31-70) 340-3016

Authorized officer

Molina de Alba, J

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No

PCT/IB2005/002002

## C (Continuation) DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT

| Category * | Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages                                                                                                          | Relevant to claim No. |
|------------|---------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-----------------------|
| X          | FR 1 343 157 A (SANDOZ S. A)<br>15 November 1963 (1963-11-15)<br>abstract; examples<br>-----                                                                                                | 12                    |
| X          | FR 1 365 661 A (SANDOZ S. A)<br>3 July 1964 (1964-07-03)<br>abstract; examples<br>-----                                                                                                     | 12                    |
| X          | MARC S. BERRIDGE ET AL.: "Design and<br>synthesis of 18F-labeled neurotoxic<br>analogs of MPTP"<br>J.MED.CHEM.,<br>vol. 36, 1993, pages 1284-1290,<br>XP002345238<br>compounds 1,2<br>----- | 12                    |
| A          | EP 0 494 717 A (SHELL INTERNATIONALE<br>RESEARCH MAATSCHAPPIJ B.V)<br>15 July 1992 (1992-07-15)<br>cited in the application<br>abstract; table I<br>-----                                   | 1-10                  |

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International application No  
PCT/IB2005/002002**Box II Observations where certain claims were found unsearchable (Continuation of item 2 of first sheet)**

This International Search Report has not been established in respect of certain claims under Article 17(2)(a) for the following reasons:

1. ☐ Claims Nos. because they relate to subject matter not required to be searched by this Authority, namely:
2. ☐ Claims Nos. because they relate to parts of the International Application that do not comply with the prescribed requirements to such an extent that no meaningful International Search can be carried out, specifically:
3. ☐ Claims Nos. because they are dependent claims and are not drafted in accordance with the second and third sentences of Rule 6.4(a)

**Box III Observations where unity of invention is lacking (Continuation of item 3 of first sheet)**

This International Searching Authority found multiple inventions in this International application, as follows:

see additional sheet

1. ☐ As all required additional search fees were timely paid by the applicant, this International Search Report covers all searchable claims
2. ☐ As all searchable claims could be searched without effort justifying an additional fee, this Authority did not invite payment of any additional fee.
3. ☐ As only some of the required additional search fees were timely paid by the applicant, this International Search Report covers only those claims for which fees were paid, specifically claims Nos..
4. ☒ No required additional search fees were timely paid by the applicant. Consequently, this International Search Report is restricted to the invention first mentioned in the claims; it is covered by claims Nos.

see annex

Remark on Protest

- ☐ The additional search fees were accompanied by the applicant's protest
- ☐ No protest accompanied the payment of additional search fees.

## FURTHER INFORMATION CONTINUED FROM PCT/ISA/ 210

This International Searching Authority found multiple (groups of) inventions in this international application, as follows:

1. claims: 1-10,12

Compositions comprising the piperidine derivatives of Formula (I) and their use for controlling insects, acarines, nematodes, or mulluscs and piperidine. Compounds of formula (I').

---

2. claim: 11

Compounds of Formula IIa or IIb

---

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

25

Information on patent family members

International Application No

PCT/IB2005/002002

| Patent document<br>cited in search report |   | Publication<br>date | Patent family<br>member(s) | Publication<br>date |
|-------------------------------------------|---|---------------------|----------------------------|---------------------|
| WO 03009847                               | A | 06-02-2003          | CA 2452328 A1              | 06-02-2003          |
|                                           |   |                     | EP 1416933 A1              | 12-05-2004          |
|                                           |   |                     | JP 2005504028 T            | 10-02-2005          |
|                                           |   |                     | MX PA04000625 A            | 20-04-2004          |
|                                           |   |                     | US 2004006067 A1           | 08-01-2004          |
| US 3041342                                | A | 26-06-1962          | CH 373391 A                | 30-11-1963          |
|                                           |   |                     | DE 1150989 B               |                     |
|                                           |   |                     | GB 939901 A                | 16-10-1963          |
|                                           |   |                     | LU 38903 A                 |                     |
|                                           |   |                     | NL 253320 A                |                     |
| FR 1343157                                | A | 15-11-1963          | FR 2449 M                  |                     |
|                                           |   |                     | NL 286158 A                |                     |
| FR 1365661                                | A | 03-07-1964          | FR 3048 M                  |                     |
| EP 0494717                                | A | 15-07-1992          | CN 1063101 A               | 29-07-1992          |
|                                           |   |                     | CS 9200044 A3              | 15-07-1992          |
|                                           |   |                     | WO 9212130 A1              | 23-07-1992          |
|                                           |   |                     | HU 65119 A2                | 28-04-1994          |
|                                           |   |                     | JP 6506441 T               | 21-07-1994          |
|                                           |   |                     | RU 2097375 C1              | 27-11-1997          |
|                                           |   |                     | TR 28066 A                 | 11-12-1995          |
|                                           |   |                     | US 5489599 A               | 06-02-1996          |
|                                           |   |                     | ZA 9200149 A               | 30-09-1992          |

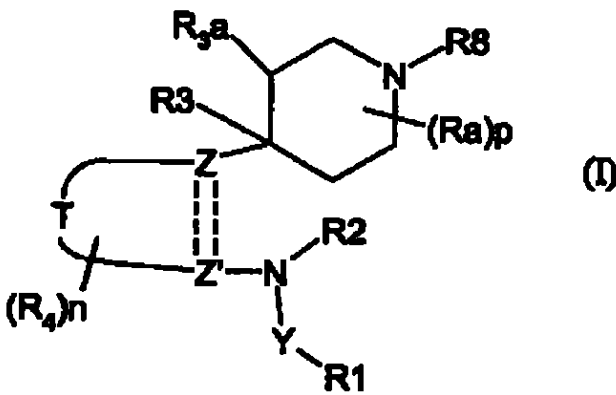
**COMPUESTOS QUÍMICOS**

La presente invención se refiere a derivados de piperidina, a procesos para prepararlos, a composiciones insecticidas, acaricidas, molusquicidas y nematicidas que los comprenden y a métodos para usarlos en el combate y control de plagas de insectos, ácaros, moluscos y nematodos

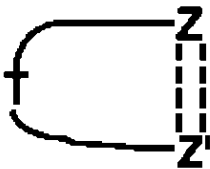
En la EP494717, por ejemplo, se dan a conocer derivados de piperidina con propiedades funguicidas

Ahora se ha descubierto sorprendentemente que ciertas piperidinas tienen propiedades insecticidas

La presente invención, por lo tanto, proporciona un método para combatir y controlar insectos, ácaros, nematodos o moluscos que comprende aplicar a una plaga, al locus de una plaga, o a una planta propensos a padecer el ataque de una plaga una cantidad efectiva como insecticida, acaricida, nematicida o molusquicida de un compuesto de Fórmula (I)



Y es un enlace simple, C=O, C=S o S(O)<sub>m</sub> donde m es 0, 1 o 2; el anillo



es un anillo aromático de seis miembros o es un anillo heteroaromático de cinco o seis miembros,

Z y Z' están unidos por un enlace simple o doble y son  $\begin{smallmatrix} | \\ =C- \end{smallmatrix}$  o  $\begin{smallmatrix} | \\ -N- \end{smallmatrix}$  siempre y cuando ambos no sean N,

$R^1$  es hidrógeno, alquilo opcionalmente sustituido, alcoxicarbonilo opcionalmente sustituido, alquilcarbonilo opcionalmente sustituido, aminocarbonilo, alquilaminocarbonilo opcionalmente sustituido, dialquilaminocarbonilo opcionalmente sustituido, arilo opcionalmente sustituido, heteroarilo opcionalmente sustituido, alcoxi opcionalmente sustituido, ariloxi  
 5 opcionalmente sustituido, heteroariloxi opcionalmente sustituido, heterociclioxi opcionalmente sustituido, ciano, alquenilo opcionalmente sustituido, alquinilo opcionalmente sustituido, cicloalquilo opcionalmente sustituido, cicloalquenilo opcionalmente sustituido, formilo, heterociclilo opcionalmente sustituido, alquiltio opcionalmente sustituido, NO o  $NR^{13}R^{14}$  donde  $R^{13}$  y  $R^{14}$  son independientemente hidrógeno,  $COR^{15}$ , alquilo opcionalmente sustituido, arilo  
 10 opcionalmente sustituido, heteroarilo opcionalmente sustituido, heterociclilo opcionalmente sustituido o  $R^{13}$  y  $R^{14}$  junto con el átomo de N al cual están unidos forman un grupo  $-N=C(R^{16})-$   $NR^{17}R^{18}$  o  $R^{13}$  y  $R^{14}$  junto con el átomo de N al cual están unidos forman un anillo heterocíclico de cinco, seis o siete miembros que puede contener uno o dos heteroátomos adicionales seleccionados entre O, N o S y que puede estar opcionalmente sustituido con uno o dos grupos  
 15 alquilo  $C_{1-6}$ ;  $R^{15}$  es H, alquilo opcionalmente sustituido, alcoxi opcionalmente sustituido, arilo opcionalmente sustituido, ariloxi opcionalmente sustituido heteroarilo opcionalmente sustituido, heteroariloxi opcionalmente sustituido o  $NR^{19}R^{20}$ ,  $R^{16}$ ,  $R^{17}$  y  $R^{18}$  son cada uno independientemente H o alquilo inferior,  $R^{19}$  y  $R^{20}$  son independientemente alquilo opcionalmente sustituido, arilo opcionalmente sustituido o heteroarilo opcionalmente sustituido;

20  $R^2$  es H, hidroxí, alcoxi opcionalmente sustituido o alquilo opcionalmente sustituido, o  $R^1$  y  $R^2$  junto con los grupos Y y N forman un anillo heterocíclico de cinco o seis miembros que puede contener opcionalmente un heteroátomo adicional seleccionado entre O, N o S y que puede estar opcionalmente sustituido con alquilo  $C_{1-4}$ , haloalquilo  $C_{1-4}$  o halógeno;

$R^3$  es H, OH, halógeno o alquilo opcionalmente sustituido;

25  $R^{3a}$  es H o  $R^3$  y  $R^{3a}$  juntos forman un enlace,

cada  $R^4$  es independientemente halógeno, nitro, ciano, alquilo  $C_{1-6}$  opcionalmente sustituido, alquenilo  $C_{2-6}$  opcionalmente sustituido, alquinilo  $C_{2-6}$  opcionalmente sustituido, alcoxicarbonilo opcionalmente sustituido, alquilcarbonilo opcionalmente sustituido, alquilaminocarbonilo opcionalmente sustituido, dialquilaminocarbonilo opcionalmente sustituido, cicloalquilo  $C_{3-7}$  opcionalmente sustituido, arilo opcionalmente sustituido, heteroarilo

30

opcionalmente sustituido, heterociclilo opcionalmente sustituido, alcoxi opcionalmente sustituido, ariloxi opcionalmente sustituido, heteroariloxi opcionalmente sustituido, alquiltio opcionalmente sustituido o  $R^{21}R^{22}N$  donde  $R^{21}$  y  $R^{22}$  son, independientemente, hidrógeno, alquilo  $C_{1-6}$ , cicloalquilo  $C_{3-7}$ , alquenilo  $C_{3-6}$ , alquinilo  $C_{3-6}$ , cicloalquil( $C_{3-7}$ )alquilo( $C_{1-4}$ ), haloalquilo  $C_{2-6}$ , alcoxi( $C_{1-6}$ )alquilo( $C_{1-6}$ ), alcoxi( $C_{1-6}$ )carbonilo o  $R^{21}$  y  $R^{22}$  junto con el átomo de N al cual están unidos forman un anillo heterocíclico de cinco, seis o siete miembros que puede contener uno o dos heteroátomos adicionales seleccionados entre O, N o S y que puede estar opcionalmente sustituido con uno o dos grupos alquilo  $C_{1-6}$ , o dos grupos adyacentes  $R^4$  junto con los átomos de carbono a los cuales están unidos forman un anillo heterocíclico o carbocíclico de cuatro, cinco, seis o siete miembros que puede estar opcionalmente sustituido con halógeno; n es 0, 1, 2, 3 o 4;

$R^6$  es alquilo opcionalmente sustituido, alquenilo opcionalmente sustituido, alquinilo opcionalmente sustituido, cicloalquilo opcionalmente sustituido, anilo opcionalmente sustituido, alcoxi opcionalmente sustituido, ariloxi opcionalmente sustituido, alcoxicarbonilo opcionalmente sustituido, alquilcarbonilo opcionalmente sustituido o alquenilcarbonilo opcionalmente sustituido;

cada  $R_a$  es independientemente halógeno, hidroxilo, ciano, alquilo  $C_{1-6}$  opcionalmente sustituido, alquenilo  $C_{2-6}$  opcionalmente sustituido, alquinilo  $C_{2-6}$  opcionalmente sustituido, alcoxicarbonilo opcionalmente sustituido, alquilcarbonilo opcionalmente sustituido, alquilaminocarbonilo opcionalmente sustituido, dialquilaminocarbonilo opcionalmente sustituido, cicloalquilo  $C_{3-7}$  opcionalmente sustituido, anilo opcionalmente sustituido, heteroarilo opcionalmente sustituido, heterociclilo opcionalmente sustituido, alcoxi opcionalmente sustituido, ariloxi opcionalmente sustituido, heteroariloxi opcionalmente sustituido, alquiltio opcionalmente sustituido, ariltio opcionalmente sustituido o  $R^{23}R^{24}N$  donde  $R^{23}$  y  $R^{24}$  son, independientemente, hidrógeno, alquilo  $C_{1-6}$ , cicloalquilo  $C_{3-7}$ , alquenilo  $C_{3-6}$ , alquinilo  $C_{3-6}$ , cicloalquil( $C_{3-7}$ )alquilo( $C_{1-4}$ ), haloalquilo  $C_{2-6}$ , alcoxi( $C_{1-6}$ )alquilo( $C_{1-6}$ ), alcoxi( $C_{1-6}$ )carbonilo o  $R^{23}$  y  $R^{24}$  junto con el átomo de N al cual están unidos forman un anillo heterocíclico de cinco, seis o siete miembros que puede contener uno o dos heteroátomos adicionales seleccionados entre O, N o S y que puede estar opcionalmente sustituido con uno o dos grupos alquilo  $C_{1-6}$ , o dos grupos  $R_a$  ligados al mismo átomo de carbono son  $=O$ ,  $=S$ ,  $=NR^b$ ,  $=CR^cR^d$  donde  $R^b$ ,  $R^c$  y  $R^d$

son independientemente H o alquilo opcionalmente sustituido; p es 0, 1, 2, 3 o 4 o sales o N-óxidos de los mismos.

Los compuestos de Fórmula (I) pueden existir en diferentes isómeros ópticos o geométricos o formas tautoméricas. Esta invención protege todos esos isómeros y tautómeros y mezclas de los mismos en todas las proporciones así como las formas isotópicas tales como los compuestos deuterados

Cada porción alquilo ya sea sola o como parte de un grupo mayor (tal como alcoxi, alcoxicarbonilo, alquilcarbonilo, alquilaminocarbonilo, dialquilaminocarbonilo) es una cadena recta o ramificada y es, por ejemplo, metilo, etilo, n-propilo, n-butilo, n-pentilo, n-hexilo, isopropilo, n-butilo, sec-butilo, iso-butilo, tert-butilo o neo-pentilo. Los grupos alquilo son preferiblemente grupos alquilo C<sub>1</sub> a C<sub>12</sub>, pero preferiblemente son grupos alquilo C<sub>1</sub>-C<sub>10</sub>, más preferiblemente C<sub>1</sub>-C<sub>8</sub>, mucho más preferiblemente C<sub>1</sub>-C<sub>6</sub> y todavía más preferiblemente C<sub>1</sub>-C<sub>4</sub>

Cuando están presentes, los sustituyentes opcionales en una porción alquilo (solos o como parte de un grupo mayor tal como alcoxi, alcoxicarbonilo, alquilcarbonilo, alquilaminocarbonilo, dialquilaminocarbonilo) incluyen uno o más de halógeno, nitro, ciano, NCS-, cicloalquilo C<sub>3-7</sub> (él mismo opcionalmente sustituido con alquilo C<sub>1-8</sub> o halógeno), cicloalquenilo C<sub>5-7</sub> (él mismo opcionalmente sustituido con alquilo C<sub>1-8</sub> o halógeno), hidroxi, alcoxi C<sub>1-10</sub>, alcoxi(C<sub>1-10</sub>)alcoxi(C<sub>1-10</sub>), trialquil(C<sub>1-4</sub>)sililalcoxi(C<sub>1-8</sub>), alcoxi(C<sub>1-8</sub>)carbonilalcoxi(C<sub>1-10</sub>), haloalcoxi C<sub>1-10</sub>, arilalcoxi C<sub>1-4</sub> (donde el grupo arilo está opcionalmente sustituido), cicloalquiloxi C<sub>3-7</sub> (donde el grupo cicloalquilo está opcionalmente sustituido con alquilo C<sub>1-8</sub> o halógeno), alqueniloxi C<sub>2-10</sub>, alquililoxi C<sub>2-10</sub>, SH, alquiltio C<sub>1-10</sub>, haloalquiltio C<sub>1-10</sub>, arilalquiltio C<sub>1-4</sub> (donde el grupo arilo está opcionalmente sustituido), cicloalquiltio C<sub>3-7</sub> (donde el grupo cicloalquilo está opcionalmente sustituido con alquilo C<sub>1-8</sub> o halógeno), trialquil(C<sub>1-4</sub>)sililalquiltio(C<sub>1-8</sub>), ariltio (donde el grupo arilo está opcionalmente sustituido), alquil(C<sub>1-8</sub>)sulfonilo, haloalquil(C<sub>1-8</sub>)sulfonilo, alquil(C<sub>1-8</sub>)sulfinilo, haloalquil(C<sub>1-8</sub>)sulfinilo, arilsulfonilo (donde el grupo arilo puede estar opcionalmente sustituido), trialquil(C<sub>1-4</sub>)sililo, arildialquil(C<sub>1-4</sub>)sililo, alquil(C<sub>1-4</sub>)diarilsililo, triarilsililo, alquil(C<sub>1-10</sub>)carbonilo, HO<sub>2</sub>C, alcoxi(C<sub>1-10</sub>)carbonilo, aminocarbonilo, alquil(C<sub>1-8</sub>)aminocarbonilo, di(alquilo C<sub>1-8</sub>)aminocarbonilo, N-(alquilo C<sub>1-3</sub>)-N-(alcoxi C<sub>1-3</sub>)aminocarbonilo, alquil(C<sub>1-8</sub>)carboniloxi, arilcarboniloxi (donde el grupo arilo está opcionalmente sustituido), dialquil(C<sub>1-8</sub>)aminocarboniloxi, oximas tales como =NOalquilo, =NOhaloalquilo y =NOarilo (él

mismo opcionalmente sustituido), arilo (él mismo opcionalmente sustituido), heteroarilo (él mismo opcionalmente sustituido), heterocíclico (él mismo opcionalmente sustituido con alquilo  $C_{1-6}$  o halógeno), arilo (donde el grupo arilo está opcionalmente sustituido), heteroarilo (donde el grupo heteroarilo está opcionalmente sustituido), heterocíclico (donde el grupo heterocíclico está opcionalmente sustituido con alquilo  $C_{1-6}$  o halógeno), amino, alquil( $C_{1-6}$ )amino, dialquil( $C_{1-6}$ )amino, alquil( $C_{1-6}$ )carbonilamino, N-alquil( $C_{1-6}$ )carbonil-N-alquil( $C_{1-6}$ )amino, alquénil( $C_{2-6}$ )carbonilo, alquínil( $C_{2-6}$ )carbonilo, alquénilo( $C_{3-6}$ )carbonilo, alquínilo( $C_{3-6}$ )carbonilo, ariloxycarbonilo (donde el grupo arilo está opcionalmente sustituido) y arilcarbonilo (donde el grupo arilo está opcionalmente sustituido).

Las porciones alquénilo y alquínilo pueden estar en forma de cadenas rectas o ramificadas, y las porciones alquénilo, cuando corresponda, pueden ser de configuración (E) o bien (Z). Ejemplos son vinilo, alilo y propargilo

Cuando están presentes, los sustituyentes opcionales en alquénilo o alquínilo incluyen aquellos sustituyentes opcionales indicados más arriba para una porción alquilo

En el contexto de esta memoria, acilo es alquil( $C_{1-6}$ )carbonilo opcionalmente sustituido (por ejemplo acetilo), alquénil( $C_{2-6}$ )carbonilo opcionalmente sustituido, alquínil( $C_{2-6}$ )carbonilo opcionalmente sustituido, arilcarbonilo opcionalmente sustituido (por ejemplo benzilo) o heteroarilcarbonilo opcionalmente sustituido

Halógeno es flúor, cloro, bromo o yodo

Los grupos haloalquilo son grupos alquilo que están sustituidos con uno o más átomos de halógeno iguales o diferentes y son, por ejemplo,  $CF_3$ ,  $CF_2Cl$ ,  $CF_3CH_2$  o  $CHF_2CH_2$

En el contexto de la presente memoria, los términos "arilo", "anillo aromático" y "sistema anular aromático" se refieren a sistemas anulares que pueden ser mono-, bi- o tricíclicos. Ejemplos de tales anillos incluyen fenilo, naftalenilo, antraceno, indenilo o fenantreno. Un grupo arilo preferido es fenilo. Además, los términos "heteroarilo", "anillo heteroaromático" o "sistema anular heteroaromático" se refieren a un sistema anular aromático que contiene por lo menos un heteroátomo y está formado por un anillo simple o por dos o más anillos fusionados. Preferiblemente, los anillos simples están formados por hasta tres y los sistemas bicíclicos por hasta cuatro heteroátomos que se eligen preferiblemente entre nitrógeno, oxígeno y azufre. Ejemplos de tales grupos incluyen furilo, tienilo, pirrolilo, pirazolilo, imidazolilo, 1,2,3-triazolilo,

1,2,4-triazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, 1,2,3-oxadiazolilo, 1,2,4-oxadiazolilo, 1,3,4-oxadiazolilo, 1,2,5-oxadiazolilo, 1,2,3-tiadiazolilo, 1,2,4-tiadiazolilo, 1,3,4-tiadiazolilo, 1,2,5-tiadiazolilo, piridilo, pirimidinilo, piridazinilo, pirazinilo, 1,2,3-triazinilo, 1,2,4-triazinilo, 1,3,5-triazinilo, benzofurilo, bencisofurilo, benzotienilo, bencisotienilo, indolilo, isoindolilo, indazolilo, benzotiazolilo, bencisotiazolilo, benzoxazolilo, bencisoxazolilo, bencimidazolilo, 2,1,3-benzoxadiazol quinolinilo, isoquinolinilo, cinnolinilo, ftalazinilo, quinazolinilo, quinoxalinilo, naftiridinilo, benzotriazinilo, purinilo, pteridinilo e indolizínilo. Ejemplos preferidos de radicales heteroaromáticos incluyen piridilo, pirimidilo, triazinilo, tienilo, furilo, oxazolilo, isoxazolilo, 2,1,3-benzoxadiazol y tiazolilo.

Los términos heterociclo y heterociclilo se refieren a un anillo no aromático que contiene hasta 10 átomos incluyendo uno o más (preferiblemente uno o dos) heteroátomos seleccionados entre O, S y N. Ejemplos de tales anillos incluyen 1,3-dioxolano, tetrahydrofurano y morfolina.

Cuando están presentes, los sustituyentes opcionales en heterociclilo incluyen alquilo  $C_{1-6}$  y haloalquilo  $C_{1-6}$  así como aquellos sustituyentes opcionales indicados más arriba para una porción alquilo.

Cicloalquilo incluye ciclopropilo, ciclopentilo y ciclohexilo.

Cicloalquenilo incluye ciclopentenilo y ciclohexenilo.

Cuando están presentes, los sustituyentes opcionales en cicloalquilo o cicloalquenilo incluyen alquilo  $C_{1-3}$  así como aquellos sustituyentes opcionales indicados más arriba para una porción alquilo.

Los anillos carbocíclicos incluyen grupos arilo, cicloalquilo y cicloalquenilo.

Cuando están presentes, los sustituyentes opcionales en anillo o heteroarilo son seleccionados independientemente entre halógeno, nitro, ciano, NCS-, alquilo  $C_{1-6}$ , haloalquilo  $C_{1-6}$ , alcoxi( $C_{1-6}$ )alquilo( $C_{1-6}$ ), alquenilo  $C_{2-6}$ , haloalquenilo  $C_{2-6}$ , alquinilo  $C_{2-6}$ , cicloalquilo  $C_{3-7}$  (él mismo opcionalmente sustituido con alquilo  $C_{1-6}$  o halógeno), cicloalquenilo  $C_{5-7}$  (él mismo opcionalmente sustituido con alquilo  $C_{1-6}$  o halógeno), hidroxilo, alcoxi  $C_{1-10}$ , alcoxi( $C_{1-10}$ )alcoxi( $C_{1-10}$ ), trialkil( $C_{1-4}$ )silaalcoxi( $C_{1-6}$ ), alcoxi( $C_{1-6}$ )carbonilalcoxi( $C_{1-10}$ ), haloalcoxi  $C_{1-10}$ , anilalcoxi  $C_{1-4}$  (donde el grupo arilo está opcionalmente sustituido con halógeno o alquilo  $C_{1-6}$ ), cicloalquiloxi  $C_{3-7}$  (donde el grupo cicloalquilo está opcionalmente sustituido con alquilo  $C_{1-6}$  o halógeno),

alqueniloxi C<sub>2-10</sub>, alquiniloxi C<sub>2-10</sub>, SH, alquiltio C<sub>1-10</sub>, haloalquiltio C<sub>1-10</sub>, arilalquiltio(C<sub>1-4</sub>)cicloalquiltio(C<sub>3-7</sub>) (donde el grupo cicloalquilo está opcionalmente sustituido con alquilo C<sub>1-6</sub> o halógeno), trialquil(C<sub>1-4</sub>)sililalquiltio(C<sub>1-6</sub>), ariltio, alquil(C<sub>1-6</sub>)sulfonilo, haloalquil(C<sub>1-6</sub>)sulfonilo, alquil(C<sub>1-6</sub>)sulfinilo, haloalquil(C<sub>1-6</sub>)sulfinilo, arilsulfonilo, trialquil(C<sub>1-4</sub>)sililo, arildialquil(C<sub>1-4</sub>)sililo, alquil(C<sub>1-4</sub>)diarilsililo, triarilsililo, alquil(C<sub>1-10</sub>)carbonilo, HO<sub>2</sub>C, alcoxi(C<sub>1-10</sub>)carbonilo, aminocarbonilo, alquil(C<sub>1-6</sub>)aminocarbonilo, di(alquilo C<sub>1-6</sub>)-aminocarbonilo, N-(alquilo C<sub>1-3</sub>)-N-(alcoxi C<sub>1-3</sub>)aminocarbonilo, alquil(C<sub>1-6</sub>)carboniloxi, arilcarboniloxi, dialquil(C<sub>1-6</sub>)aminocarboniloxi, arilo (él mismo opcionalmente sustituido con alquilo C<sub>1-6</sub> o halógeno), heteroarilo (él mismo opcionalmente sustituido con alquilo C<sub>1-6</sub> o halógeno), heterociclilo (él mismo opcionalmente sustituido con alquilo C<sub>1-6</sub> o halógeno), ariloxi (donde el grupo arilo está opcionalmente sustituido con alquilo C<sub>1-6</sub> o halógeno), heteroariloxi (donde el grupo heteroarilo está opcionalmente sustituido con alquilo C<sub>1-6</sub> o halógeno), heterocicliloxi (donde el grupo heterociclilo está opcionalmente sustituido con alquilo C<sub>1-6</sub> o halógeno), amino, alquil(C<sub>1-6</sub>)amino, dialquil(C<sub>1-6</sub>)amino, alquil(C<sub>1-6</sub>)carbonilamino, N-alquil(C<sub>1-6</sub>)carbonil-N-alquil(C<sub>1-6</sub>)amino, arilcarbonilo, (donde el grupo arilo está él mismo opcionalmente sustituido con halógeno o alquilo C<sub>1-6</sub>) o dos posiciones adyacentes en un sistema arilo o heteroarilo pueden estar ciclizadas para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de cinco, seis o siete miembros, él mismo opcionalmente sustituido con halógeno o alquilo C<sub>1-6</sub>. Otros sustituyentes para arilo o heteroarilo incluyen arilcarbonilamino (donde el grupo arilo está sustituido con alquilo C<sub>1-6</sub> o halógeno), alquiloxi(C<sub>1-6</sub>)carbonilaminoalquiloxi(C<sub>1-6</sub>)carbonil-N-alquil(C<sub>1-6</sub>)amino, ariloxicarbonilamino (donde el grupo arilo está sustituido con alquilo C<sub>1-6</sub> o halógeno), ariloxicarbonil-N-alquil(C<sub>1-6</sub>)amino, (donde el grupo arilo está sustituido con alquilo C<sub>1-6</sub> o halógeno), arilsulfonilamino (donde el grupo arilo está sustituido con alquilo C<sub>1-6</sub> o halógeno), arilsulfonil-N-alquil(C<sub>1-6</sub>)amino (donde el grupo arilo está sustituido con alquilo C<sub>1-6</sub> o halógeno), aril-N-alquil(C<sub>1-6</sub>)amino (donde el grupo arilo está sustituido con alquilo C<sub>1-6</sub> o halógeno), arilamino (donde el grupo arilo está sustituido con alquilo C<sub>1-6</sub> o halógeno), heteroarilamino (donde el grupo heteroarilo está sustituido con alquilo C<sub>1-6</sub> o halógeno), heterociclilamino (donde el grupo heterociclilo está sustituido con alquilo C<sub>1-6</sub> o halógeno), aminocarbonilamino, alquil(C<sub>1-6</sub>)aminocarbonilamino, dialquil(C<sub>1-6</sub>)aminocarbonilamino, arilaminocarbonilamino (donde el grupo arilo está sustituido con alquilo C<sub>1-6</sub> o halógeno), aril-N-alquil(C<sub>1-6</sub>)aminocarbonilamino

(donde el grupo arilo está sustituido con alquilo C<sub>1-6</sub> o halógeno), alquil(C<sub>1-6</sub>)aminocarbonil-N-alquil(C<sub>1-6</sub>)amino, dialquil(C<sub>1-6</sub>)aminocarbonil-N-alquil(C<sub>1-6</sub>)amino, arilaminocarbonil-N-alquil(C<sub>1-6</sub>)amino (donde el grupo arilo está sustituido con alquilo C<sub>1-6</sub> o halógeno) y anil-N-alquil(C<sub>1-6</sub>)aminocarbonil-N-alquil(C<sub>1-6</sub>)amino (donde el grupo arilo está sustituido con alquilo C<sub>1-6</sub> o halógeno)

Para las porciones fenilo, los grupos heterociclilo y heteroarilo sustituidos se prefiere que uno o más sustituyentes se seleccionen independientemente entre halógeno, alquilo C<sub>1-6</sub>, haloalquilo C<sub>1-6</sub>, alcoxi(C<sub>1-6</sub>)alquilo(C<sub>1-6</sub>), alcoxi C<sub>1-6</sub>, haloalcoxi C<sub>1-6</sub>, alquiltio C<sub>1-6</sub>, haloalquiltio C<sub>1-6</sub>, alquil(C<sub>1-6</sub>)sulfinilo, haloalquil(C<sub>1-6</sub>)sulfinilo, alquil(C<sub>1-6</sub>)sulfonilo, haloalquil(C<sub>1-6</sub>)sulfonilo, alquenilo C<sub>2-6</sub>, haloalquenilo C<sub>2-6</sub>, alquinilo C<sub>2-6</sub>, cicloalquilo C<sub>3-7</sub>, nitro, ciano, CO<sub>2</sub>H, alquil(C<sub>1-6</sub>)carbonilo, alcoxi(C<sub>1-6</sub>)carbonilo, R<sup>25</sup>R<sup>26</sup>N o R<sup>27</sup>R<sup>28</sup>NC(O), donde R<sup>25</sup>, R<sup>26</sup>, R<sup>27</sup> y R<sup>28</sup> son, independientemente, hidrógeno o alquilo C<sub>1-6</sub>. Otros sustituyentes preferidos son los grupos arilo y heteroarilo.

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

Debe entenderse que los sustituyentes dialquilamino incluyen aquellos donde los grupos dialquilo junto con el átomo de N al cual están unidos forman un anillo heterocíclico de cinco, seis o siete miembros que puede contener uno o dos heteroátomos adicionales seleccionados entre O, N o S y que está opcionalmente sustituido con uno o dos grupos alquilo C<sub>1-6</sub> independientemente seleccionados. Cuando los anillos heterocíclicos están formados por la unión de dos grupos en un átomo de N, los anillos resultantes son preferiblemente pirrolidina, piperidina, tiomorfolina y morfolina cada uno de los cuales puede estar sustituido con uno o dos grupos alquilo (C<sub>1-6</sub>) independientemente seleccionados.

Preferiblemente los sustituyentes opcionales en una porción alquilo incluyen uno o más de halógeno, nitro, ciano, HO<sub>2</sub>C, alcoxi C<sub>1-10</sub> (él mismo opcionalmente sustituido con alcoxi C<sub>1-10</sub>), anilalcoxi C<sub>1-4</sub>, alquiltio C<sub>1-10</sub>, alquil(C<sub>1-10</sub>)carbonilo, alcoxi(C<sub>1-10</sub>)carbonilo, alquil(C<sub>1-6</sub>)aminocarbonilo, di(alquilo C<sub>1-6</sub>)aminocarbonilo, alquil(C<sub>1-6</sub>)carboniloxi, fenilo opcionalmente sustituido, heteroarilo, ariloxi, anilcarboniloxi, heteroariloxi, heterociclilo, heterocicliloxi, cicloalquilo C<sub>3-7</sub> (él mismo opcionalmente sustituido con alquilo C<sub>1-6</sub> o halógeno), cicloalquiloxi

C<sub>3-7</sub>, cicloalquenilo C<sub>5-7</sub>, alquil(C<sub>1-6</sub>)sulfonilo, alquil(C<sub>1-6</sub>)sulfinilo, trialquil(C<sub>1-4</sub>)sililo, trialquil(C<sub>1-4</sub>)sililalcoxi(C<sub>1-6</sub>), anidialquil(C<sub>1-4</sub>)sililo, alquil(C<sub>1-4</sub>)dianilsililo y trianilsililo

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

5 Un sustituyente opcional preferido para heterociclilo es alquilo C<sub>1-6</sub>

Preferiblemente los sustituyentes opcionales para cicloalquilo incluyen halógeno, ciano y alquilo C<sub>1-3</sub>

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

10 Los grupos preferidos para T, Y, Ra, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>3a</sup>, R<sup>4</sup> y R<sup>8</sup> en cualquier combinación de los mismos se indican a continuación

Preferiblemente Y es un enlace simple, C=O o C=S

Más preferiblemente Y es un enlace simple o C=O.

Todavía más preferiblemente Y es C=O

15 Preferiblemente R<sup>1</sup> es hidrógeno, alquilo C<sub>1-6</sub>, cianoalquilo C<sub>1-6</sub>, haloalquilo C<sub>1-6</sub>, cicloalquil(C<sub>3-7</sub>)alquilo(C<sub>1-4</sub>), alcoxi(C<sub>1-6</sub>)alquilo(C<sub>1-6</sub>), heteroarilalquilo C<sub>1-6</sub> (donde el grupo heteroarilo puede estar opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, alquilo C<sub>1-6</sub>, haloalquilo C<sub>1-6</sub>, alcoxi C<sub>1-6</sub>, haloalcoxi C<sub>1-6</sub>, alquil(C<sub>1-6</sub>)sulfonilo, alquil(C<sub>1-6</sub>)sulfinilo, alquiltio C<sub>1-6</sub>, alcoxi(C<sub>1-6</sub>)carbonilo, alquil(C<sub>1-6</sub>)carbonilamino, arilcarbonilo, o dos posiciones adyacentes en el sistema heteroarilo pueden estar ciclizadas para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de cinco, seis o siete miembros, él mismo opcionalmente sustituido con halógeno), arilalquilo C<sub>1-6</sub> (donde el grupo arilo puede estar opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, alquilo C<sub>1-6</sub>, haloalquilo C<sub>1-6</sub>, alcoxi C<sub>1-6</sub>, haloalcoxi C<sub>1-6</sub>, alquil(C<sub>1-6</sub>)sulfonilo, alquil(C<sub>1-6</sub>)sulfinilo, alquiltio C<sub>1-6</sub>, alcoxi(C<sub>1-6</sub>)carbonilo, alquil(C<sub>1-6</sub>)carbonilamino, arilcarbonilo, o dos posiciones adyacentes en el sistema arilo pueden estar ciclizadas para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de cinco, seis o siete miembros, él mismo opcionalmente sustituido con halógeno), alquil(C<sub>1-6</sub>)carbonilaminoalquilo(C<sub>1-6</sub>), arilo (que puede estar opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, alquilo C<sub>1-6</sub>, haloalquilo C<sub>1-6</sub>, alcoxi C<sub>1-6</sub>, haloalcoxi C<sub>1-6</sub>, alquil(C<sub>1-6</sub>)sulfonilo, alquil(C<sub>1-6</sub>)sulfinilo, alquiltio C<sub>1-6</sub>, alcoxi(C<sub>1-6</sub>)carbonilo, alquil(C<sub>1-6</sub>)carbonilamino, arilcarbonilo, o dos posiciones adyacentes en el sistema arilo pueden estar ciclizadas para formar un anillo

20

25

30

carbocíclico o heterocíclico de cinco, seis o siete miembros, él mismo opcionalmente sustituido con halógeno), heteroarilo (que puede estar opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, alquilo C<sub>1-6</sub>, haloalquilo C<sub>1-6</sub>, alcoxi C<sub>1-6</sub>, haloalcoxi C<sub>1-6</sub>, alquil(C<sub>1-6</sub>)sulfonilo, alquil(C<sub>1-6</sub>)sulfinilo, alquiltio C<sub>1-6</sub>, alcoxi(C<sub>1-6</sub>)carbonilo, alquil(C<sub>1-6</sub>)carbonilamino, arilcarbonilo, o dos posiciones adyacentes en el sistema heteroarilo pueden estar ciclizadas para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de cinco, seis o siete miembros, él mismo opcionalmente sustituido con halógeno), alcoxi C<sub>1-6</sub>, haloalcoxi C<sub>1-6</sub>, fenoxi (donde el grupo fenilo está opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo C<sub>1-4</sub>, alcoxi C<sub>1-4</sub>, haloalquilo C<sub>1-4</sub>, haloalcoxi C<sub>1-4</sub>, CN, NO<sub>2</sub>, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino), heteroariloxi (opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, alquilo C<sub>1-6</sub>, haloalquilo C<sub>1-6</sub>, alcoxi C<sub>1-6</sub> o haloalcoxi C<sub>1-6</sub>), heterocicliloxi (opcionalmente sustituido con halo, alquilo C<sub>1-6</sub>, haloalquilo C<sub>1-6</sub>, alcoxi C<sub>1-6</sub> o haloalcoxi C<sub>1-6</sub>), ciano, alquenilo C<sub>2-6</sub>, alquinilo C<sub>2-6</sub>, cicloalquilo C<sub>3-6</sub>, cicloalquenilo C<sub>5-7</sub>, heterociclilo (opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, alquilo C<sub>1-6</sub>, haloalquilo C<sub>1-6</sub>, alcoxi C<sub>1-6</sub> o haloalcoxi C<sub>1-6</sub>), alquiltio C<sub>1-6</sub>, haloalquiltio C<sub>1-6</sub> o NR<sup>13</sup>R<sup>14</sup> donde R<sup>13</sup> y R<sup>14</sup> son independientemente hidrógeno, alquilo C<sub>1-6</sub>, haloalquilo C<sub>1-6</sub>, alcoxi(C<sub>1-6</sub>)alquilo(C<sub>1-6</sub>), fenilo (que puede estar opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo C<sub>1-4</sub>, alcoxi C<sub>1-4</sub>, haloalquilo C<sub>1-4</sub>, haloalcoxi C<sub>1-4</sub>, CN, NO<sub>2</sub>, arilo, heteroarilo, amino, dialquilamino o alcoxi(C<sub>1-4</sub>)carbonilo), fenilalquilo C<sub>1-6</sub> (donde el grupo fenilo puede estar opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo C<sub>1-4</sub>, alcoxi C<sub>1-4</sub>, haloalquilo C<sub>1-4</sub>, haloalcoxi C<sub>1-4</sub>, CN, NO<sub>2</sub>, arilo, heteroarilo, amino, dialquilamino, alquil(C<sub>1-6</sub>)sulfonilo, alcoxi(C<sub>1-6</sub>)carbonilo, o dos posiciones adyacentes en el anillo fenilo pueden estar ciclizadas para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de cinco, seis o siete miembros, él mismo opcionalmente sustituido con halógeno), heteroarilalquilo C<sub>1-6</sub> (donde el grupo heteroarilo puede estar opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, alquilo C<sub>1-6</sub>, haloalquilo C<sub>1-6</sub>, alcoxi C<sub>1-6</sub>, haloalcoxi C<sub>1-6</sub>, alquil(C<sub>1-6</sub>)sulfonilo, alquil(C<sub>1-6</sub>)sulfinilo, alquiltio C<sub>1-6</sub>, alcoxi(C<sub>1-6</sub>)carbonilo, alquil(C<sub>1-6</sub>)carbonilamino, arilcarbonilo, o dos posiciones adyacentes en el sistema heteroarilo pueden estar ciclizadas para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de cinco, seis o siete miembros, él mismo opcionalmente sustituido con halógeno) o heteroarilo (que puede estar opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, alquilo C<sub>1-6</sub>, haloalquilo C<sub>1-6</sub>, alcoxi C<sub>1-6</sub> o haloalcoxi C<sub>1-6</sub>, alcoxi(C<sub>1-4</sub>)carbonilalquil(C<sub>1-6</sub>)carbonilamino, feniloxycarbonilamino (donde el grupo fenilo está opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo C<sub>1-4</sub>, alcoxi C<sub>1-4</sub>, haloalquilo C<sub>1-</sub>

4, haloalcoxi C<sub>1-4</sub>, CN, NO<sub>2</sub>, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino), amino, alquil(C<sub>1-6</sub>)amino o fenilamino (donde el grupo fenilo está opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo C<sub>1-4</sub>, alcoxi C<sub>1-4</sub>, haloalquilo C<sub>1-4</sub>, haloalcoxi C<sub>1-4</sub>, CN, NO<sub>2</sub>, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino)).

Más preferiblemente R<sup>1</sup> es alquilo C<sub>1-6</sub>, haloalquilo C<sub>1-6</sub>, alcoxi(C<sub>1-6</sub>)alquilo(C<sub>1-6</sub>), heteroarilalquilo C<sub>1-3</sub> (donde el grupo heteroarilo puede estar opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, alquilo C<sub>1-6</sub>, haloalquilo C<sub>1-6</sub>, alcoxi C<sub>1-6</sub>, haloalcoxi C<sub>1-6</sub>, alquil(C<sub>1-6</sub>)sulfonilo, alcoxi(C<sub>1-6</sub>)carbonilo, o dos posiciones adyacentes en el sistema heteroarilo pueden estar ciclizadas para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de cinco, seis o siete miembros, él mismo opcionalmente sustituido con halógeno), fenilalquilo C<sub>1-3</sub> (donde el grupo fenilo puede estar opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo C<sub>1-4</sub>, alcoxi C<sub>1-4</sub>, haloalquilo C<sub>1-4</sub>, haloalcoxi C<sub>1-4</sub>, CN, NO<sub>2</sub>, arilo, heteroarilo, amino, dialquilamino, alquil(C<sub>1-6</sub>)sulfonilo, alcoxi(C<sub>1-6</sub>)carbonilo, o dos posiciones adyacentes en el anillo fenilo pueden estar ciclizadas para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de cinco, seis o siete miembros, él mismo opcionalmente sustituido con halógeno), fenilo (que puede estar opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo C<sub>1-4</sub>, alcoxi C<sub>1-4</sub>, haloalquilo C<sub>1-4</sub>, haloalcoxi C<sub>1-4</sub>, CN, NO<sub>2</sub>, arilo, heteroarilo, amino, dialquilamino, alquil(C<sub>1-6</sub>)sulfonilo, alcoxi(C<sub>1-6</sub>)carbonilo, o dos posiciones adyacentes en el anillo fenilo pueden estar ciclizadas para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de cinco, seis o siete miembros, él mismo opcionalmente sustituido con halógeno), heteroarilo (que puede estar opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, alquilo C<sub>1-6</sub>, haloalquilo C<sub>1-6</sub>, alcoxi C<sub>1-6</sub>, haloalcoxi C<sub>1-6</sub>, alquil(C<sub>1-6</sub>)sulfonilo, alcoxi(C<sub>1-6</sub>)carbonilo, o dos posiciones adyacentes en el sistema heteroarilo pueden estar ciclizadas para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de cinco, seis o siete miembros, él mismo opcionalmente sustituido con halógeno), alcoxi C<sub>1-6</sub>, haloalcoxi C<sub>1-6</sub>, alqueno C<sub>2-6</sub>, heterociclilo (opcionalmente sustituido con halo, ciano, alquilo C<sub>1-6</sub>, haloalquilo C<sub>1-6</sub>, alcoxi C<sub>1-6</sub> o haloalcoxi C<sub>1-6</sub>), alquiltio C<sub>1-6</sub>, haloalquiltio C<sub>1-6</sub> o NR<sup>13</sup>R<sup>14</sup> donde R<sup>13</sup> y R<sup>14</sup> son independientemente hidrógeno, alquilo C<sub>1-6</sub> o haloalquilo C<sub>1-6</sub>, alcoxi(C<sub>1-6</sub>)alquilo(C<sub>1-6</sub>), alquil(C<sub>2-6</sub>)carbonilo, fenilcarbonilo, (donde el fenilo está opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo C<sub>1-4</sub>, alcoxi C<sub>1-4</sub>, haloalquilo C<sub>1-4</sub>, haloalcoxi C<sub>1-4</sub>, CN, NO<sub>2</sub>, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino), fenilalquilo C<sub>1-3</sub> (donde el grupo fenilo puede estar opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo C<sub>1-4</sub>, alcoxi C<sub>1-4</sub>, haloalquilo C<sub>1-4</sub>, haloalcoxi C<sub>1-4</sub>, CN, NO<sub>2</sub>, arilo, heteroarilo, amino, dialquilamino, alquil(C<sub>1-6</sub>)sulfonilo, alcoxi(C<sub>1-6</sub>)carbonilo, o dos

posiciones adyacentes en el anillo fenilo pueden estar ciclizadas para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de cinco, seis o siete miembros, él mismo opcionalmente sustituido con halógeno) o heteroarilalquilo  $C_{1-3}$  (donde el grupo heteroarilo puede estar opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, alquilo  $C_{1-6}$ , haloalquilo  $C_{1-6}$ , alcoxi  $C_{1-6}$ , haloalcoxi  $C_{1-6}$ , alquil( $C_{1-6}$ )sulfonilo, alquil( $C_{1-6}$ )sulfinilo, alquiltio  $C_{1-6}$ , alcoxi( $C_{1-6}$ )carbonilo, alquil( $C_{1-6}$ )carbonilamino, anilcarbonilo, o dos posiciones adyacentes en el sistema heteroarilo pueden estar ciclizadas para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de cinco, seis o siete miembros, él mismo opcionalmente sustituido con halógeno).

Mucho más preferiblemente  $R^1$  es alquilo  $C_{1-6}$ , haloalquilo  $C_{1-6}$ , heteroarilalquilo  $C_{1-3}$  (donde el grupo heteroarilo puede estar opcionalmente sustituido con halo, ciano, alquilo  $C_{1-6}$ , haloalquilo  $C_{1-6}$  y donde el grupo heteroarilo es un anillo tiazol, piridina, pirimidina, pirazina o pindazina), heteroarilo (opcionalmente sustituido con halo, ciano, alquilo  $C_{1-6}$ , haloalquilo  $C_{1-6}$  y donde el grupo heteroarilo es un anillo piridina, pirimidina, 2,1,3-benzoxadiazol, pirazina o piridazina), alcoxi  $C_{1-6}$ , alcoxi( $C_{1-6}$ )alquilo( $C_{1-6}$ ), alquil( $C_{1-6}$ )amino, alquiloxi( $C_{1-6}$ )alquil( $C_{1-6}$ )amino o heteroarilalquil( $C_{1-3}$ )amino (donde el grupo heteroarilo puede estar opcionalmente sustituido con halo, ciano, alquilo  $C_{1-6}$ , haloalquilo  $C_{1-6}$  y donde el grupo heteroarilo es un grupo tiazol, piridina, pirimidina, pirazina o pindazina)

Todavía más preferiblemente  $R^1$  es piridilo (opcionalmente sustituido con halo, alquilo  $C_{1-3}$  o haloalquilo  $C_{1-3}$ ), especialmente piridilo halo-sustituido.

Se prefiere que  $R^2$  sea hidrógeno, hidroxil, alquilo  $C_{1-6}$  o haloalquilo  $C_{1-6}$

Más preferiblemente  $R^2$  es hidrógeno, alquilo  $C_{1-4}$  o haloalquilo  $C_{1-4}$

Mucho más preferiblemente  $R^2$  es hidrógeno o alquilo  $C_{1-4}$ .

Todavía más preferiblemente  $R^2$  es independientemente hidrógeno o metilo.

Todavía mucho más preferiblemente  $R^2$  es hidrógeno

Se prefiere que  $R^3$  sea hidrógeno, hidroxil, halógeno, alquilo  $C_{1-6}$  o haloalquilo  $C_{1-6}$

Más preferiblemente  $R^3$  es hidrógeno, hidroxil, halógeno, alquilo  $C_{1-4}$  o haloalquilo  $C_{1-4}$

Mucho más preferiblemente  $R^3$  es hidrógeno o alquilo  $C_{1-4}$ .

Todavía más preferiblemente  $R^3$  es independientemente hidrógeno o metilo.

Todavía mucho más preferiblemente  $R^3$  es hidrógeno

$R^{3a}$  es preferiblemente hidrógeno o  $R^3$  y  $R^{3a}$  juntos forman un doble enlace

Preferiblemente cada  $R^4$  es independientemente halógeno, ciano, alquilo  $C_{1-8}$ , haloalquilo  $C_{1-8}$ , cianoalquilo, alcoxi( $C_{1-8}$ )alquilo( $C_{1-8}$ ), cicloalquil( $C_{3-7}$ )alquilo( $C_{1-8}$ ), cicloalquenil( $C_{5-8}$ )alquilo( $C_{1-8}$ ), alqueniloxi( $C_{3-8}$ )alquilo( $C_{1-8}$ ), alquiniloxi( $C_{3-8}$ )alquilo( $C_{1-8}$ ), ariloxialquilo  $C_{1-8}$ , carboxialquilo  $C_{1-8}$ , alquil( $C_{1-8}$ )carbonilalquilo( $C_{1-8}$ ), alquenil( $C_{2-8}$ )carbonilalquilo( $C_{1-8}$ ), alquinil( $C_{2-8}$ )carbonilalquilo( $C_{1-8}$ ), alcoxi( $C_{1-8}$ )carbonilalquilo( $C_{1-8}$ ), alqueniloxi( $C_{3-8}$ )carbonilalquilo( $C_{1-8}$ ), alquiniloxi( $C_{3-8}$ )carbonilalquilo( $C_{1-8}$ ), anloxycarbonilalquilo  $C_{1-8}$ , alquiltio( $C_{1-8}$ )alquilo( $C_{1-8}$ ), alquil( $C_{1-8}$ )sulfinilalquilo( $C_{1-8}$ ), alquil( $C_{1-8}$ )sulfonilalquilo( $C_{1-8}$ ), aminocarbonilalquilo  $C_{1-8}$ , alquil( $C_{1-8}$ )aminocarbonilalquilo( $C_{1-8}$ ), dialquil( $C_{1-8}$ )aminocarbonilalquilo( $C_{1-8}$ ), fenilalquilo  $C_{1-4}$  (donde el grupo fenilo está opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo  $C_{1-4}$ , alcoxi  $C_{1-4}$ , haloalquilo  $C_{1-4}$ , haloalcoxi  $C_{1-4}$ , CN, NO<sub>2</sub>, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino), heteroarilalquilo  $C_{1-4}$  (donde el grupo heteroarilo está opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, alquilo  $C_{1-8}$ , haloalquilo  $C_{1-8}$ , alcoxi  $C_{1-8}$  o haloalcoxi  $C_{1-8}$ ), heterociclilalquilo  $C_{1-4}$  (donde el grupo heterociclilo está opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, alquilo  $C_{1-8}$ , haloalquilo  $C_{1-8}$ , alcoxi  $C_{1-8}$  o haloalcoxi  $C_{1-8}$ ), alquenilo  $C_{2-8}$ , aminocarbonilalquenilo  $C_{2-8}$ , alquil( $C_{1-8}$ )aminocarbonilalquenilo( $C_{2-8}$ ), dialquil( $C_{1-8}$ )aminocarbonilalquenilo( $C_{2-8}$ ), fenilalquenilo  $C_{2-4}$ , (donde el grupo fenilo está opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo  $C_{1-4}$ , alcoxi  $C_{1-4}$ , haloalquilo  $C_{1-4}$ , haloalcoxi  $C_{1-4}$ , CN, NO<sub>2</sub>, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino), alquinilo  $C_{2-8}$ , trimetilsililalquinilo  $C_{2-8}$ , aminocarbonilalquinilo  $C_{2-8}$ , alquil( $C_{1-8}$ )aminocarbonilalquinilo( $C_{2-8}$ ), dialquil( $C_{1-8}$ )aminocarbonilalquinilo( $C_{2-8}$ ), alcoxi( $C_{1-8}$ )carbonilo, cicloalquilo  $C_{3-7}$ , halocicloalquilo  $C_{3-7}$ , cianocicloalquilo  $C_{3-7}$ , alquil( $C_{1-3}$ )cicloalquilo( $C_{3-7}$ ), alquil( $C_{1-3}$ )halocicloalquilo( $C_{3-7}$ ), fenilo (opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo  $C_{1-4}$ , alcoxi  $C_{1-4}$ , haloalquilo  $C_{1-4}$ , haloalcoxi  $C_{1-4}$ , CN, NO<sub>2</sub>, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino), heteroarilo (opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, alquilo  $C_{1-8}$ , haloalquilo  $C_{1-8}$ , alcoxi  $C_{1-8}$  o haloalcoxi  $C_{1-8}$ ), heterociclilo (donde el grupo heterociclilo está opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, alquilo  $C_{1-8}$ , haloalquilo  $C_{1-8}$ , alcoxi  $C_{1-8}$  o haloalcoxi  $C_{1-8}$ ), o dos grupos adyacentes  $R^4$  junto con los átomos de carbono a los cuales están unidos forman un anillo carbocíclico o heterocíclico de cuatro, cinco, seis o siete miembros que puede estar opcionalmente sustituido con halógeno, alcoxi  $C_{1-8}$ , haloalcoxi  $C_{1-8}$ , fenoxi (opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, alquilo  $C_{1-8}$ , haloalquilo  $C_{1-8}$ , alcoxi  $C_{1-8}$  o haloalcoxi  $C_{1-8}$ ), heteroanloxi (opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, alquilo  $C_{1-8}$ ,

haloalquilo C<sub>1-6</sub>, alcoxí C<sub>1-6</sub> o haloalcoxí C<sub>1-6</sub>), alquiltio C<sub>1-6</sub> o R<sup>19</sup>R<sup>20</sup>N donde R<sup>19</sup> y R<sup>20</sup> son, independientemente, hidrógeno, alquilo C<sub>1-6</sub>, cicloalquilo C<sub>3-7</sub>, alquenilo C<sub>3-6</sub>, alquinilo C<sub>3-6</sub>, haloalquilo C<sub>2-6</sub>, alcoxí(C<sub>1-6</sub>)carbonilo o R<sup>19</sup> y R<sup>20</sup> junto con el átomo de N al cual están unidos forman un anillo heterocíclico de cinco, seis o siete miembros que puede contener uno o dos heteroátomos adicionales seleccionados entre O, N o S y que puede estar opcionalmente sustituido con uno o dos grupos alquilo C<sub>1-6</sub>; n es 0, 1, 2 o 3.

Más preferiblemente cada R<sup>4</sup> es independientemente halógeno, ciano, alquilo C<sub>1-6</sub>, haloalquilo C<sub>1-6</sub>, cianoalquilo C<sub>1-6</sub>, alcoxí(C<sub>1-6</sub>)alquilo(C<sub>1-6</sub>), alquinilo C<sub>2-6</sub>, trimetilsililalquinilo C<sub>2-6</sub>, alcoxí(C<sub>1-6</sub>)carbonilo, cicloalquilo C<sub>3-7</sub>, alquilo(C<sub>1-3</sub>)cicloalquilo(C<sub>3-7</sub>), fenilo (opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo C<sub>1-4</sub>, alcoxí C<sub>1-4</sub>, haloalquilo C<sub>1-4</sub>, haloalcoxí C<sub>1-4</sub>, CN, NO<sub>2</sub>, anilo, heteroarilo, amino o dialquilamino), heterociclilo (opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, alquilo C<sub>1-6</sub>, haloalquilo C<sub>1-6</sub>, alcoxí C<sub>1-6</sub> o haloalcoxí C<sub>1-6</sub>), alcoxí C<sub>1-6</sub>, haloalcoxí C<sub>1-6</sub>, fenoxi (opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo C<sub>1-4</sub>, alcoxí C<sub>1-4</sub>, haloalquilo C<sub>1-4</sub>, haloalcoxí C<sub>1-4</sub>, CN, NO<sub>2</sub>, anilo, heteroanilo, amino o dialquilamino), heteroariloxi (opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, alquilo C<sub>1-3</sub>, haloalquilo C<sub>1-3</sub>, alcoxí C<sub>1-3</sub> o haloalcoxí C<sub>1-3</sub>), dialquil(C<sub>1-6</sub>)amino, o dos grupos adyacentes R<sup>4</sup> junto con los átomos de carbono a los cuales están unidos forman un anillo carbocíclico o heterocíclico de cuatro, cinco, seis o siete miembros que puede estar opcionalmente sustituido con halógeno; n es 0, 1, 2 o 3

Mucho más preferiblemente cada R<sup>4</sup> es independientemente halógeno, ciano, alquilo C<sub>1-6</sub>, haloalquilo C<sub>1-6</sub>, cianoalquilo C<sub>1-6</sub>, alcoxí(C<sub>1-6</sub>)alquilo(C<sub>1-6</sub>), alquinilo C<sub>2-6</sub>, heterociclilo (opcionalmente sustituido con alquilo C<sub>1-6</sub>), alcoxí C<sub>1-6</sub>, haloalcoxí C<sub>1-6</sub>, fenoxi (opcionalmente sustituido con halo, ciano, alquilo C<sub>1-3</sub> o haloalquilo C<sub>1-3</sub>), heteroariloxi (opcionalmente sustituido con halo, ciano, alquilo C<sub>1-3</sub> o haloalquilo C<sub>1-3</sub>), dialquil(C<sub>1-6</sub>)amino o dos grupos adyacentes R<sup>4</sup> junto con los átomos de carbono a los cuales están unidos forman un anillo carbocíclico o heterocíclico de cuatro, cinco, seis o siete miembros que puede estar opcionalmente sustituido con halógeno, n es 0, 1, 2 o 3.

Todavía más preferiblemente cada R<sup>4</sup> es independientemente flúor, cloro, bromo, ciano, alquilo C<sub>1-4</sub>, haloalquilo C<sub>1-4</sub>, cianoalquilo C<sub>1-4</sub> o alcoxí(C<sub>1-3</sub>)alquilo(C<sub>1-3</sub>), n es 0, 1, 2 o 3, preferiblemente 0, 1 o 2.

Todavía mucho más preferiblemente cada  $R^4$  es independientemente flúor cloro, bromo, alquilo  $C_{1-4}$  o haloalquilo  $C_{1-4}$ ; n es 1, 2 o 3, preferiblemente 1 o 2.

Preferiblemente  $R^8$  es alquilo  $C_{1-10}$ , haloalquilo  $C_{1-10}$ , arilalquilo  $C_{1-8}$  (donde el grupo arilo está opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo  $C_{1-4}$ , alcoxi  $C_{1-4}$ , haloalquilo  $C_{1-4}$ , haloalcoxi  $C_{1-4}$ , CN,  $NO_2$ , arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino), heteroarilalquilo  $C_{1-8}$  (donde el grupo heteroarilo está opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo  $C_{1-4}$ , alcoxi  $C_{1-4}$ , haloalquilo  $C_{1-4}$ , haloalcoxi  $C_{1-4}$ , CN,  $NO_2$ , arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino), arilcarbonilalquilo  $C_{1-8}$  (donde el grupo arilo puede estar opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo  $C_{1-4}$ , alcoxi  $C_{1-4}$ , haloalquilo  $C_{1-4}$ , haloalcoxi  $C_{1-4}$ , CN,  $NO_2$ , arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino y el grupo alquilo puede estar opcionalmente sustituido con arilo), alquenilo  $C_{2-8}$ , haloalquenilo  $C_{2-8}$ , arilalquenilo  $C_{2-8}$  (donde el grupo arilo está opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo  $C_{1-4}$ , alcoxi  $C_{1-4}$ , haloalquilo  $C_{1-4}$ , haloalcoxi  $C_{1-4}$ , CN,  $NO_2$ , arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino, alcoxi( $C_{1-8}$ )carbonilo, o dos sustituyentes adyacentes pueden ciclizarse para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de cinco, seis o siete miembros), heteroarilalquenilo  $C_{2-8}$  (donde el grupo heteroarilo está opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo  $C_{1-4}$ , alcoxi  $C_{1-4}$ , haloalquilo  $C_{1-4}$ , haloalcoxi  $C_{1-4}$ , CN,  $NO_2$ , arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino, alcoxi( $C_{1-8}$ )carbonilo, o dos sustituyentes adyacentes pueden ciclizarse para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de cinco, seis o siete miembros), alquinilo  $C_{2-8}$ , fenilalquinilo  $C_{2-8}$  (donde el grupo fenilo está opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo  $C_{1-4}$ , alcoxi  $C_{1-4}$ , haloalquilo  $C_{1-4}$ , haloalcoxi  $C_{1-4}$ , CN,  $NO_2$ , arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino), cicloalquilo  $C_{3-7}$ , alcoxi( $C_{1-8}$ )carbonilo, alquil( $C_{1-8}$ )carbonilo, haloalquil( $C_{1-8}$ )carbonilo o arilalquenil( $C_{2-8}$ )carbonilo (donde el grupo arilo puede estar opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo  $C_{1-4}$ , alcoxi  $C_{1-4}$ , haloalquilo  $C_{1-4}$ , haloalcoxi  $C_{1-4}$ , CN,  $NO_2$ , arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino), o  $-C(R^{51})(R^{52})-[CR^{53}=CR^{54}]_z-R^{55}$  donde z es 1 o 2,  $R^{51}$  y  $R^{52}$  son cada uno independientemente H, halo o alquilo  $C_{1-2}$ ,  $R^{53}$  y  $R^{54}$  son cada uno independientemente H, halógeno, alquilo  $C_{1-4}$  o haloalquilo  $C_{1-4}$  y  $R^{55}$  es arilo opcionalmente sustituido o heteroarilo opcionalmente sustituido.

Más preferiblemente  $R^8$  es fenilalquilo  $C_{1-4}$  (donde el grupo fenilo está opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo  $C_{1-4}$ , alcoxi  $C_{1-4}$ , haloalquilo  $C_{1-4}$ , haloalcoxi  $C_{1-4}$ , CN,  $NO_2$ , arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino), heteroarilalquilo  $C_{1-8}$  (donde el grupo heteroarilo está opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo  $C_{1-4}$ , alcoxi  $C_{1-4}$ , haloalquilo  $C_{1-4}$ , haloalcoxi  $C_{1-4}$ ,

CN, NO<sub>2</sub>, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino), fenilalquenilo C<sub>2-6</sub> (donde el grupo fenilo está opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo C<sub>1-4</sub>, alcoxi C<sub>1-4</sub>, haloalquilo C<sub>1-4</sub>, haloalcoxi C<sub>1-4</sub>, CN, NO<sub>2</sub>, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino), heteroanilalquenilo C<sub>2-6</sub> (donde el grupo heteroarilo está opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo C<sub>1-4</sub>, alcoxi C<sub>1-4</sub>, haloalquilo C<sub>1-4</sub>, haloalcoxi C<sub>1-4</sub>, CN, NO<sub>2</sub>, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino) o fenilalquinilo C<sub>2-6</sub> (donde el grupo fenilo está opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo C<sub>1-4</sub>, alcoxi C<sub>1-4</sub>, haloalquilo C<sub>1-4</sub>, haloalcoxi C<sub>1-4</sub>, CN, NO<sub>2</sub>, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino, o  $-C(R^{51})(R^{52})-[CR^{53}=CR^{54}]_z-R^{55}$  donde z es 1 o 2, R<sup>51</sup> y R<sup>52</sup> son cada uno independientemente H, halo o alquilo C<sub>1-2</sub>, R<sup>53</sup> y R<sup>54</sup> son cada uno independientemente H, halógeno, alquilo C<sub>1-4</sub> o haloalquilo C<sub>1-4</sub> y R<sup>55</sup> es arilo opcionalmente sustituido o heteroarilo opcionalmente sustituido

Todavía más preferiblemente R<sup>8</sup> es  $-C(R^{51})(R^{52})-[CR^{53}=CR^{54}]_z-R^{55}$  donde z es 1 o 2, preferiblemente 1, R<sup>51</sup> y R<sup>52</sup> son cada uno independientemente H o alquilo C<sub>1-2</sub>, R<sup>53</sup> y R<sup>54</sup> son cada uno independientemente H, halógeno, alquilo C<sub>1-4</sub> o haloalquilo C<sub>1-4</sub> y R<sup>55</sup> es fenilo sustituido con halógeno, alquilo C<sub>1-4</sub>, alcoxi C<sub>1-4</sub>, haloalquilo C<sub>1-4</sub>, haloalcoxi C<sub>1-4</sub>, CN, NO<sub>2</sub>, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino o heteroarilo sustituido con halógeno, alquilo C<sub>1-4</sub>, alcoxi C<sub>1-4</sub>, haloalquilo C<sub>1-4</sub>, haloalcoxi C<sub>1-4</sub>, CN, NO<sub>2</sub>, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino

R<sup>51</sup> y R<sup>52</sup> son preferiblemente hidrógeno

R<sup>53</sup> y R<sup>54</sup> son preferiblemente hidrógeno o halógeno, especialmente hidrógeno

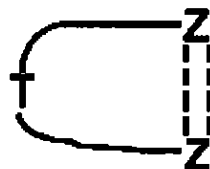
R<sup>55</sup> es preferiblemente fenilo sustituido con uno a tres sustituyentes seleccionados entre halógeno, alquilo C<sub>1-4</sub>, alcoxi C<sub>1-4</sub>, haloalquilo C<sub>1-4</sub>, haloalcoxi C<sub>1-4</sub>, CN, NO<sub>2</sub>, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino.

Preferiblemente cada Ra es independientemente halo, ciano, alquilo C<sub>1-3</sub>, hidroxilo o dos grupos Ra junto con el átomo de carbono al cual están unidos forman =O, =S, =NRb, =CRcRd donde Rb, Rc y Rd son independientemente H o alquilo opcionalmente sustituido, y p es 0, 1 o 2

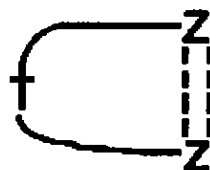
Más preferiblemente cada Ra es independientemente flúor, metilo, hidroxilo o dos grupos Ra junto con el átomo de carbono al cual están unidos forman un grupo carbonilo y p es 0, 1 o 2

Todavía más preferiblemente p es 0

Se prefiere que el anillo

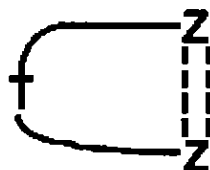


Más preferiblemente el anillo



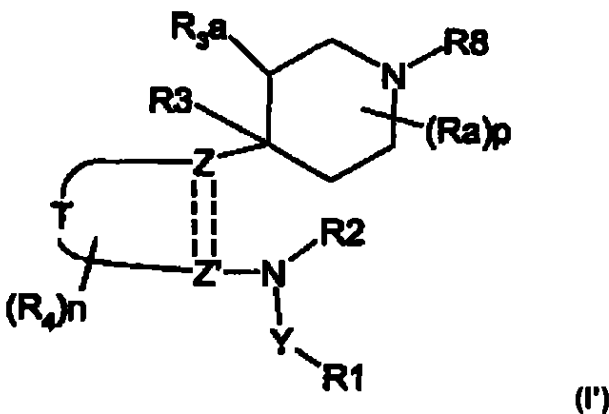
es un benceno, pindina, pirimidina, pirazina, piridazina, triazina, pirrol, imidazol, quinolina, isoquinolina, tiofeno, pirazol, oxazol, tiazol, isoxazol, isotiazol, [1,2,3]triazol, [1,2,3]oxadiazol o [1,2,3]tiadiazol.

Todavía más preferiblemente el anillo



es un anillo benceno, pindina, pirimidina, pirazina, tiofeno o pirazol, especialmente un anillo benceno

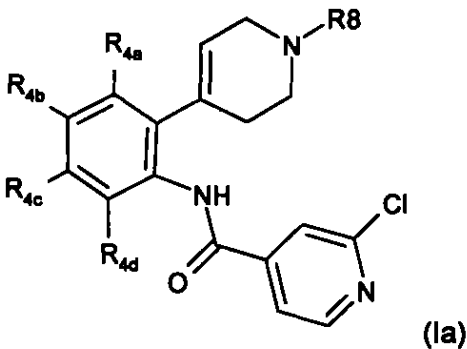
Ciertos compuestos de Fórmula (I) son novedosos y como tales forman otro aspecto de la invención. Un grupo de compuestos novedosos son los compuestos de Fórmula I'



donde R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>3a</sup>, R<sup>4</sup> Ra, T, Y, n y p son como se definió en relación con la Fórmula I y R<sup>8</sup> es -C(R<sup>51</sup>)(R<sup>52</sup>)-[CR<sup>53</sup>=CR<sup>54</sup>]<sub>z</sub>-R<sup>55</sup> donde z es 1 o 2, preferiblemente 1, R<sup>51</sup> y R<sup>52</sup> son cada uno independientemente H o alquilo C<sub>1-2</sub>, R<sup>53</sup> y R<sup>54</sup> son cada uno independientemente H, halógeno, alquilo C<sub>1-4</sub> o haloalquilo C<sub>1-4</sub> y R<sup>55</sup> es fenilo sustituido con halógeno, alquilo C<sub>1-4</sub>, alcoxi C<sub>1-4</sub>, haloalquilo C<sub>1-4</sub>, haloalcoxi C<sub>1-4</sub>, CN, NO<sub>2</sub>, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino o heteroarilo sustituido con halógeno, alquilo C<sub>1-4</sub>, alcoxi C<sub>1-4</sub>, haloalquilo C<sub>1-4</sub>, haloalcoxi C<sub>1-4</sub>, CN, NO<sub>2</sub>, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino o sales o N-óxidos de los mismos

Los compuestos de las Tablas I a XCV a continuación ilustran los compuestos de la invención.

La Tabla I proporciona los 1127 compuestos de Fórmula Ia



cuyos valores de R<sup>8</sup>, R<sup>4a</sup>, R<sup>4b</sup>, R<sup>4c</sup> y R<sup>4d</sup> están indicados en la Tabla 1.

Tabla 1

| Compuesto<br>No | R <sup>8</sup> | R <sup>4a</sup> | R <sup>4b</sup> | R <sup>4c</sup> | R <sup>4d</sup> |
|-----------------|----------------|-----------------|-----------------|-----------------|-----------------|
| I-1             | 4-clorobencilo | H               | H               | H               | H               |
| I-2             | Cinamilo       | H               | H               | H               | H               |

|      |                                         |   |   |   |   |
|------|-----------------------------------------|---|---|---|---|
| I-3  | 4-clorocinamilo                         | H | H | H | H |
| I-4  | 4-fluorocinamilo                        | H | H | H | H |
| I-5  | 4-bromocinamilo                         | H | H | H | H |
| I-6  | 4-trifluorometilcinamilo                | H | H | H | H |
| I-7  | 4-trifluorometoxicinamilo               | H | H | H | H |
| I-8  | 4-pentafluoroetoxicinamilo              | H | H | H | H |
| I-9  | 4-metoxicinamilo                        | H | H | H | H |
| I-10 | 4-etoxicinamilo                         | H | H | H | H |
| I-11 | 4-cianocinamilo                         | H | H | H | H |
| I-12 | 3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo          | H | H | H | H |
| I-13 | 3-(4-clorofenil)-but-2-enilo            | H | H | H | H |
| I-14 | 3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo         | H | H | H | H |
| I-15 | 3-cloro-4-fluoro-cinamilo               | H | H | H | H |
| I-16 | 3,5-dicloro-cinamilo                    | H | H | H | H |
| I-17 | 5-fenil-penta-2,4-dienilo               | H | H | H | H |
| I-18 | 4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo    | H | H | H | H |
| I-19 | 3-naftalen-2-il-alilo                   | H | H | H | H |
| I-20 | 3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo | H | H | H | H |
| I-21 | 3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo          | H | H | H | H |
| I-22 | 3-piridin-4-il-alilo                    | H | H | H | H |
| I-23 | 3-(2-cloro-piridin-4-il)-alilo          | H | H | H | H |
| I-24 | 4-clorobencilo                          | H | F | H | H |
| I-25 | Cinamilo                                | H | F | H | H |
| I-26 | 4-clorocinamilo                         | H | F | H | H |
| I-27 | 4-fluorocinamilo                        | H | F | H | H |
| I-28 | 4-bromocinamilo                         | H | F | H | H |
| I-29 | 4-trifluorometilcinamilo                | H | F | H | H |

|      |                                         |   |    |   |   |
|------|-----------------------------------------|---|----|---|---|
| I-30 | 4-trifluorometoxicinamilo               | H | F  | H | H |
| I-31 | 4-pentafluoroetoxicinamilo              | H | F  | H | H |
| I-32 | 4-metoxicinamilo                        | H | F  | H | H |
| I-33 | 4-etoxicinamilo                         | H | F  | H | H |
| I-34 | 4-cianocinamilo                         | H | F  | H | H |
| I-35 | 3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo          | H | F  | H | H |
| I-36 | 3-(4-clorofenil)-but-2-enilo            | H | F  | H | H |
| I-37 | 3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo         | H | F  | H | H |
| I-38 | 3-cloro-4-fluoro-cinamilo               | H | F  | H | H |
| I-39 | 3,5-dicloro-cinamilo                    | H | F  | H | H |
| I-40 | 5-fenil-penta-2,4-dienilo               | H | F  | H | H |
| I-41 | 4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo    | H | F  | H | H |
| I-42 | 3-naftalen-2-il-alilo                   | H | F  | H | H |
| I-43 | 3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo | H | F  | H | H |
| I-44 | 3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo          | H | F  | H | H |
| I-45 | 3-piridin-4-il-alilo                    | H | F  | H | H |
| I-46 | 3-(2-cloro-piridin-4-il)-alilo          | H | F  | H | H |
| I-47 | 4-clorobencilo                          | H | Cl | H | H |
| I-48 | Cinamilo                                | H | Cl | H | H |
| I-49 | 4-clorocinamilo                         | H | Cl | H | H |
| I-50 | 4-fluorocinamilo                        | H | Cl | H | H |
| I-51 | 4-bromocinamilo                         | H | Cl | H | H |
| I-52 | 4-trifluorometilcinamilo                | H | Cl | H | H |
| I-53 | 4-trifluorometoxicinamilo               | H | Cl | H | H |
| I-54 | 4-pentafluoroetoxicinamilo              | H | Cl | H | H |
| I-55 | 4-metoxicinamilo                        | H | Cl | H | H |
| I-56 | 4-etoxicinamilo                         | H | Cl | H | H |

|      |                                         |   |    |   |   |
|------|-----------------------------------------|---|----|---|---|
| I-57 | 4-cianocinamilo                         | H | Cl | H | H |
| I-58 | 3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo          | H | Cl | H | H |
| I-59 | 3-(4-clorofenil)-but-2-enilo            | H | Cl | H | H |
| I-60 | 3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo         | H | Cl | H | H |
| I-61 | 3-cloro-4-fluoro-cinamilo               | H | Cl | H | H |
| I-62 | 3,5-dicloro-cinamilo                    | H | Cl | H | H |
| I-63 | 5-fenil-penta-2,4-dienilo               | H | Cl | H | H |
| I-64 | 4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo    | H | Cl | H | H |
| I-65 | 3-naftalen-2-il-alilo                   | H | Cl | H | H |
| I-66 | 3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo | H | Cl | H | H |
| I-67 | 3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo          | H | Cl | H | H |
| I-68 | 3-piridin-4-il-alilo                    | H | Cl | H | H |
| I-69 | 3-(2-cloro-piridin-4-il)-alilo          | H | Cl | H | H |
| I-70 | 4-clorobencilo                          | H | H  | F | H |
| I-71 | Cinamilo                                | H | H  | F | H |
| I-72 | 4-clorocinamilo                         | H | H  | F | H |
| I-73 | 4-fluorocinamilo                        | H | H  | F | H |
| I-74 | 4-bromocinamilo                         | H | H  | F | H |
| I-75 | 4-trifluorometilcinamilo                | H | H  | F | H |
| I-76 | 4-trifluorometoxicinamilo               | H | H  | F | H |
| I-77 | 4-pentafluoroetoxicinamilo              | H | H  | F | H |
| I-78 | 4-metoxicinamilo                        | H | H  | F | H |
| I-79 | 4-etoxicinamilo                         | H | H  | F | H |
| I-80 | 4-cianocinamilo                         | H | H  | F | H |
| I-81 | 3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo          | H | H  | F | H |
| I-82 | 3-(4-clorofenil)-but-2-enilo            | H | H  | F | H |
| I-83 | 3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo         | H | H  | F | H |

|       |                                         |   |   |    |   |
|-------|-----------------------------------------|---|---|----|---|
| I-84  | 3-cloro-4-fluoro-cinamilo               | H | H | F  | H |
| I-85  | 3,5-dicloro-cinamilo                    | H | H | F  | H |
| I-86  | 5-fenil-penta-2,4-dienilo               | H | H | F  | H |
| I-87  | 4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo    | H | H | F  | H |
| I-88  | 3-naftalen-2-il-alilo                   | H | H | F  | H |
| I-89  | 3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo | H | H | F  | H |
| I-90  | 3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo          | H | H | F  | H |
| I-91  | 3-piridin-4-il-alilo                    | H | H | F  | H |
| I-92  | 3-(2-cloro-piridin-4-il)-alilo          | H | H | F  | H |
| I-93  | 4-clorobencilo                          | H | H | Cl | H |
| I-94  | Cinamilo                                | H | H | Cl | H |
| I-95  | 4-clorocinamilo                         | H | H | Cl | H |
| I-96  | 4-fluorocinamilo                        | H | H | Cl | H |
| I-97  | 4-bromocinamilo                         | H | H | Cl | H |
| I-98  | 4-trifluorometilcinamilo                | H | H | Cl | H |
| I-99  | 4-trifluorometoxicinamilo               | H | H | Cl | H |
| I-100 | 4-pentafluoroetoxicinamilo              | H | H | Cl | H |
| I-101 | 4-metoxicinamilo                        | H | H | Cl | H |
| I-102 | 4-etoxicinamilo                         | H | H | Cl | H |
| I-103 | 4-cianocinamilo                         | H | H | Cl | H |
| I-104 | 3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo          | H | H | Cl | H |
| I-105 | 3-(4-clorofenil)-but-2-enilo            | H | H | Cl | H |
| I-106 | 3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo         | H | H | Cl | H |
| I-107 | 3-cloro-4-fluoro-cinamilo               | H | H | Cl | H |
| I-108 | 3,5-dicloro-cinamilo                    | H | H | Cl | H |
| I-109 | 5-fenil-penta-2,4-dienilo               | H | H | Cl | H |
| I-110 | 4-isopropiloxicarbonilamino-            | H | H | Cl | H |

|       |                                             |    |    |    |   |
|-------|---------------------------------------------|----|----|----|---|
|       | cinamilo                                    |    |    |    |   |
| I-111 | 3-naftalen-2-il-alilo                       | H  | H  | Cl | H |
| I-112 | 3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-<br>alilo | H  | H  | Cl | H |
| I-113 | 3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo              | H  | H  | Cl | H |
| I-114 | 3-piridin-4-il-alilo                        | H  | H  | Cl | H |
| I-115 | 3-(2-cloro-piridin-4-il)-alilo              | H  | H  | Cl | H |
| I-116 | 4-clorobencilo                              | Cl | Cl | H  | H |
| I-117 | Cinamilo                                    | Cl | Cl | H  | H |
| I-118 | 4-clorocinamilo                             | Cl | Cl | H  | H |
| I-119 | 4-fluorocinamilo                            | Cl | Cl | H  | H |
| I-120 | 4-bromocinamilo                             | Cl | Cl | H  | H |
| I-121 | 4-trifluorometilcinamilo                    | Cl | Cl | H  | H |
| I-122 | 4-trifluorometoxicinamilo                   | Cl | Cl | H  | H |
| I-123 | 4-pentafluoroetoxicinamilo                  | Cl | Cl | H  | H |
| I-124 | 4-metoxicinamilo                            | Cl | Cl | H  | H |
| I-125 | 4-etoxicinamilo                             | Cl | Cl | H  | H |
| I-126 | 4-cianocinamilo                             | Cl | Cl | H  | H |
| I-127 | 3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo              | Cl | Cl | H  | H |
| I-128 | 3-(4-clorofenil)-but-2-enilo                | Cl | Cl | H  | H |
| I-129 | 3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo             | Cl | Cl | H  | H |
| I-130 | 3-cloro-4-fluoro-cinamilo                   | Cl | Cl | H  | H |
| I-131 | 3,5-dicloro-cinamilo                        | Cl | Cl | H  | H |
| I-132 | 5-fenil-penta-2,4-dienilo                   | Cl | Cl | H  | H |
| I-133 | 4-isopropiloxicarbonilamino-<br>cinamilo    | Cl | Cl | H  | H |

|       |                                             |    |    |   |   |
|-------|---------------------------------------------|----|----|---|---|
| I-134 | 3-naftalen-2-il-alilo                       | Cl | Cl | H | H |
| I-135 | 3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-<br>alilo | Cl | Cl | H | H |
| I-136 | 3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo              | Cl | Cl | H | H |
| I-137 | 3-piridin-4-il-alilo                        | Cl | Cl | H | H |
| I-138 | 3-(2-cloro-piridin-4-il)-alilo              | Cl | Cl | H | H |
| I-139 | 4-clorobencilo                              | F  | F  | H | H |
| I-140 | Cinamilo                                    | F  | F  | H | H |
| I-141 | 4-clorocinamilo                             | F  | F  | H | H |
| I-142 | 4-fluorocinamilo                            | F  | F  | H | H |
| I-143 | 4-bromocinamilo                             | F  | F  | H | H |
| I-144 | 4-trifluorometilcinamilo                    | F  | F  | H | H |
| I-145 | 4-trifluorometoxicinamilo                   | F  | F  | H | H |
| I-146 | 4-pentafluoroetoxicinamilo                  | F  | F  | H | H |
| I-147 | 4-metoxicinamilo                            | F  | F  | H | H |
| I-148 | 4-etoxicinamilo                             | F  | F  | H | H |
| I-149 | 4-cianocinamilo                             | F  | F  | H | H |
| I-150 | 3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo              | F  | F  | H | H |
| I-151 | 3-(4-clorofenil)-but-2-enilo                | F  | F  | H | H |
| I-152 | 3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo             | F  | F  | H | H |
| I-153 | 3-cloro-4-fluoro-cinamilo                   | F  | F  | H | H |
| I-154 | 3,5-dicloro-cinamilo                        | F  | F  | H | H |
| I-155 | 5-fenil-penta-2,4-dienilo                   | F  | F  | H | H |
| I-156 | 4-isopropiloxycarbonilamino-<br>cinamilo    | F  | F  | H | H |
| I-157 | 3-naftalen-2-il-alilo                       | F  | F  | H | H |
| I-158 | 3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-<br>alilo | F  | F  | H | H |

|       |                                         |   |   |   |   |
|-------|-----------------------------------------|---|---|---|---|
| I-159 | 3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo          | F | F | H | H |
| I-160 | 3-piridin-4-il-alilo                    | F | F | H | H |
| I-161 | 3-(2-cloro-piridin-4-il)-alilo          | F | F | H | H |
| I-162 | 4-clorobencilo                          | F | H | F | H |
| I-163 | Cinamilo                                | F | H | F | H |
| I-164 | 4-clorocinamilo                         | F | H | F | H |
| I-165 | 4-fluorocinamilo                        | F | H | F | H |
| I-166 | 4-bromocinamilo                         | F | H | F | H |
| I-167 | 4-trifluorometilcinamilo                | F | H | F | H |
| I-168 | 4-trifluorometoxicinamilo               | F | H | F | H |
| I-169 | 4-pentafluoroetoxicinamilo              | F | H | F | H |
| I-170 | 4-metoxicinamilo                        | F | H | F | H |
| I-171 | 4-etoxicinamilo                         | F | H | F | H |
| I-172 | 4-cianocinamilo                         | F | H | F | H |
| I-173 | 3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo          | F | H | F | H |
| I-174 | 3-(4-clorofenil)-but-2-enilo            | F | H | F | H |
| I-175 | 3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo         | F | H | F | H |
| I-176 | 3-cloro-4-fluoro-cinamilo               | F | H | F | H |
| I-177 | 3,5-dicloro-cinamilo                    | F | H | F | H |
| I-178 | 5-fenil-penta-2,4-dienilo               | F | H | F | H |
| I-179 | 4-isopropiloxycarbonilamino-cinamilo    | F | H | F | H |
| I-180 | 3-naftalen-2-il-alilo                   | F | H | F | H |
| I-181 | 3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo | F | H | F | H |
| I-182 | 3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo          | F | H | F | H |
| I-183 | 3-piridin-4-il-alilo                    | F | H | F | H |
| I-184 | 3-(2-cloro-piridin-4-il)-alilo          | F | H | F | H |
| I-185 | 4-clorobencilo                          | F | H | H | F |

|       |                                         |    |   |    |   |
|-------|-----------------------------------------|----|---|----|---|
| I-186 | Cinamilo                                | F  | H | H  | F |
| I-187 | 4-clorocinamilo                         | F  | H | H  | F |
| I-188 | 4-fluorocinamilo                        | F  | H | H  | F |
| I-189 | 4-bromocinamilo                         | F  | H | H  | F |
| I-190 | 4-trifluorometilcinamilo                | F  | H | H  | F |
| I-191 | 4-trifluorometoxicinamilo               | F  | H | H  | F |
| I-192 | 4-pentafluoroetoxicinamilo              | F  | H | H  | F |
| I-193 | 4-metoxicinamilo                        | F  | H | H  | F |
| I-194 | 4-etoxicinamilo                         | F  | H | H  | F |
| I-195 | 4-cianocinamilo                         | F  | H | H  | F |
| I-196 | 3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo          | F  | H | H  | F |
| I-197 | 3-(4-clorofenil)-but-2-enilo            | F  | H | H  | F |
| I-198 | 3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo         | F  | H | H  | F |
| I-199 | 3-cloro-4-fluoro-cinamilo               | F  | H | H  | F |
| I-200 | 3,5-dicloro-cinamilo                    | F  | H | H  | F |
| I-201 | 5-fenil-penta-2,4-dienilo               | F  | H | H  | F |
| I-202 | 4-isopropiloxycarbonilamino-cinamilo    | F  | H | H  | F |
| I-203 | 3-naftalen-2-il-alilo                   | F  | H | H  | F |
| I-204 | 3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo | F  | H | H  | F |
| I-205 | 3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo          | F  | H | H  | F |
| I-206 | 3-piridin-4-il-alilo                    | F  | H | H  | F |
| I-207 | 3-(2-cloro-piridin-4-il)-alilo          | F  | H | H  | F |
| I-208 | 4-clorobencilo                          | Cl | H | Cl | H |
| I-209 | Cinamilo                                | Cl | H | Cl | H |
| I-210 | 4-clorocinamilo                         | Cl | H | Cl | H |
| I-211 | 4-fluorocinamilo                        | Cl | H | Cl | H |
| I-212 | 4-bromocinamilo                         | Cl | H | Cl | H |

|       |                                         |    |   |    |    |
|-------|-----------------------------------------|----|---|----|----|
| I-213 | 4-trifluorometilcinamilo                | Cl | H | Cl | H  |
| I-214 | 4-trifluorometoxicinamilo               | Cl | H | Cl | H  |
| I-215 | 4-pentafluoroetoxicinamilo              | Cl | H | Cl | H  |
| I-216 | 4-metoxicinamilo                        | Cl | H | Cl | H  |
| I-217 | 4-etoxicinamilo                         | Cl | H | Cl | H  |
| I-218 | 4-cianocinamilo                         | Cl | H | Cl | H  |
| I-219 | 3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo          | Cl | H | Cl | H  |
| I-220 | 3-(4-clorofenil)-but-2-enilo            | Cl | H | Cl | H  |
| I-221 | 3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo         | Cl | H | Cl | H  |
| I-222 | 3-cloro-4-fluoro-cinamilo               | Cl | H | Cl | H  |
| I-223 | 3,5-dicloro-cinamilo                    | Cl | H | Cl | H  |
| I-224 | 5-fenil-penta-2,4-dienilo               | Cl | H | Cl | H  |
| I-225 | 4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo    | Cl | H | Cl | H  |
| I-226 | 3-naftalen-2-il-alilo                   | Cl | H | Cl | H  |
| I-227 | 3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo | Cl | H | Cl | H  |
| I-228 | 3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo          | Cl | H | Cl | H  |
| I-229 | 3-piridin-4-il-alilo                    | Cl | H | Cl | H  |
| I-230 | 3-(2-cloro-piridin-4-il)-alilo          | Cl | H | Cl | H  |
| I-231 | 4-clorobencilo                          | Cl | H | H  | Cl |
| I-232 | Cinamilo                                | Cl | H | H  | Cl |
| I-233 | 4-clorocinamilo                         | Cl | H | H  | Cl |
| I-234 | 4-fluorocinamilo                        | Cl | H | H  | Cl |
| I-235 | 4-bromocinamilo                         | Cl | H | H  | Cl |
| I-236 | 4-trifluorometilcinamilo                | Cl | H | H  | Cl |
| I-237 | 4-trifluorometoxicinamilo               | Cl | H | H  | Cl |
| I-238 | 4-pentafluoroetoxicinamilo              | Cl | H | H  | Cl |
| I-239 | 4-metoxicinamilo                        | Cl | H | H  | Cl |

|       |                                         |    |    |   |    |
|-------|-----------------------------------------|----|----|---|----|
| I-240 | 4-etoxicinamilo                         | Cl | H  | H | Cl |
| I-241 | 4-cianocinamilo                         | Cl | H  | H | Cl |
| I-242 | 3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo          | Cl | H  | H | Cl |
| I-243 | 3-(4-clorofenil)-but-2-enilo            | Cl | H  | H | Cl |
| I-244 | 3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo         | Cl | H  | H | Cl |
| I-245 | 3-cloro-4-fluoro-cinamilo               | Cl | H  | H | Cl |
| I-246 | 3,5-dicloro-cinamilo                    | Cl | H  | H | Cl |
| I-247 | 5-fenil-penta-2,4-dienilo               | Cl | H  | H | Cl |
| I-248 | 4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo    | Cl | H  | H | Cl |
| I-249 | 3-naftalen-2-il-alilo                   | Cl | H  | H | Cl |
| I-250 | 3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo | Cl | H  | H | Cl |
| I-251 | 3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo          | Cl | H  | H | Cl |
| I-252 | 3-piridin-4-il-alilo                    | Cl | H  | H | Cl |
| I-253 | 3-(2-cloro-piridin-4-il)-alilo          | Cl | H  | H | Cl |
| I-254 | 4-clorobencilo                          | F  | Cl | H | H  |
| I-255 | Cinamilo                                | F  | Cl | H | H  |
| I-256 | 4-clorocinamilo                         | F  | Cl | H | H  |
| I-257 | 4-fluorocinamilo                        | F  | Cl | H | H  |
| I-258 | 4-bromocinamilo                         | F  | Cl | H | H  |
| I-259 | 4-trifluorometilcinamilo                | F  | Cl | H | H  |
| I-260 | 4-trifluorometoxicinamilo               | F  | Cl | H | H  |
| I-261 | 4-pentafluoroetoxicinamilo              | F  | Cl | H | H  |
| I-262 | 4-metoxicinamilo                        | F  | Cl | H | H  |
| I-263 | 4-etoxicinamilo                         | F  | Cl | H | H  |
| I-264 | 4-cianocinamilo                         | F  | Cl | H | H  |
| I-265 | 3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo          | F  | Cl | H | H  |
| I-266 | 3-(4-clorofenil)-but-2-enilo            | F  | Cl | H | H  |

|       |                                         |   |    |    |   |
|-------|-----------------------------------------|---|----|----|---|
| I-267 | 3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo         | F | Cl | H  | H |
| I-268 | 3-cloro-4-fluoro-cinamilo               | F | Cl | H  | H |
| I-269 | 3,5-dicloro-cinamilo                    | F | Cl | H  | H |
| I-270 | 5-fenil-penta-2,4-dienilo               | F | Cl | H  | H |
| I-271 | 4-isopropiloxycarbonilamino-cinamilo    | F | Cl | H  | H |
| I-272 | 3-naftalen-2-il-alilo                   | F | Cl | H  | H |
| I-273 | 3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo | F | Cl | H  | H |
| I-274 | 3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo          | F | Cl | H  | H |
| I-275 | 3-piridin-4-il-alilo                    | F | Cl | H  | H |
| I-276 | 3-(2-cloro-piridin-4-il)-alilo          | F | Cl | H  | H |
| I-277 | 4-clorobencilo                          | F | H  | Cl | H |
| I-278 | Cinamilo                                | F | H  | Cl | H |
| I-279 | 4-clorocinamilo                         | F | H  | Cl | H |
| I-280 | 4-fluorocinamilo                        | F | H  | Cl | H |
| I-281 | 4-bromocinamilo                         | F | H  | Cl | H |
| I-282 | 4-trifluorometilcinamilo                | F | H  | Cl | H |
| I-283 | 4-trifluorometoxicinamilo               | F | H  | Cl | H |
| I-284 | 4-pentafluoroetoxicinamilo              | F | H  | Cl | H |
| I-285 | 4-metoxicinamilo                        | F | H  | Cl | H |
| I-286 | 4-etoxicinamilo                         | F | H  | Cl | H |
| I-287 | 4-cianocinamilo                         | F | H  | Cl | H |
| I-288 | 3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo          | F | H  | Cl | H |
| I-289 | 3-(4-clorofenil)-but-2-enilo            | F | H  | Cl | H |
| I-290 | 3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo         | F | H  | Cl | H |
| I-291 | 3-cloro-4-fluoro-cinamilo               | F | H  | Cl | H |
| I-292 | 3,5-dicloro-cinamilo                    | F | H  | Cl | H |
| I-293 | 5-fenil-penta-2,4-dienilo               | F | H  | Cl | H |

|       |                                         |   |   |    |    |
|-------|-----------------------------------------|---|---|----|----|
| I-294 | 4-isopropiloxycarbonilamino-cinamilo    | F | H | Cl | H  |
| I-295 | 3-naftalen-2-il-alilo                   | F | H | Cl | H  |
| I-296 | 3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo | F | H | Cl | H  |
| I-297 | 3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo          | F | H | Cl | H  |
| I-298 | 3-piridin-4-il-alilo                    | F | H | Cl | H  |
| I-299 | 3-(2-cloro-piridin-4-il)-alilo          | F | H | Cl | H  |
| I-300 | 4-clorobencilo                          | F | H | H  | Cl |
| I-301 | Cinamilo                                | F | H | H  | Cl |
| I-302 | 4-clorocinamilo                         | F | H | H  | Cl |
| I-303 | 4-fluorocinamilo                        | F | H | H  | Cl |
| I-304 | 4-bromocinamilo                         | F | H | H  | Cl |
| I-305 | 4-trifluorometilcinamilo                | F | H | H  | Cl |
| I-306 | 4-trifluorometoxicinamilo               | F | H | H  | Cl |
| I-307 | 4-pentafluoroetoxicinamilo              | F | H | H  | Cl |
| I-308 | 4-metoxicinamilo                        | F | H | H  | Cl |
| I-309 | 4-etoxicinamilo                         | F | H | H  | Cl |
| I-310 | 4-cianocinamilo                         | F | H | H  | Cl |
| I-311 | 3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo          | F | H | H  | Cl |
| I-312 | 3-(4-clorofenil)-but-2-enilo            | F | H | H  | Cl |
| I-313 | 3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo         | F | H | H  | Cl |
| I-314 | 3-cloro-4-fluoro-cinamilo               | F | H | H  | Cl |
| I-315 | 3,5-dicloro-cinamilo                    | F | H | H  | Cl |
| I-316 | 5-fenil-penta-2,4-dienilo               | F | H | H  | Cl |
| I-317 | 4-isopropiloxycarbonilamino-cinamilo    | F | H | H  | Cl |
| I-318 | 3-naftalen-2-il-alilo                   | F | H | H  | Cl |
| I-319 | 3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-      | F | H | H  | Cl |

|       |                                         |    |   |   |    |
|-------|-----------------------------------------|----|---|---|----|
|       | alilo                                   |    |   |   |    |
| I-320 | 3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo          | F  | H | H | Cl |
| I-321 | 3-piridin-4-il-alilo                    | F  | H | H | Cl |
| I-322 | 3-(2-cloro-piridin-4-il)-alilo          | F  | H | H | Cl |
| I-323 | 4-clorobencilo                          | Cl | F | H | H  |
| I-324 | Cinamilo                                | Cl | F | H | H  |
| I-325 | 4-clorocinamilo                         | Cl | F | H | H  |
| I-326 | 4-fluorocinamilo                        | Cl | F | H | H  |
| I-327 | 4-bromocinamilo                         | Cl | F | H | H  |
| I-328 | 4-trifluorometilcinamilo                | Cl | F | H | H  |
| I-329 | 4-trifluorometoxicinamilo               | Cl | F | H | H  |
| I-330 | 4-pentafluoroetoxicinamilo              | Cl | F | H | H  |
| I-331 | 4-metoxicinamilo                        | Cl | F | H | H  |
| I-332 | 4-etoxicinamilo                         | Cl | F | H | H  |
| I-333 | 4-cianocinamilo                         | Cl | F | H | H  |
| I-334 | 3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo          | Cl | F | H | H  |
| I-335 | 3-(4-clorofenil)-but-2-enilo            | Cl | F | H | H  |
| I-336 | 3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo         | Cl | F | H | H  |
| I-337 | 3-cloro-4-fluoro-cinamilo               | Cl | F | H | H  |
| I-338 | 3,5-dicloro-cinamilo                    | Cl | F | H | H  |
| I-339 | 5-fenil-penta-2,4-dienilo               | Cl | F | H | H  |
| I-340 | 4-isopropiloxycarbonilamino-cinamilo    | Cl | F | H | H  |
| I-341 | 3-naftalen-2-il-alilo                   | Cl | F | H | H  |
| I-342 | 3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo | Cl | F | H | H  |
| I-343 | 3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo          | Cl | F | H | H  |
| I-344 | 3-piridin-4-il-alilo                    | Cl | F | H | H  |
| I-345 | 3-(2-cloro-piridin-4-il)-alilo          | Cl | F | H | H  |

|       |                                         |   |   |    |    |
|-------|-----------------------------------------|---|---|----|----|
| I-346 | 4-clorobencilo                          | H | F | Cl | H  |
| I-347 | Cinamilo                                | H | F | Cl | H  |
| I-348 | 4-clorocinamilo                         | H | F | Cl | H  |
| I-349 | 4-fluorocinamilo                        | H | F | Cl | H  |
| I-350 | 4-bromocinamilo                         | H | F | Cl | H  |
| I-351 | 4-trifluorometilcinamilo                | H | F | Cl | H  |
| I-352 | 4-trifluorometoxicinamilo               | H | F | Cl | H  |
| I-353 | 4-pentafluoroetoxicinamilo              | H | F | Cl | H  |
| I-354 | 4-metoxicinamilo                        | H | F | Cl | H  |
| I-355 | 4-etoxicinamilo                         | H | F | Cl | H  |
| I-356 | 4-cianocinamilo                         | H | F | Cl | H  |
| I-357 | 3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo          | H | F | Cl | H  |
| I-358 | 3-(4-clorofenil)-but-2-enilo            | H | F | Cl | H  |
| I-359 | 3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo         | H | F | Cl | H  |
| I-360 | 3-cloro-4-fluoro-cinamilo               | H | F | Cl | H  |
| I-361 | 3,5-dicloro-cinamilo                    | H | F | Cl | H  |
| I-362 | 5-fenil-penta-2,4-dienilo               | H | F | Cl | H  |
| I-363 | 4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo    | H | F | Cl | H  |
| I-364 | 3-naftalen-2-il-alilo                   | H | F | Cl | H  |
| I-365 | 3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo | H | F | Cl | H  |
| I-366 | 3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo          | H | F | Cl | H  |
| I-367 | 3-piridin-4-il-alilo                    | H | F | Cl | H  |
| I-368 | 3-(2-cloro-piridin-4-il)-alilo          | H | F | Cl | H  |
| I-369 | 4-clorobencilo                          | H | F | H  | Cl |
| I-370 | Cinamilo                                | H | F | H  | Cl |
| I-371 | 4-clorocinamilo                         | H | F | H  | Cl |
| I-372 | 4-fluorocinamilo                        | H | F | H  | Cl |

|       |                                         |    |   |   |    |
|-------|-----------------------------------------|----|---|---|----|
| I-373 | 4-bromocinamilo                         | H  | F | H | Cl |
| I-374 | 4-trifluorometilcinamilo                | H  | F | H | Cl |
| I-375 | 4-trifluorometoxicinamilo               | H  | F | H | Cl |
| I-376 | 4-pentafluoroetoxicinamilo              | H  | F | H | Cl |
| I-377 | 4-metoxicinamilo                        | H  | F | H | Cl |
| I-378 | 4-etoxicinamilo                         | H  | F | H | Cl |
| I-379 | 4-cianocinamilo                         | H  | F | H | Cl |
| I-380 | 3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo          | H  | F | H | Cl |
| I-381 | 3-(4-clorofenil)-but-2-enilo            | H  | F | H | Cl |
| I-382 | 3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo         | H  | F | H | Cl |
| I-383 | 3-cloro-4-fluoro-cinamilo               | H  | F | H | Cl |
| I-384 | 3,5-dicloro-cinamilo                    | H  | F | H | Cl |
| I-385 | 5-fenil-penta-2,4-dienilo               | H  | F | H | Cl |
| I-386 | 4-isopropiloxycarbonilamino-cinamilo    | H  | F | H | Cl |
| I-387 | 3-naftalen-2-il-alilo                   | H  | F | H | Cl |
| I-388 | 3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo | H  | F | H | Cl |
| I-389 | 3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo          | H  | F | H | Cl |
| I-390 | 3-piridin-4-il-alilo                    | H  | F | H | Cl |
| I-391 | 3-(2-cloro-piridin-4-il)-alilo          | H  | F | H | Cl |
| I-392 | 4-clorobencilo                          | Cl | H | F | H  |
| I-393 | Cinamilo                                | Cl | H | F | H  |
| I-394 | 4-clorocinamilo                         | Cl | H | F | H  |
| I-395 | 4-fluorocinamilo                        | Cl | H | F | H  |
| I-396 | 4-bromocinamilo                         | Cl | H | F | H  |
| I-397 | 4-trifluorometilcinamilo                | Cl | H | F | H  |
| I-398 | 4-trifluorometoxicinamilo               | Cl | H | F | H  |
| I-399 | 4-pentafluoroetoxicinamilo              | Cl | H | F | H  |

|       |                                         |    |    |   |   |
|-------|-----------------------------------------|----|----|---|---|
| I-400 | 4-metoxicinamilo                        | Cl | H  | F | H |
| I-401 | 4-etoxicinamilo                         | Cl | H  | F | H |
| I-402 | 4-cianocinamilo                         | Cl | H  | F | H |
| I-403 | 3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo          | Cl | H  | F | H |
| I-404 | 3-(4-clorofenil)-but-2-enilo            | Cl | H  | F | H |
| I-405 | 3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo         | Cl | H  | F | H |
| I-406 | 3-cloro-4-fluoro-cinamilo               | Cl | H  | F | H |
| I-407 | 3,5-dicloro-cinamilo                    | Cl | H  | F | H |
| I-408 | 5-fenil-penta-2,4-dienilo               | Cl | H  | F | H |
| I-409 | 4-isopropiloxycarbonilamino-cinamilo    | Cl | H  | F | H |
| I-410 | 3-naftalen-2-il-alilo                   | Cl | H  | F | H |
| I-411 | 3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo | Cl | H  | F | H |
| I-412 | 3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo          | Cl | H  | F | H |
| I-413 | 3-piridin-4-il-alilo                    | Cl | H  | F | H |
| I-414 | 3-(2-cloro-piridin-4-il)-alilo          | Cl | H  | F | H |
| I-415 | 4-clorobencilo                          | H  | Cl | F | H |
| I-416 | Cinamilo                                | H  | Cl | F | H |
| I-417 | 4-clorocinamilo                         | H  | Cl | F | H |
| I-418 | 4-fluorocinamilo                        | H  | Cl | F | H |
| I-419 | 4-bromocinamilo                         | H  | Cl | F | H |
| I-420 | 4-trifluorometilcinamilo                | H  | Cl | F | H |
| I-421 | 4-trifluorometoxicinamilo               | H  | Cl | F | H |
| I-422 | 4-pentafluoroetoxicinamilo              | H  | Cl | F | H |
| I-423 | 4-metoxicinamilo                        | H  | Cl | F | H |
| I-424 | 4-etoxicinamilo                         | H  | Cl | F | H |
| I-425 | 4-cianocinamilo                         | H  | Cl | F | H |
| I-426 | 3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo          | H  | Cl | F | H |

|       |                                         |   |    |   |    |
|-------|-----------------------------------------|---|----|---|----|
| I-427 | 3-(4-clorofenil)-but-2-enilo            | H | Cl | F | H  |
| I-428 | 3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo         | H | Cl | F | H  |
| I-429 | 3-cloro-4-fluoro-cinamilo               | H | Cl | F | H  |
| I-430 | 3,5-dicloro-cinamilo                    | H | Cl | F | H  |
| I-431 | 5-fenil-penta-2,4-dienilo               | H | Cl | F | H  |
| I-432 | 4-isopropiloxycarbonilamino-cinamilo    | H | Cl | F | H  |
| I-433 | 3-naftalen-2-il-alilo                   | H | Cl | F | H  |
| I-434 | 3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo | H | Cl | F | H  |
| I-435 | 3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo          | H | Cl | F | H  |
| I-436 | 3-piridin-4-il-alilo                    | H | Cl | F | H  |
| I-437 | 3-(2-cloro-piridin-4-il)-alilo          | H | Cl | F | H  |
| I-438 | 4-clorobencilo                          | H | H  | F | Cl |
| I-439 | Cinamilo                                | H | H  | F | Cl |
| I-440 | 4-clorocinamilo                         | H | H  | F | Cl |
| I-441 | 4-fluorocinamilo                        | H | H  | F | Cl |
| I-442 | 4-bromocinamilo                         | H | H  | F | Cl |
| I-443 | 4-trifluorometilcinamilo                | H | H  | F | Cl |
| I-444 | 4-trifluorometoxicinamilo               | H | H  | F | Cl |
| I-445 | 4-pentafluoroetoxicinamilo              | H | H  | F | Cl |
| I-446 | 4-metoxicinamilo                        | H | H  | F | Cl |
| I-447 | 4-etoxicinamilo                         | H | H  | F | Cl |
| I-448 | 4-cianocinamilo                         | H | H  | F | Cl |
| I-449 | 3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo          | H | H  | F | Cl |
| I-450 | 3-(4-clorofenil)-but-2-enilo            | H | H  | F | Cl |
| I-451 | 3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo         | H | H  | F | Cl |
| I-452 | 3-cloro-4-fluoro-cinamilo               | H | H  | F | Cl |
| I-453 | 3,5-dicloro-cinamilo                    | H | H  | F | Cl |

|       |                                         |    |   |   |    |
|-------|-----------------------------------------|----|---|---|----|
| I-454 | 5-fenil-penta-2,4-dienilo               | H  | H | F | Cl |
| I-455 | 4-isopropiloxycarbonilamino-cinamilo    | H  | H | F | Cl |
| I-456 | 3-naftalen-2-il-alilo                   | H  | H | F | Cl |
| I-457 | 3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo | H  | H | F | Cl |
| I-458 | 3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo          | H  | H | F | Cl |
| I-459 | 3-piridin-4-il-alilo                    | H  | H | F | Cl |
| I-460 | 3-(2-cloro-piridin-4-il)-alilo          | H  | H | F | Cl |
| I-461 | 4-clorobencilo                          | Cl | H | H | F  |
| I-462 | Cinamilo                                | Cl | H | H | F  |
| I-463 | 4-clorocinamilo                         | Cl | H | H | F  |
| I-464 | 4-fluorocinamilo                        | Cl | H | H | F  |
| I-465 | 4-bromocinamilo                         | Cl | H | H | F  |
| I-466 | 4-trifluorometilcinamilo                | Cl | H | H | F  |
| I-467 | 4-trifluorometoxicinamilo               | Cl | H | H | F  |
| I-468 | 4-pentafluoroetoxicinamilo              | Cl | H | H | F  |
| I-469 | 4-metoxicinamilo                        | Cl | H | H | F  |
| I-470 | 4-etoxicinamilo                         | Cl | H | H | F  |
| I-471 | 4-cianocinamilo                         | Cl | H | H | F  |
| I-472 | 3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo          | Cl | H | H | F  |
| I-473 | 3-(4-clorofenil)-but-2-enilo            | Cl | H | H | F  |
| I-474 | 3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo         | Cl | H | H | F  |
| I-475 | 3-cloro-4-fluoro-cinamilo               | Cl | H | H | F  |
| I-476 | 3,5-dicloro-cinamilo                    | Cl | H | H | F  |
| I-477 | 5-fenil-penta-2,4-dienilo               | Cl | H | H | F  |
| I-478 | 4-isopropiloxycarbonilamino-cinamilo    | Cl | H | H | F  |
| I-479 | 3-naftalen-2-il-alilo                   | Cl | H | H | F  |

|       |                                         |    |    |   |   |
|-------|-----------------------------------------|----|----|---|---|
| I-480 | 3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo | Cl | H  | H | F |
| I-481 | 3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo          | Cl | H  | H | F |
| I-482 | 3-piridin-4-il-alilo                    | Cl | H  | H | F |
| I-483 | 3-(2-cloro-piridin-4-il)-alilo          | Cl | H  | H | F |
| I-484 | 4-clorobencilo                          | H  | Cl | H | F |
| I-485 | Cinamilo                                | H  | Cl | H | F |
| I-486 | 4-clorocinamilo                         | H  | Cl | H | F |
| I-487 | 4-fluorocinamilo                        | H  | Cl | H | F |
| I-488 | 4-bromocinamilo                         | H  | Cl | H | F |
| I-489 | 4-trifluorometilcinamilo                | H  | Cl | H | F |
| I-490 | 4-trifluorometoxicinamilo               | H  | Cl | H | F |
| I-491 | 4-pentafluoroetoxicinamilo              | H  | Cl | H | F |
| I-492 | 4-metoxicinamilo                        | H  | Cl | H | F |
| I-493 | 4-etoxicinamilo                         | H  | Cl | H | F |
| I-494 | 4-cianocinamilo                         | H  | Cl | H | F |
| I-495 | 3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo          | H  | Cl | H | F |
| I-496 | 3-(4-clorofenil)-but-2-enilo            | H  | Cl | H | F |
| I-497 | 3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo         | H  | Cl | H | F |
| I-498 | 3-cloro-4-fluoro-cinamilo               | H  | Cl | H | F |
| I-499 | 3,5-dicloro-cinamilo                    | H  | Cl | H | F |
| I-500 | 5-fenil-penta-2,4-dienilo               | H  | Cl | H | F |
| I-501 | 4-isopropiloxycarbonilamino-cinamilo    | H  | Cl | H | F |
| I-502 | 3-naftalen-2-il-alilo                   | H  | Cl | H | F |
| I-503 | 3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo | H  | Cl | H | F |
| I-504 | 3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo          | H  | Cl | H | F |
| I-505 | 3-piridin-4-il-alilo                    | H  | Cl | H | F |

|       |                                         |   |    |    |   |
|-------|-----------------------------------------|---|----|----|---|
| I-506 | 3-(2-cloro-piridin-4-il)-alilo          | H | Cl | H  | F |
| I-507 | 4-clorobencilo                          | H | H  | Cl | F |
| I-508 | Cinamilo                                | H | H  | Cl | F |
| I-509 | 4-clorocinamilo                         | H | H  | Cl | F |
| I-510 | 4-fluorocinamilo                        | H | H  | Cl | F |
| I-511 | 4-bromocinamilo                         | H | H  | Cl | F |
| I-512 | 4-trifluorometilcinamilo                | H | H  | Cl | F |
| I-513 | 4-trifluorometoxicinamilo               | H | H  | Cl | F |
| I-514 | 4-pentafluoroetoxicinamilo              | H | H  | Cl | F |
| I-515 | 4-metoxicinamilo                        | H | H  | Cl | F |
| I-516 | 4-etoxicinamilo                         | H | H  | Cl | F |
| I-517 | 4-cianocinamilo                         | H | H  | Cl | F |
| I-518 | 3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo          | H | H  | Cl | F |
| I-519 | 3-(4-clorofenil)-but-2-enilo            | H | H  | Cl | F |
| I-520 | 3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo         | H | H  | Cl | F |
| I-521 | 3-cloro-4-fluoro-cinamilo               | H | H  | Cl | F |
| I-522 | 3,5-dicloro-cinamilo                    | H | H  | Cl | F |
| I-523 | 5-fenil-penta-2,4-dienilo               | H | H  | Cl | F |
| I-524 | 4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo    | H | H  | Cl | F |
| I-525 | 3-naftalen-2-il-alilo                   | H | H  | Cl | F |
| I-526 | 3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo | H | H  | Cl | F |
| I-527 | 3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo          | H | H  | Cl | F |
| I-528 | 3-piridin-4-il-alilo                    | H | H  | Cl | F |
| I-529 | 3-(2-cloro-piridin-4-il)-alilo          | H | H  | Cl | F |
| I-530 | 4-clorobencilo                          | H | F  | F  | F |
| I-531 | Cinamilo                                | H | F  | F  | F |
| I-532 | 4-clorocinamilo                         | H | F  | F  | F |

|       |                                        |   |   |   |   |
|-------|----------------------------------------|---|---|---|---|
| I-533 | 4-fluorocinamilo                       | H | F | F | F |
| I-534 | 4-bromocinamilo                        | H | F | F | F |
| I-535 | 4-trifluorometilcinamilo               | H | F | F | F |
| I-536 | 4-trifluorometoxicinamilo              | H | F | F | F |
| I-537 | 4-pentafluoroetoxicinamilo             | H | F | F | F |
| I-538 | 4-metoxicinamilo                       | H | F | F | F |
| I-539 | 4-etoxicinamilo                        | H | F | F | F |
| I-540 | 4-cianocinamilo                        | H | F | F | F |
| I-541 | 3-(6-cloro-pindin-3-il)-alilo          | H | F | F | F |
| I-542 | 3-(4-clorofenil)-but-2-enilo           | H | F | F | F |
| I-543 | 3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo        | H | F | F | F |
| I-544 | 3-cloro-4-fluoro-cinamilo              | H | F | F | F |
| I-545 | 3,5-dicloro-cinamilo                   | H | F | F | F |
| I-546 | 5-fenil-penta-2,4-dienilo              | H | F | F | F |
| I-547 | 4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo   | H | F | F | F |
| I-548 | 3-naftalen-2-il-alilo                  | H | F | F | F |
| I-549 | 3-(5-trifluorometil-pindin-2-il)-alilo | H | F | F | F |
| I-550 | 3-(5-cloro-pindin-2-il)-alilo          | H | F | F | F |
| I-551 | 3-piridin-4-il-alilo                   | H | F | F | F |
| I-552 | 3-(2-cloro-piridin-4-il)-alilo         | H | F | F | F |
| I-553 | 4-clorobencilo                         | F | H | F | F |
| I-554 | Cinamilo                               | F | H | F | F |
| I-555 | 4-clorocinamilo                        | F | H | F | F |
| I-556 | 4-fluorocinamilo                       | F | H | F | F |
| I-557 | 4-bromocinamilo                        | F | H | F | F |
| I-558 | 4-trifluorometilcinamilo               | F | H | F | F |
| I-559 | 4-trifluorometoxicinamilo              | F | H | F | F |

|       |                                         |   |   |   |   |
|-------|-----------------------------------------|---|---|---|---|
| I-560 | 4-pentafluoroetoxicinamilo              | F | H | F | F |
| I-561 | 4-metoxicinamilo                        | F | H | F | F |
| I-562 | 4-etoxicinamilo                         | F | H | F | F |
| I-563 | 4-cianocinamilo                         | F | H | F | F |
| I-564 | 3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo          | F | H | F | F |
| I-565 | 3-(4-clorofenil)-but-2-enilo            | F | H | F | F |
| I-566 | 3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo         | F | H | F | F |
| I-567 | 3-cloro-4-fluoro-cinamilo               | F | H | F | F |
| I-568 | 3,5-dicloro-cinamilo                    | F | H | F | F |
| I-569 | 5-fenil-penta-2,4-dienilo               | F | H | F | F |
| I-570 | 4-isopropiloxycarbonilamino-cinamilo    | F | H | F | F |
| I-571 | 3-naftalen-2-il-alilo                   | F | H | F | F |
| I-572 | 3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo | F | H | F | F |
| I-573 | 3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo          | F | H | F | F |
| I-574 | 3-piridin-4-il-alilo                    | F | H | F | F |
| I-575 | 3-(2-cloro-piridin-4-il)-alilo          | F | H | F | F |
| I-576 | 4-clorobencilo                          | F | F | H | F |
| I-577 | Cinamilo                                | F | F | H | F |
| I-578 | 4-clorocinamilo                         | F | F | H | F |
| I-579 | 4-fluorocinamilo                        | F | F | H | F |
| I-580 | 4-bromocinamilo                         | F | F | H | F |
| I-581 | 4-trifluorometilcinamilo                | F | F | H | F |
| I-582 | 4-trifluorometoxicinamilo               | F | F | H | F |
| I-583 | 4-pentafluoroetoxicinamilo              | F | F | H | F |
| I-584 | 4-metoxicinamilo                        | F | F | H | F |
| I-585 | 4-etoxicinamilo                         | F | F | H | F |
| I-586 | 4-cianocinamilo                         | F | F | H | F |

|       |                                         |   |   |   |   |
|-------|-----------------------------------------|---|---|---|---|
| I-587 | 3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo          | F | F | H | F |
| I-588 | 3-(4-clorofenil)-but-2-enilo            | F | F | H | F |
| I-589 | 3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo         | F | F | H | F |
| I-590 | 3-cloro-4-fluoro-cinamilo               | F | F | H | F |
| I-591 | 3,5-dicloro-cinamilo                    | F | F | H | F |
| I-592 | 5-fenil-penta-2,4-dienilo               | F | F | H | F |
| I-593 | 4-isopropiloxycarbonilamino-cinamilo    | F | F | H | F |
| I-594 | 3-naftalen-2-il-alilo                   | F | F | H | F |
| I-595 | 3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo | F | F | H | F |
| I-596 | 3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo          | F | F | H | F |
| I-597 | 3-piridin-4-il-alilo                    | F | F | H | F |
| I-598 | 3-(2-cloro-piridin-4-il)-alilo          | F | F | H | F |
| I-599 | 4-clorobencilo                          | F | F | F | H |
| I-600 | Cinamilo                                | F | F | F | H |
| I-601 | 4-clorocinamilo                         | F | F | F | H |
| I-602 | 4-fluorocinamilo                        | F | F | F | H |
| I-603 | 4-bromocinamilo                         | F | F | F | H |
| I-604 | 4-trifluorometilcinamilo                | F | F | F | H |
| I-605 | 4-trifluorometoxicinamilo               | F | F | F | H |
| I-606 | 4-pentafluoroetoxicinamilo              | F | F | F | H |
| I-607 | 4-metoxicinamilo                        | F | F | F | H |
| I-608 | 4-etoxicinamilo                         | F | F | F | H |
| I-609 | 4-cianocinamilo                         | F | F | F | H |
| I-610 | 3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo          | F | F | F | H |
| I-611 | 3-(4-clorofenil)-but-2-enilo            | F | F | F | H |
| I-612 | 3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo         | F | F | F | H |
| I-613 | 3-cloro-4-fluoro-cinamilo               | F | F | F | H |

|       |                                         |   |    |    |    |
|-------|-----------------------------------------|---|----|----|----|
| I-614 | 3,5-dicloro-cinamilo                    | F | F  | F  | H  |
| I-615 | 5-fenil-penta-2,4-dienilo               | F | F  | F  | H  |
| I-616 | 4-isopropiloxycarbonilamino-cinamilo    | F | F  | F  | H  |
| I-617 | 3-naftalen-2-il-alilo                   | F | F  | F  | H  |
| I-618 | 3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo | F | F  | F  | H  |
| I-619 | 3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo          | F | F  | F  | H  |
| I-620 | 3-piridin-4-il-alilo                    | F | F  | F  | H  |
| I-621 | 3-(2-cloro-piridin-4-il)-alilo          | F | F  | F  | H  |
| I-622 | 4-clorobencilo                          | H | Cl | Cl | Cl |
| I-623 | Cinamilo                                | H | Cl | Cl | Cl |
| I-624 | 4-clorocinamilo                         | H | Cl | Cl | Cl |
| I-625 | 4-fluorocinamilo                        | H | Cl | Cl | Cl |
| I-626 | 4-bromocinamilo                         | H | Cl | Cl | Cl |
| I-627 | 4-trifluorometilcinamilo                | H | Cl | Cl | Cl |
| I-628 | 4-trifluorometoxicinamilo               | H | Cl | Cl | Cl |
| I-629 | 4-pentafluoroetoxicinamilo              | H | Cl | Cl | Cl |
| I-630 | 4-metoxicinamilo                        | H | Cl | Cl | Cl |
| I-631 | 4-etoxicinamilo                         | H | Cl | Cl | Cl |
| I-632 | 4-cianocinamilo                         | H | Cl | Cl | Cl |
| I-633 | 3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo          | H | Cl | Cl | Cl |
| I-634 | 3-(4-clorofenil)-but-2-enilo            | H | Cl | Cl | Cl |
| I-635 | 3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo         | H | Cl | Cl | Cl |
| I-636 | 3-cloro-4-fluoro-cinamilo               | H | Cl | Cl | Cl |
| I-637 | 3,5-dicloro-cinamilo                    | H | Cl | Cl | Cl |
| I-638 | 5-fenil-penta-2,4-dienilo               | H | Cl | Cl | Cl |
| I-639 | 4-isopropiloxycarbonilamino-cinamilo    | H | Cl | Cl | Cl |

|       |                                             |    |    |    |    |
|-------|---------------------------------------------|----|----|----|----|
| I-640 | 3-naftalen-2-il-alilo                       | H  | Cl | Cl | Cl |
| I-641 | 3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-<br>alilo | H  | Cl | Cl | Cl |
| I-642 | 3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo              | H  | Cl | Cl | Cl |
| I-643 | 3-piridin-4-il-alilo                        | H  | Cl | Cl | Cl |
| I-644 | 3-(2-cloro-piridin-4-il)-alilo              | H  | Cl | Cl | Cl |
| I-645 | 4-clorobencilo                              | Cl | H  | Cl | Cl |
| I-646 | Cinamilo                                    | Cl | H  | Cl | Cl |
| I-647 | 4-clorocinamilo                             | Cl | H  | Cl | Cl |
| I-648 | 4-fluorocinamilo                            | Cl | H  | Cl | Cl |
| I-649 | 4-bromocinamilo                             | Cl | H  | Cl | Cl |
| I-650 | 4-trifluorometilcinamilo                    | Cl | H  | Cl | Cl |
| I-651 | 4-trifluorometoxicinamilo                   | Cl | H  | Cl | Cl |
| I-652 | 4-pentafluoroetoxicinamilo                  | Cl | H  | Cl | Cl |
| I-653 | 4-metoxicinamilo                            | Cl | H  | Cl | Cl |
| I-654 | 4-etoxicinamilo                             | Cl | H  | Cl | Cl |
| I-655 | 4-cianocinamilo                             | Cl | H  | Cl | Cl |
| I-656 | 3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo              | Cl | H  | Cl | Cl |
| I-657 | 3-(4-clorofenil)-but-2-enilo                | Cl | H  | Cl | Cl |
| I-658 | 3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo             | Cl | H  | Cl | Cl |
| I-659 | 3-cloro-4-fluoro-cinamilo                   | Cl | H  | Cl | Cl |
| I-660 | 3,5-dicloro-cinamilo                        | Cl | H  | Cl | Cl |
| I-661 | 5-fenil-penta-2,4-dienilo                   | Cl | H  | Cl | Cl |
| I-662 | 4-isopropiloxycarbonilamino-<br>cinamilo    | Cl | H  | Cl | Cl |
| I-663 | 3-naftalen-2-il-alilo                       | Cl | H  | Cl | Cl |
| I-664 | 3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-<br>alilo | Cl | H  | Cl | Cl |
| I-665 | 3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo              | Cl | H  | Cl | Cl |

|       |                                         |    |    |    |    |
|-------|-----------------------------------------|----|----|----|----|
| I-666 | 3-piridin-4-il-alilo                    | Cl | H  | Cl | Cl |
| I-667 | 3-(2-cloro-piridin-4-il)-alilo          | Cl | H  | Cl | Cl |
| I-668 | 4-clorobencilo                          | Cl | Cl | H  | Cl |
| I-669 | Cinamilo                                | Cl | Cl | H  | Cl |
| I-670 | 4-clorocinamilo                         | Cl | Cl | H  | Cl |
| I-671 | 4-fluorocinamilo                        | Cl | Cl | H  | Cl |
| I-672 | 4-bromocinamilo                         | Cl | Cl | H  | Cl |
| I-673 | 4-trifluorometilcinamilo                | Cl | Cl | H  | Cl |
| I-674 | 4-trifluorometoxicinamilo               | Cl | Cl | H  | Cl |
| I-675 | 4-pentafluoroetoxicinamilo              | Cl | Cl | H  | Cl |
| I-676 | 4-metoxicinamilo                        | Cl | Cl | H  | Cl |
| I-677 | 4-etoxicinamilo                         | Cl | Cl | H  | Cl |
| I-678 | 4-cianocinamilo                         | Cl | Cl | H  | Cl |
| I-679 | 3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo          | Cl | Cl | H  | Cl |
| I-680 | 3-(4-clorofenil)-but-2-enilo            | Cl | Cl | H  | Cl |
| I-681 | 3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo         | Cl | Cl | H  | Cl |
| I-682 | 3-cloro-4-fluoro-cinamilo               | Cl | Cl | H  | Cl |
| I-683 | 3,5-dicloro-cinamilo                    | Cl | Cl | H  | Cl |
| I-684 | 5-fenil-penta-2,4-dienilo               | Cl | Cl | H  | Cl |
| I-685 | 4-isopropiloxycarbonilamino-cinamilo    | Cl | Cl | H  | Cl |
| I-686 | 3-naftalen-2-il-alilo                   | Cl | Cl | H  | Cl |
| I-687 | 3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo | Cl | Cl | H  | Cl |
| I-688 | 3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo          | Cl | Cl | H  | Cl |
| I-689 | 3-piridin-4-il-alilo                    | Cl | Cl | H  | Cl |
| I-690 | 3-(2-cloro-piridin-4-il)-alilo          | Cl | Cl | H  | Cl |
| I-691 | 4-clorobencilo                          | Cl | Cl | Cl | H  |
| I-692 | Cinamilo                                | Cl | Cl | Cl | H  |

|       |                                         |    |    |    |    |
|-------|-----------------------------------------|----|----|----|----|
| I-693 | 4-clorocinamilo                         | Cl | Cl | Cl | H  |
| I-694 | 4-fluorocinamilo                        | Cl | Cl | Cl | H  |
| I-695 | 4-bromocinamilo                         | Cl | Cl | Cl | H  |
| I-696 | 4-trifluorometilcinamilo                | Cl | Cl | Cl | H  |
| I-697 | 4-trifluorometoxicinamilo               | Cl | Cl | Cl | H  |
| I-698 | 4-pentafluoroetoxicinamilo              | Cl | Cl | Cl | H  |
| I-699 | 4-metoxicinamilo                        | Cl | Cl | Cl | H  |
| I-700 | 4-etoxicinamilo                         | Cl | Cl | Cl | H  |
| I-701 | 4-cianocinamilo                         | Cl | Cl | Cl | H  |
| I-702 | 3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo          | Cl | Cl | Cl | H  |
| I-703 | 3-(4-clorofenil)-but-2-enilo            | Cl | Cl | Cl | H  |
| I-704 | 3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo         | Cl | Cl | Cl | H  |
| I-705 | 3-cloro-4-fluoro-cinamilo               | Cl | Cl | Cl | H  |
| I-706 | 3,5-dicloro-cinamilo                    | Cl | Cl | Cl | H  |
| I-707 | 5-fenil-penta-2,4-dienilo               | Cl | Cl | Cl | H  |
| I-708 | 4-isopropiloxycarbonilamino-cinamilo    | Cl | Cl | Cl | H  |
| I-709 | 3-naftalen-2-il-alilo                   | Cl | Cl | Cl | H  |
| I-710 | 3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo | Cl | Cl | Cl | H  |
| I-711 | 3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo          | Cl | Cl | Cl | H  |
| I-712 | 3-piridin-4-il-alilo                    | Cl | Cl | Cl | H  |
| I-713 | 3-(2-cloro-piridin-4-il)-alilo          | Cl | Cl | Cl | H  |
| I-714 | 4-clorobencilo                          | Cl | Cl | Cl | Cl |
| I-715 | Cinamilo                                | Cl | Cl | Cl | Cl |
| I-716 | 4-clorocinamilo                         | Cl | Cl | Cl | Cl |
| I-717 | 4-fluorocinamilo                        | Cl | Cl | Cl | Cl |
| I-718 | 4-bromocinamilo                         | Cl | Cl | Cl | Cl |
| I-719 | 4-trifluorometilcinamilo                | Cl | Cl | Cl | Cl |

|       |                                         |    |    |    |    |
|-------|-----------------------------------------|----|----|----|----|
| I-720 | 4-trifluorometoxicinamilo               | Cl | Cl | Cl | Cl |
| I-721 | 4-pentafluoroetoxicinamilo              | Cl | Cl | Cl | Cl |
| I-722 | 4-metoxicinamilo                        | Cl | Cl | Cl | Cl |
| I-723 | 4-etoxicinamilo                         | Cl | Cl | Cl | Cl |
| I-724 | 4-cianocinamilo                         | Cl | Cl | Cl | Cl |
| I-725 | 3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo          | Cl | Cl | Cl | Cl |
| I-726 | 3-(4-clorofenil)-but-2-enilo            | Cl | Cl | Cl | Cl |
| I-727 | 3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo         | Cl | Cl | Cl | Cl |
| I-728 | 3-cloro-4-fluoro-cinamilo               | Cl | Cl | Cl | Cl |
| I-729 | 3,5-dicloro-cinamilo                    | Cl | Cl | Cl | Cl |
| I-730 | 5-fenil-penta-2,4-dienilo               | Cl | Cl | Cl | Cl |
| I-731 | 4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo    | Cl | Cl | Cl | Cl |
| I-732 | 3-naftalen-2-il-alilo                   | Cl | Cl | Cl | Cl |
| I-733 | 3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo | Cl | Cl | Cl | Cl |
| I-734 | 3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo          | Cl | Cl | Cl | Cl |
| I-735 | 3-piridin-4-il-alilo                    | Cl | Cl | Cl | Cl |
| I-736 | 3-(2-cloro-piridin-4-il)-alilo          | Cl | Cl | Cl | Cl |
| I-737 | 4-clorobencilo                          | F  | F  | F  | F  |
| I-738 | Cinamilo                                | F  | F  | F  | F  |
| I-739 | 4-clorocinamilo                         | F  | F  | F  | F  |
| I-740 | 4-fluorocinamilo                        | F  | F  | F  | F  |
| I-741 | 4-bromocinamilo                         | F  | F  | F  | F  |
| I-742 | 4-trifluorometilcinamilo                | F  | F  | F  | F  |
| I-743 | 4-trifluorometoxicinamilo               | F  | F  | F  | F  |
| I-744 | 4-pentafluoroetoxicinamilo              | F  | F  | F  | F  |
| I-745 | 4-metoxicinamilo                        | F  | F  | F  | F  |
| I-746 | 4-etoxicinamilo                         | F  | F  | F  | F  |

|       |                                         |   |   |   |   |
|-------|-----------------------------------------|---|---|---|---|
| I-747 | 4-cianocinamilo                         | F | F | F | F |
| I-748 | 3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo          | F | F | F | F |
| I-749 | 3-(4-clorofenil)-but-2-enilo            | F | F | F | F |
| I-750 | 3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo         | F | F | F | F |
| I-751 | 3-cloro-4-fluoro-cinamilo               | F | F | F | F |
| I-752 | 3,5-dicloro-cinamilo                    | F | F | F | F |
| I-753 | 5-fenil-penta-2,4-dienilo               | F | F | F | F |
| I-754 | 4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo    | F | F | F | F |
| I-755 | 3-naftalen-2-il-alilo                   | F | F | F | F |
| I-756 | 3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo | F | F | F | F |
| I-757 | 3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo          | F | F | F | F |
| I-758 | 3-piridin-4-il-alilo                    | F | F | F | F |
| I-759 | 3-(2-cloro-piridin-4-il)-alilo          | F | F | F | F |
| I-760 | 4-clorobencilo                          | H | F | H | F |
| I-761 | Cinamilo                                | H | F | H | F |
| I-762 | 4-clorocinamilo                         | H | F | H | F |
| I-763 | 4-fluorocinamilo                        | H | F | H | F |
| I-764 | 4-bromocinamilo                         | H | F | H | F |
| I-765 | 4-trifluorometilcinamilo                | H | F | H | F |
| I-766 | 4-trifluorometoxicinamilo               | H | F | H | F |
| I-767 | 4-pentafluoroetoxicinamilo              | H | F | H | F |
| I-768 | 4-metoxicinamilo                        | H | F | H | F |
| I-769 | 4-etoxicinamilo                         | H | F | H | F |
| I-770 | 4-cianocinamilo                         | H | F | H | F |
| I-771 | 3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo          | H | F | H | F |
| I-772 | 3-(4-clorofenil)-but-2-enilo            | H | F | H | F |
| I-773 | 3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo         | H | F | H | F |

|       |                                         |   |   |   |   |
|-------|-----------------------------------------|---|---|---|---|
| I-774 | 3-cloro-4-fluoro-cinamilo               | H | F | H | F |
| I-775 | 3,5-dicloro-cinamilo                    | H | F | H | F |
| I-776 | 5-fenil-penta-2,4-dienilo               | H | F | H | F |
| I-777 | 4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo    | H | F | H | F |
| I-778 | 3-naftalen-2-il-alilo                   | H | F | H | F |
| I-779 | 3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo | H | F | H | F |
| I-780 | 3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo          | H | F | H | F |
| I-781 | 3-piridin-4-il-alilo                    | H | F | H | F |
| I-782 | 3-(2-cloro-piridin-4-il)-alilo          | H | F | H | F |
| I-783 | 4-clorobencilo                          | H | F | F | H |
| I-784 | Cinamilo                                | H | F | F | H |
| I-785 | 4-clorocinamilo                         | H | F | F | H |
| I-786 | 4-fluorocinamilo                        | H | F | F | H |
| I-787 | 4-bromocinamilo                         | H | F | F | H |
| I-788 | 4-trifluorometilcinamilo                | H | F | F | H |
| I-789 | 4-trifluorometoxicinamilo               | H | F | F | H |
| I-790 | 4-pentafluoroetoxicinamilo              | H | F | F | H |
| I-791 | 4-metoxicinamilo                        | H | F | F | H |
| I-792 | 4-etoxicinamilo                         | H | F | F | H |
| I-793 | 4-cianocinamilo                         | H | F | F | H |
| I-794 | 3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo          | H | F | F | H |
| I-795 | 3-(4-clorofenil)-but-2-enilo            | H | F | F | H |
| I-796 | 3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo         | H | F | F | H |
| I-797 | 3-cloro-4-fluoro-cinamilo               | H | F | F | H |
| I-798 | 3,5-dicloro-cinamilo                    | H | F | F | H |
| I-799 | 5-fenil-penta-2,4-dienilo               | H | F | F | H |
| I-800 | 4-isopropiloxicarbonilamino-            | H | F | F | H |

|       |                                             |   |   |   |   |
|-------|---------------------------------------------|---|---|---|---|
|       | cinamilo                                    |   |   |   |   |
| I-801 | 3-naftalen-2-il-alilo                       | H | F | F | H |
| I-802 | 3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-<br>alilo | H | F | F | H |
| I-803 | 3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo              | H | F | F | H |
| I-804 | 3-piridin-4-il-alilo                        | H | F | F | H |
| I-805 | 3-(2-cloro-piridin-4-il)-alilo              | H | F | F | H |
| I-806 | 4-clorobencilo                              | H | F | F | H |
| I-807 | Cinamilo                                    | H | H | F | F |
| I-808 | 4-clorocinamilo                             | H | H | F | F |
| I-809 | 4-fluorocinamilo                            | H | H | F | F |
| I-810 | 4-bromocinamilo                             | H | H | F | F |
| I-811 | 4-trifluorometilcinamilo                    | H | H | F | F |
| I-812 | 4-trifluorometoxicinamilo                   | H | H | F | F |
| I-813 | 4-pentafluoroetoxicinamilo                  | H | H | F | F |
| I-814 | 4-metoxicinamilo                            | H | H | F | F |
| I-815 | 4-etoxicinamilo                             | H | H | F | F |
| I-816 | 4-cianocinamilo                             | H | H | F | F |
| I-817 | 3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo              | H | H | F | F |

|       |                                         |   |   |    |    |
|-------|-----------------------------------------|---|---|----|----|
| I-818 | 3-(4-clorofenil)-but-2-enilo            | H | H | F  | F  |
| I-819 | 3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo         | H | H | F  | F  |
| I-820 | 3-cloro-4-fluoro-cinamilo               | H | H | F  | F  |
| I-821 | 3,5-dicloro-cinamilo                    | H | H | F  | F  |
| I-822 | 5-fenil-penta-2,4-dienilo               | H | H | F  | F  |
| I-823 | 4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo    | H | H | F  | F  |
| I-824 | 3-naftalen-2-il-alilo                   | H | H | F  | F  |
| I-825 | 3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo | H | H | F  | F  |
| I-826 | 3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo          | H | H | F  | F  |
| I-827 | 3-piridin-4-il-alilo                    | H | H | F  | F  |
| I-828 | 3-(2-cloro-piridin-4-il)-alilo          | H | H | F  | F  |
| I-829 | 4-clorobencilo                          | H | H | Cl | Cl |
| I-830 | Cinamilo                                | H | H | Cl | Cl |
| I-831 | 4-clorocinamilo                         | H | H | Cl | Cl |
| I-832 | 4-fluorocinamilo                        | H | H | Cl | Cl |
| I-833 | 4-bromocinamilo                         | H | H | Cl | Cl |
| I-834 | 4-trifluorometilcinamilo                | H | H | Cl | Cl |
| I-835 | 4-trifluorometoxicinamilo               | H | H | Cl | Cl |
| I-836 | 4-pentafluoroetoxicinamilo              | H | H | Cl | Cl |
| I-837 | 4-metoxicinamilo                        | H | H | Cl | Cl |
| I-838 | 4-etoxicinamilo                         | H | H | Cl | Cl |
| I-839 | 4-cianocinamilo                         | H | H | Cl | Cl |
| I-840 | 3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo          | H | H | Cl | Cl |
| I-841 | 3-(4-clorofenil)-but-2-enilo            | H | H | Cl | Cl |
| I-842 | 3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo         | H | H | Cl | Cl |
| I-843 | 3-cloro-4-fluoro-cinamilo               | H | H | Cl | Cl |

|       |                                         |   |    |    |    |
|-------|-----------------------------------------|---|----|----|----|
| I-844 | 3,5-dicloro-cinamilo                    | H | H  | Cl | Cl |
| I-845 | 5-fenil-penta-2,4-dienilo               | H | H  | Cl | Cl |
| I-846 | 4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo    | H | H  | Cl | Cl |
| I-847 | 3-naftalen-2-il-alilo                   | H | H  | Cl | Cl |
| I-848 | 3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo | H | H  | Cl | Cl |
| I-849 | 3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo          | H | H  | Cl | Cl |
| I-850 | 3-piridin-4-il-alilo                    | H | H  | Cl | Cl |
| I-851 | 3-(2-cloro-piridin-4-il)-alilo          | H | H  | Cl | Cl |
| I-852 | 4-clorobencilo                          | H | Cl | Cl | H  |
| I-853 | Cinamilo                                | H | Cl | Cl | H  |
| I-854 | 4-clorocinamilo                         | H | Cl | Cl | H  |
| I-855 | 4-fluorocinamilo                        | H | Cl | Cl | H  |
| I-856 | 4-bromocinamilo                         | H | Cl | Cl | H  |
| I-857 | 4-trifluorometilcinamilo                | H | Cl | Cl | H  |
| I-858 | 4-trifluorometoxicinamilo               | H | Cl | Cl | H  |
| I-859 | 4-pentafluoroetoxicinamilo              | H | Cl | Cl | H  |
| I-860 | 4-metoxicinamilo                        | H | Cl | Cl | H  |
| I-861 | 4-etoxicinamilo                         | H | Cl | Cl | H  |
| I-862 | 4-cianocinamilo                         | H | Cl | Cl | H  |
| I-863 | 3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo          | H | Cl | Cl | H  |
| I-864 | 3-(4-clorofenil)-but-2-enilo            | H | Cl | Cl | H  |
| I-865 | 3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo         | H | Cl | Cl | H  |
| I-866 | 3-cloro-4-fluoro-cinamilo               | H | Cl | Cl | H  |
| I-867 | 3,5-dicloro-cinamilo                    | H | Cl | Cl | H  |
| I-868 | 5-fenil-penta-2,4-dienilo               | H | Cl | Cl | H  |
| I-869 | 4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo    | H | Cl | Cl | H  |

|       |                                             |   |    |    |    |
|-------|---------------------------------------------|---|----|----|----|
| I-870 | 3-naftalen-2-il-alilo                       | H | Cl | Cl | H  |
| I-871 | 3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-<br>alilo | H | Cl | Cl | H  |
| I-872 | 3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo              | H | Cl | Cl | H  |
| I-873 | 3-piridin-4-il-alilo                        | H | Cl | Cl | H  |
| I-874 | 3-(2-cloro-piridin-4-il)-alilo              | H | Cl | Cl | H  |
| I-875 | 4-clorobencilo                              | H | Cl | H  | Cl |
| I-876 | Cinamilo                                    | H | Cl | H  | Cl |
| I-877 | 4-clorocinamilo                             | H | Cl | H  | Cl |
| I-878 | 4-fluorocinamilo                            | H | Cl | H  | Cl |
| I-879 | 4-bromocinamilo                             | H | Cl | H  | Cl |
| I-880 | 4-trifluorometilcinamilo                    | H | Cl | H  | Cl |
| I-881 | 4-trifluorometoxicinamilo                   | H | Cl | H  | Cl |
| I-882 | 4-pentafluoroetoxicinamilo                  | H | Cl | H  | Cl |
| I-883 | 4-metoxicinamilo                            | H | Cl | H  | Cl |
| I-884 | 4-etoxicinamilo                             | H | Cl | H  | Cl |
| I-885 | 4-cianocinamilo                             | H | Cl | H  | Cl |
| I-886 | 3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo              | H | Cl | H  | Cl |
| I-887 | 3-(4-clorofenil)-but-2-enilo                | H | Cl | H  | Cl |
| I-888 | 3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo             | H | Cl | H  | Cl |
| I-889 | 3-cloro-4-fluoro-cinamilo                   | H | Cl | H  | Cl |
| I-890 | 3,5-dicloro-cinamilo                        | H | Cl | H  | Cl |
| I-891 | 5-fenil-penta-2,4-dienilo                   | H | Cl | H  | Cl |
| I-892 | 4-isopropiloxicarbonilamino-<br>cinamilo    | H | Cl | H  | Cl |
| I-893 | 3-naftalen-2-il-alilo                       | H | Cl | H  | Cl |
| I-894 | 3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-<br>alilo | H | Cl | H  | Cl |
| I-895 | 3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo              | H | Cl | H  | Cl |

|       |                                         |   |    |                 |    |
|-------|-----------------------------------------|---|----|-----------------|----|
| I-896 | 3-piridin-4-il-alilo                    | H | Cl | H               | Cl |
| I-897 | 3-(2-cloro-piridin-4-il)-alilo          | H | Cl | H               | Cl |
| I-898 | 4-clorobencilo                          | H | H  | CH <sub>3</sub> | H  |
| I-899 | Cinamilo                                | H | H  | CH <sub>3</sub> | H  |
| I-900 | 4-clorocinamilo                         | H | H  | CH <sub>3</sub> | H  |
| I-901 | 4-fluorocinamilo                        | H | H  | CH <sub>3</sub> | H  |
| I-902 | 4-bromocinamilo                         | H | H  | CH <sub>3</sub> | H  |
| I-903 | 4-trifluorometilcinamilo                | H | H  | CH <sub>3</sub> | H  |
| I-904 | 4-trifluorometoxicinamilo               | H | H  | CH <sub>3</sub> | H  |
| I-905 | 4-pentafluoroetoxicinamilo              | H | H  | CH <sub>3</sub> | H  |
| I-906 | 4-metoxicinamilo                        | H | H  | CH <sub>3</sub> | H  |
| I-907 | 4-etoxicinamilo                         | H | H  | CH <sub>3</sub> | H  |
| I-908 | 4-cianocinamilo                         | H | H  | CH <sub>3</sub> | H  |
| I-909 | 3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo          | H | H  | CH <sub>3</sub> | H  |
| I-910 | 3-(4-clorofenil)-but-2-enilo            | H | H  | CH <sub>3</sub> | H  |
| I-911 | 3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo         | H | H  | CH <sub>3</sub> | H  |
| I-912 | 3-cloro-4-fluoro-cinamilo               | H | H  | CH <sub>3</sub> | H  |
| I-913 | 3,5-dicloro-cinamilo                    | H | H  | CH <sub>3</sub> | H  |
| I-914 | 5-fenil-penta-2,4-dienilo               | H | H  | CH <sub>3</sub> | H  |
| I-915 | 4-isopropiloxycarbonilamino-cinamilo    | H | H  | CH <sub>3</sub> | H  |
| I-916 | 3-naftalen-2-il-alilo                   | H | H  | CH <sub>3</sub> | H  |
| I-917 | 3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo | H | H  | CH <sub>3</sub> | H  |
| I-918 | 3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo          | H | H  | CH <sub>3</sub> | H  |
| I-919 | 3-piridin-4-il-alilo                    | H | H  | CH <sub>3</sub> | H  |
| I-920 | 3-(2-cloro-piridin-4-il)-alilo          | H | H  | CH <sub>3</sub> | H  |
| I-921 | 4-clorobencilo                          | H | H  | CF <sub>3</sub> | H  |
| I-922 | Cinamilo                                | H | H  | CF <sub>3</sub> | H  |

|       |                                         |   |   |                  |   |
|-------|-----------------------------------------|---|---|------------------|---|
| I-923 | 4-clorocinamilo                         | H | H | CF <sub>3</sub>  | H |
| I-924 | 4-fluorocinamilo                        | H | H | CF <sub>3</sub>  | H |
| I-925 | 4-bromocinamilo                         | H | H | CF <sub>3</sub>  | H |
| I-926 | 4-trifluorometilcinamilo                | H | H | CF <sub>3</sub>  | H |
| I-927 | 4-trifluorometoxicinamilo               | H | H | CF <sub>3</sub>  | H |
| I-928 | 4-pentafluoroetoxicinamilo              | H | H | CF <sub>3</sub>  | H |
| I-929 | 4-metoxicinamilo                        | H | H | CF <sub>3</sub>  | H |
| I-930 | 4-etoxicinamilo                         | H | H | CF <sub>3</sub>  | H |
| I-931 | 4-cianocinamilo                         | H | H | CF <sub>3</sub>  | H |
| I-932 | 3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo          | H | H | CF <sub>3</sub>  | H |
| I-933 | 3-(4-clorofenil)-but-2-enilo            | H | H | CF <sub>3</sub>  | H |
| I-934 | 3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo         | H | H | CF <sub>3</sub>  | H |
| I-935 | 3-cloro-4-fluoro-cinamilo               | H | H | CF <sub>3</sub>  | H |
| I-936 | 3,5-dicloro-cinamilo                    | H | H | CF <sub>3</sub>  | H |
| I-937 | 5-fenil-penta-2,4-dienilo               | H | H | CF <sub>3</sub>  | H |
| I-938 | 4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo    | H | H | CF <sub>3</sub>  | H |
| I-939 | 3-naftalen-2-il-alilo                   | H | H | CF <sub>3</sub>  | H |
| I-940 | 3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo | H | H | CF <sub>3</sub>  | H |
| I-941 | 3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo          | H | H | CF <sub>3</sub>  | H |
| I-942 | 3-piridin-4-il-alilo                    | H | H | CF <sub>3</sub>  | H |
| I-943 | 3-(2-cloro-piridin-4-il)-alilo          | H | H | CF <sub>3</sub>  | H |
| I-944 | 4-clorobencilo                          | H | H | OCH <sub>3</sub> | H |
| I-945 | Cinamilo                                | H | H | OCH <sub>3</sub> | H |
| I-946 | 4-clorocinamilo                         | H | H | OCH <sub>3</sub> | H |
| I-947 | 4-fluorocinamilo                        | H | H | OCH <sub>3</sub> | H |
| I-948 | 4-bromocinamilo                         | H | H | OCH <sub>3</sub> | H |
| I-949 | 4-trifluorometilcinamilo                | H | H | OCH <sub>3</sub> | H |

|       |                                         |   |   |                                 |   |
|-------|-----------------------------------------|---|---|---------------------------------|---|
| I-950 | 4-trifluorometoxicinamilo               | H | H | OCH <sub>3</sub>                | H |
| I-951 | 4-pentafluoroetoxicinamilo              | H | H | OCH <sub>3</sub>                | H |
| I-952 | 4-metoxicinamilo                        | H | H | OCH <sub>3</sub>                | H |
| I-953 | 4-etoxicinamilo                         | H | H | OCH <sub>3</sub>                | H |
| I-954 | 4-cianocinamilo                         | H | H | OCH <sub>3</sub>                | H |
| I-955 | 3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo          | H | H | OCH <sub>3</sub>                | H |
| I-956 | 3-(4-clorofenil)-but-2-enilo            | H | H | OCH <sub>3</sub>                | H |
| I-957 | 3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo         | H | H | OCH <sub>3</sub>                | H |
| I-958 | 3-cloro-4-fluoro-cinamilo               | H | H | OCH <sub>3</sub>                | H |
| I-959 | 3,5-dicloro-cinamilo                    | H | H | OCH <sub>3</sub>                | H |
| I-960 | 5-fenil-penta-2,4-dienilo               | H | H | OCH <sub>3</sub>                | H |
| I-961 | 4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo    | H | H | OCH <sub>3</sub>                | H |
| I-962 | 3-naftalen-2-il-alilo                   | H | H | OCH <sub>3</sub>                | H |
| I-963 | 3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo | H | H | OCH <sub>3</sub>                | H |
| I-964 | 3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo          | H | H | OCH <sub>3</sub>                | H |
| I-965 | 3-piridin-4-il-alilo                    | H | H | OCH <sub>3</sub>                | H |
| I-966 | 3-(2-cloro-piridin-4-il)-alilo          | H | H | OCH <sub>3</sub>                | H |
| I-967 | 4-clorobencilo                          | H | H | CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | H |
| I-968 | Cinamilo                                | H | H | CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | H |
| I-969 | 4-clorocinamilo                         | H | H | CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | H |
| I-970 | 4-fluorocinamilo                        | H | H | CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | H |
| I-971 | 4-bromocinamilo                         | H | H | CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | H |
| I-972 | 4-trifluorometilcinamilo                | H | H | CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | H |
| I-973 | 4-trifluorometoxicinamilo               | H | H | CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | H |
| I-974 | 4-pentafluoroetoxicinamilo              | H | H | CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | H |
| I-975 | 4-metoxicinamilo                        | H | H | CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | H |
| I-976 | 4-etoxicinamilo                         | H | H | CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | H |

|        |                                         |                 |   |                                 |   |
|--------|-----------------------------------------|-----------------|---|---------------------------------|---|
| I-977  | 4-cianocinamilo                         | H               | H | CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | H |
| I-978  | 3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo          | H               | H | CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | H |
| I-979  | 3-(4-clorofenil)-but-2-enilo            | H               | H | CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | H |
| I-980  | 3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo         | H               | H | CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | H |
| I-981  | 3-cloro-4-fluoro-cinamilo               | H               | H | CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | H |
| I-982  | 3,5-dicloro-cinamilo                    | H               | H | CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | H |
| I-983  | 5-fenil-penta-2,4-dienilo               | H               | H | CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | H |
| I-984  | 4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo    | H               | H | CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | H |
| I-985  | 3-naftalen-2-il-alilo                   | H               | H | CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | H |
| I-986  | 3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo | H               | H | CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | H |
| I-987  | 3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo          | H               | H | CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | H |
| I-988  | 3-piridin-4-il-alilo                    | H               | H | CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | H |
| I-989  | 3-(2-cloro-piridin-4-il)-alilo          | H               | H | CO <sub>2</sub> CH <sub>3</sub> | H |
| I-990  | 4-clorobencilo                          | CH <sub>3</sub> | H | H                               | H |
| I-991  | Cinamilo                                | CH <sub>3</sub> | H | H                               | H |
| I-992  | 4-clorocinamilo                         | CH <sub>3</sub> | H | H                               | H |
| I-993  | 4-fluorocinamilo                        | CH <sub>3</sub> | H | H                               | H |
| I-994  | 4-bromocinamilo                         | CH <sub>3</sub> | H | H                               | H |
| I-995  | 4-trifluorometilcinamilo                | CH <sub>3</sub> | H | H                               | H |
| I-996  | 4-trifluorometoxicinamilo               | CH <sub>3</sub> | H | H                               | H |
| I-997  | 4-pentafluoroetoxicinamilo              | CH <sub>3</sub> | H | H                               | H |
| I-998  | 4-metoxicinamilo                        | CH <sub>3</sub> | H | H                               | H |
| I-999  | 4-etoxicinamilo                         | CH <sub>3</sub> | H | H                               | H |
| I-1000 | 4-cianocinamilo                         | CH <sub>3</sub> | H | H                               | H |
| I-1001 | 3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo          | CH <sub>3</sub> | H | H                               | H |
| I-1002 | 3-(4-clorofenil)-but-2-enilo            | CH <sub>3</sub> | H | H                               | H |
| I-1003 | 3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo         | CH <sub>3</sub> | H | H                               | H |

|        |                                         |                 |                 |   |   |
|--------|-----------------------------------------|-----------------|-----------------|---|---|
| I-1004 | 3-cloro-4-fluoro-cinamilo               | CH <sub>3</sub> | H               | H | H |
| I-1005 | 3,5-dicloro-cinamilo                    | CH <sub>3</sub> | H               | H | H |
| I-1006 | 5-fenil-penta-2,4-dienilo               | CH <sub>3</sub> | H               | H | H |
| I-1007 | 4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo    | CH <sub>3</sub> | H               | H | H |
| I-1008 | 3-naftalen-2-il-alilo                   | CH <sub>3</sub> | H               | H | H |
| I-1009 | 3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo | CH <sub>3</sub> | H               | H | H |
| I-1010 | 3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo          | CH <sub>3</sub> | H               | H | H |
| I-1011 | 3-piridin-4-il-alilo                    | CH <sub>3</sub> | H               | H | H |
| I-1012 | 3-(2-cloro-piridin-4-il)-alilo          | CH <sub>3</sub> | H               | H | H |
| I-1013 | 4-clorobencilo                          | H               | CH <sub>3</sub> | H | H |
| I-1014 | Cinamilo                                | H               | CH <sub>3</sub> | H | H |
| I-1015 | 4-clorocinamilo                         | H               | CH <sub>3</sub> | H | H |
| I-1016 | 4-fluorocinamilo                        | H               | CH <sub>3</sub> | H | H |
| I-1017 | 4-bromocinamilo                         | H               | CH <sub>3</sub> | H | H |
| I-1018 | 4-trifluorometilcinamilo                | H               | CH <sub>3</sub> | H | H |
| I-1019 | 4-trifluorometoxicinamilo               | H               | CH <sub>3</sub> | H | H |
| I-1020 | 4-pentafluoroetoxicinamilo              | H               | CH <sub>3</sub> | H | H |
| I-1021 | 4-metoxicinamilo                        | H               | CH <sub>3</sub> | H | H |
| I-1022 | 4-etoxicinamilo                         | H               | CH <sub>3</sub> | H | H |
| I-1023 | 4-cianocinamilo                         | H               | CH <sub>3</sub> | H | H |
| I-1024 | 3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo          | H               | CH <sub>3</sub> | H | H |
| I-1025 | 3-(4-clorofenil)-but-2-enilo            | H               | CH <sub>3</sub> | H | H |
| I-1026 | 3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo         | H               | CH <sub>3</sub> | H | H |
| I-1027 | 3-cloro-4-fluoro-cinamilo               | H               | CH <sub>3</sub> | H | H |
| I-1028 | 3,5-dicloro-cinamilo                    | H               | CH <sub>3</sub> | H | H |
| I-1029 | 5-fenil-penta-2,4-dienilo               | H               | CH <sub>3</sub> | H | H |
| I-1030 | 4-isopropiloxicarbonilamino-            | H               | CH <sub>3</sub> | H | H |

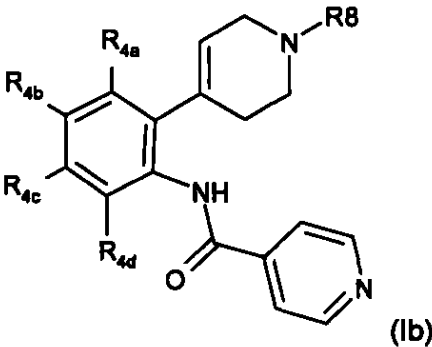
|        |                                             |   |                 |   |                 |
|--------|---------------------------------------------|---|-----------------|---|-----------------|
|        | cinamilo                                    |   |                 |   |                 |
| I-1031 | 3-naftalen-2-il-alilo                       | H | CH <sub>3</sub> | H | H               |
| I-1032 | 3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-<br>alilo | H | CH <sub>3</sub> | H | H               |
| I-1033 | 3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo              | H | CH <sub>3</sub> | H | H               |
| I-1034 | 3-piridin-4-il-alilo                        | H | CH <sub>3</sub> | H | H               |
| I-1035 | 3-(2-cloro-piridin-4-il)-alilo              | H | CH <sub>3</sub> | H | H               |
| I-1036 | 4-clorobencilo                              | H | H               | H | CH <sub>3</sub> |
| I-1037 | Cinamilo                                    | H | H               | H | CH <sub>3</sub> |
| I-1038 | 4-clorocinamilo                             | H | H               | H | CH <sub>3</sub> |
| I-1039 | 4-fluorocinamilo                            | H | H               | H | CH <sub>3</sub> |
| I-1040 | 4-bromocinamilo                             | H | H               | H | CH <sub>3</sub> |
| I-1041 | 4-trifluorometilcinamilo                    | H | H               | H | CH <sub>3</sub> |
| I-1042 | 4-trifluorometoxicinamilo                   | H | H               | H | CH <sub>3</sub> |
| I-1043 | 4-pentafluoroetoxicinamilo                  | H | H               | H | CH <sub>3</sub> |
| I-1044 | 4-metoxicinamilo                            | H | H               | H | CH <sub>3</sub> |
| I-1045 | 4-etoxicinamilo                             | H | H               | H | CH <sub>3</sub> |
| I-1046 | 4-cianocinamilo                             | H | H               | H | CH <sub>3</sub> |
| I-1047 | 3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo              | H | H               | H | CH <sub>3</sub> |
| I-1048 | 3-(4-clorofenil)-but-2-enilo                | H | H               | H | CH <sub>3</sub> |
| I-1049 | 3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo             | H | H               | H | CH <sub>3</sub> |
| I-1050 | 3-cloro-4-fluoro-cinamilo                   | H | H               | H | CH <sub>3</sub> |
| I-1051 | 3,5-dicloro-cinamilo                        | H | H               | H | CH <sub>3</sub> |
| I-1052 | 5-fenil-penta-2,4-dienilo                   | H | H               | H | CH <sub>3</sub> |
| I-1053 | 4-isopropiloxicarbonilamino-<br>cinamilo    | H | H               | H | CH <sub>3</sub> |
| I-1054 | 3-naftalen-2-il-alilo                       | H | H               | H | CH <sub>3</sub> |
| I-1055 | 3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-<br>alilo | H | H               | H | CH <sub>3</sub> |

|        |                                         |   |                 |   |                 |
|--------|-----------------------------------------|---|-----------------|---|-----------------|
| I-1056 | 3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo          | H | H               | H | CH <sub>3</sub> |
| I-1057 | 3-piridin-4-il-alilo                    | H | H               | H | CH <sub>3</sub> |
| I-1058 | 3-(2-cloro-piridin-4-il)-alilo          | H | H               | H | CH <sub>3</sub> |
| I-1059 | 4-clorobencilo                          | H | CF <sub>3</sub> | H | H               |
| I-1060 | Cinamilo                                | H | CF <sub>3</sub> | H | H               |
| I-1061 | 4-clorocinamilo                         | H | CF <sub>3</sub> | H | H               |
| I-1062 | 4-fluorocinamilo                        | H | CF <sub>3</sub> | H | H               |
| I-1063 | 4-bromocinamilo                         | H | CF <sub>3</sub> | H | H               |
| I-1064 | 4-trifluorometilcinamilo                | H | CF <sub>3</sub> | H | H               |
| I-1065 | 4-trifluorometoxicinamilo               | H | CF <sub>3</sub> | H | H               |
| I-1066 | 4-pentafluoroetoxicinamilo              | H | CF <sub>3</sub> | H | H               |
| I-1067 | 4-metoxicinamilo                        | H | CF <sub>3</sub> | H | H               |
| I-1068 | 4-etoxicinamilo                         | H | CF <sub>3</sub> | H | H               |
| I-1069 | 4-cianocinamilo                         | H | CF <sub>3</sub> | H | H               |
| I-1070 | 3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo          | H | CF <sub>3</sub> | H | H               |
| I-1071 | 3-(4-clorofenil)-but-2-enilo            | H | CF <sub>3</sub> | H | H               |
| I-1072 | 3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo         | H | CF <sub>3</sub> | H | H               |
| I-1073 | 3-cloro-4-fluoro-cinamilo               | H | CF <sub>3</sub> | H | H               |
| I-1074 | 3,5-dicloro-cinamilo                    | H | CF <sub>3</sub> | H | H               |
| I-1075 | 5-fenil-penta-2,4-dienilo               | H | CF <sub>3</sub> | H | H               |
| I-1076 | 4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo    | H | CF <sub>3</sub> | H | H               |
| I-1077 | 3-naftalen-2-il-alilo                   | H | CF <sub>3</sub> | H | H               |
| I-1078 | 3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo | H | CF <sub>3</sub> | H | H               |
| I-1079 | 3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo          | H | CF <sub>3</sub> | H | H               |
| I-1080 | 3-piridin-4-il-alilo                    | H | CF <sub>3</sub> | H | H               |
| I-1081 | 3-(2-cloro-piridin-4-il)-alilo          | H | CF <sub>3</sub> | H | H               |
| I-1082 | 4-clorobencilo                          | H | iPr             | H | H               |

|        |                                         |   |                  |   |   |
|--------|-----------------------------------------|---|------------------|---|---|
| I-1083 | Cinamilo                                | H | iPr              | H | H |
| I-1084 | 4-clorocinamilo                         | H | iPr              | H | H |
| I-1085 | 4-fluorocinamilo                        | H | iPr              | H | H |
| I-1086 | 4-bromocinamilo                         | H | iPr              | H | H |
| I-1087 | 4-trifluorometilcinamilo                | H | iPr              | H | H |
| I-1088 | 4-trifluorometoxicinamilo               | H | iPr              | H | H |
| I-1089 | 4-pentafluoroetoxicinamilo              | H | iPr              | H | H |
| I-1090 | 4-metoxicinamilo                        | H | iPr              | H | H |
| I-1091 | 4-etoxicinamilo                         | H | iPr              | H | H |
| I-1092 | 4-cianocinamilo                         | H | iPr              | H | H |
| I-1093 | 3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo          | H | iPr              | H | H |
| I-1094 | 3-(4-clorofenil)-but-2-enilo            | H | iPr              | H | H |
| I-1095 | 3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo         | H | iPr              | H | H |
| I-1096 | 3-cloro-4-fluoro-cinamilo               | H | iPr              | H | H |
| I-1097 | 3,5-dicloro-cinamilo                    | H | iPr              | H | H |
| I-1098 | 5-fenil-penta-2,4-dienilo               | H | iPr              | H | H |
| I-1099 | 4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo    | H | iPr              | H | H |
| I-1100 | 3-naftalen-2-il-alilo                   | H | iPr              | H | H |
| I-1101 | 3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo | H | iPr              | H | H |
| I-1102 | 3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo          | H | iPr              | H | H |
| I-1103 | 3-piridin-4-il-alilo                    | H | iPr              | H | H |
| I-1104 | 3-(2-cloro-piridin-4-il)-alilo          | H | iPr              | H | H |
| I-1105 | 4-clorobencilo                          | H | OCF <sub>3</sub> | H | H |
| I-1106 | Cinamilo                                | H | OCF <sub>3</sub> | H | H |
| I-1107 | 4-clorocinamilo                         | H | OCF <sub>3</sub> | H | H |
| I-1108 | 4-fluorocinamilo                        | H | OCF <sub>3</sub> | H | H |
| I-1109 | 4-bromocinamilo                         | H | OCF <sub>3</sub> | H | H |

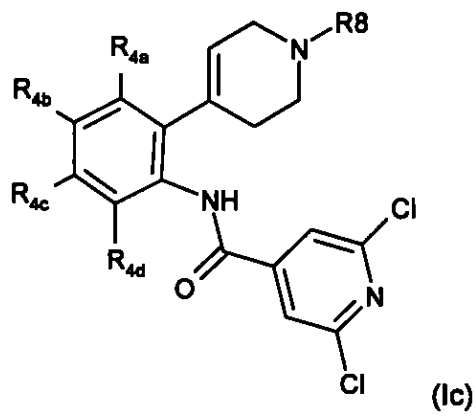
|        |                                         |   |                  |   |   |
|--------|-----------------------------------------|---|------------------|---|---|
| I-1110 | 4-trifluorometilcinamilo                | H | OCF <sub>3</sub> | H | H |
| I-1111 | 4-trifluorometoxicinamilo               | H | OCF <sub>3</sub> | H | H |
| I-1112 | 4-pentafluoroetoxicinamilo              | H | OCF <sub>3</sub> | H | H |
| I-1113 | 4-metoxicinamilo                        | H | OCF <sub>3</sub> | H | H |
| I-1114 | 4-etoxicinamilo                         | H | OCF <sub>3</sub> | H | H |
| I-1115 | 4-cianocinamilo                         | H | OCF <sub>3</sub> | H | H |
| I-1116 | 3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo          | H | OCF <sub>3</sub> | H | H |
| I-1117 | 3-(4-clorofenil)-but-2-enilo            | H | OCF <sub>3</sub> | H | H |
| I-1118 | 3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo         | H | OCF <sub>3</sub> | H | H |
| I-1119 | 3-cloro-4-fluoro-cinamilo               | H | OCF <sub>3</sub> | H | H |
| I-1120 | 3,5-dicloro-cinamilo                    | H | OCF <sub>3</sub> | H | H |
| I-1121 | 5-fenil-penta-2,4-dienilo               | H | OCF <sub>3</sub> | H | H |
| I-1122 | 4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo    | H | OCF <sub>3</sub> | H | H |
| I-1123 | 3-naftalen-2-il-alilo                   | H | OCF <sub>3</sub> | H | H |
| I-1124 | 3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo | H | OCF <sub>3</sub> | H | H |
| I-1125 | 3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo          | H | OCF <sub>3</sub> | H | H |
| I-1126 | 3-piridin-4-il-alilo                    | H | OCF <sub>3</sub> | H | H |
| I-1127 | 3-(2-cloro-piridin-4-il)-alilo          | H | OCF <sub>3</sub> | H | H |

La Tabla II proporciona los 1127 compuestos de Fórmula Ib



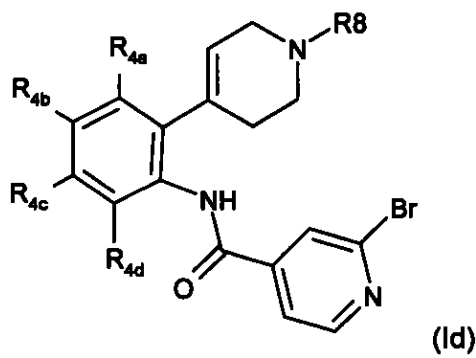
cuyos valores de R<sup>8</sup>, R<sup>4a</sup>, R<sup>4b</sup>, R<sup>4c</sup> y R<sup>4d</sup> se indican en la Tabla 1.

La Tabla III proporciona los 1127 compuestos de Fórmula Ic



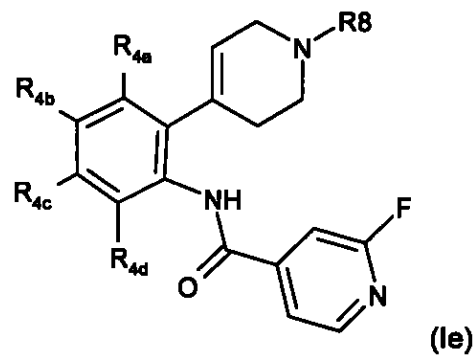
cuyos valores de  $R^8$ ,  $R^{4a}$ ,  $R^{4b}$ ,  $R^{4c}$  y  $R^{4d}$  se indican en la Tabla 1

La Tabla IV proporciona los 1127 compuestos de Fórmula Id



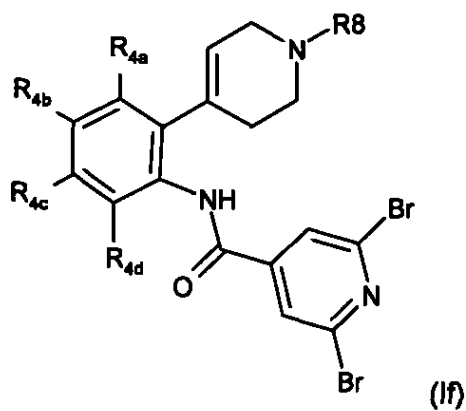
5 cuyos valores de  $R^8$ ,  $R^{4a}$ ,  $R^{4b}$ ,  $R^{4c}$  y  $R^{4d}$  se indican en la Tabla 1

La Tabla V proporciona los 1127 compuestos de Fórmula Ie



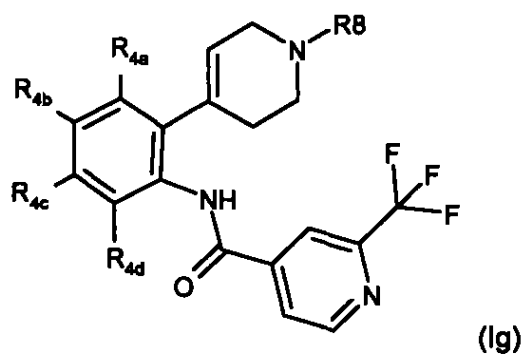
cuyos valores de  $R^8$ ,  $R^{4a}$ ,  $R^{4b}$ ,  $R^{4c}$  y  $R^{4d}$  se indican en la Tabla 1

La Tabla VI proporciona los 1127 compuestos de Fórmula If



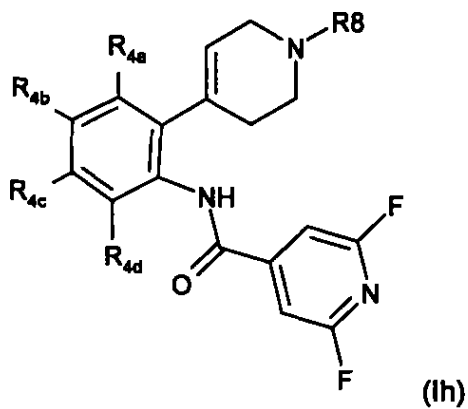
cuyos valores de  $R^8$ ,  $R^{4a}$ ,  $R^{4b}$ ,  $R^{4c}$  y  $R^{4d}$  se indican en la Tabla 1

La Tabla VII proporciona los 1127 compuestos de Fórmula Ig



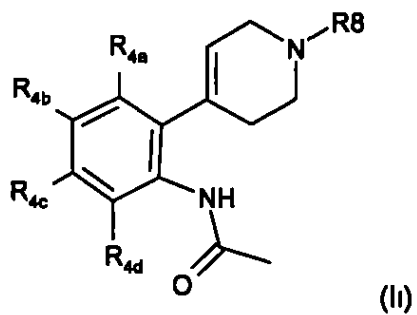
5 cuyos valores de  $R^8$ ,  $R^{4a}$ ,  $R^{4b}$ ,  $R^{4c}$  y  $R^{4d}$  se indican en la Tabla 1

La Tabla VIII proporciona los 1127 compuestos de Fórmula Ih



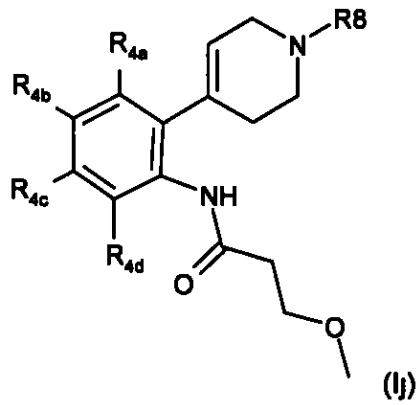
cuyos valores de  $R^8$ ,  $R^{4a}$ ,  $R^{4b}$ ,  $R^{4c}$  y  $R^{4d}$  se indican en la Tabla 1

La Tabla IX proporciona los 1127 compuestos de Fórmula Ii



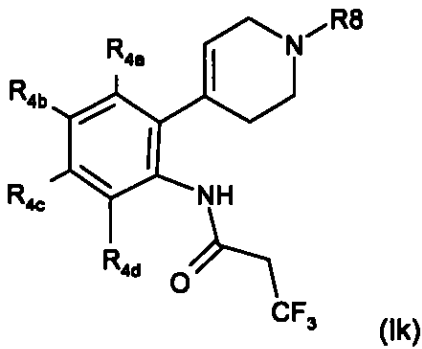
cuyos valores de  $R^8$ ,  $R^{4a}$ ,  $R^{4b}$ ,  $R^{4c}$  y  $R^{4d}$  se indican en la Tabla 1.

La Tabla X proporciona los 1127 compuestos de Fórmula Ij



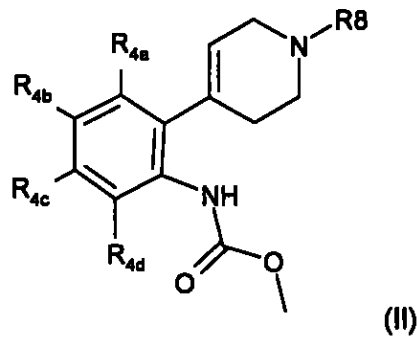
cuyos valores de  $R^8$ ,  $R^{4a}$ ,  $R^{4b}$ ,  $R^{4c}$  y  $R^{4d}$  se indican en la Tabla 1

La Tabla XI proporciona los 1127 compuestos de Fórmula Ik



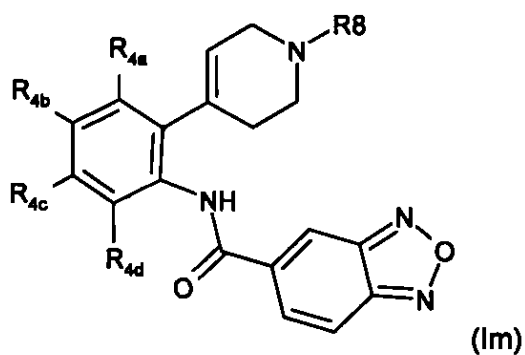
cuyos valores de  $R^8$ ,  $R^{4a}$ ,  $R^{4b}$ ,  $R^{4c}$  y  $R^{4d}$  se indican en la Tabla 1

La Tabla XII proporciona los 1127 compuestos de Fórmula II



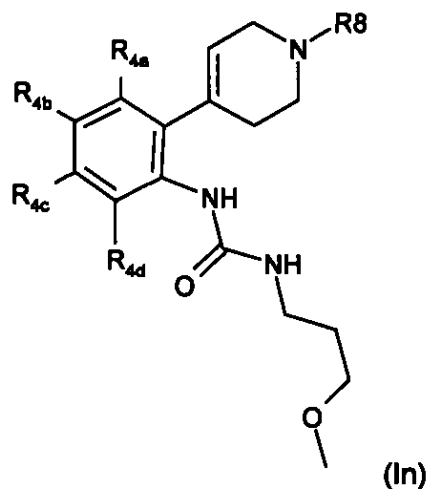
cuyos valores de  $R^8$ ,  $R^{4a}$ ,  $R^{4b}$ ,  $R^{4c}$  y  $R^{4d}$  se indican en la Tabla 1

La Tabla XIII proporciona los 1127 compuestos de Fórmula Im



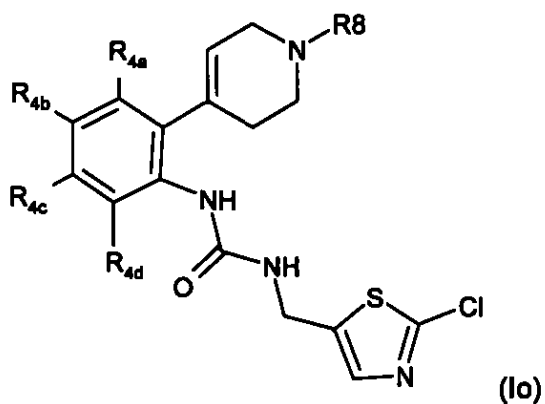
cuyos valores de  $R^8$ ,  $R^{4a}$ ,  $R^{4b}$ ,  $R^{4c}$  y  $R^{4d}$  se indican en la Tabla 1

La Tabla XIV proporciona los 1127 compuestos de Fórmula In



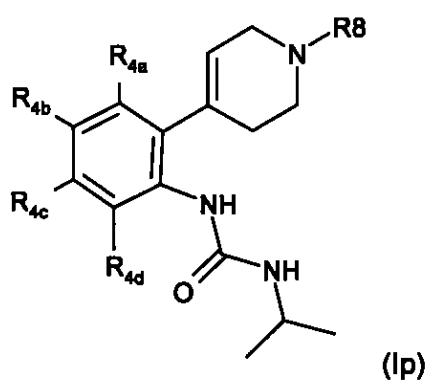
5 cuyos valores de  $R^8$ ,  $R^{4a}$ ,  $R^{4b}$ ,  $R^{4c}$  y  $R^{4d}$  se indican en la Tabla 1

La Tabla XV proporciona los 1127 compuestos de Fórmula Io



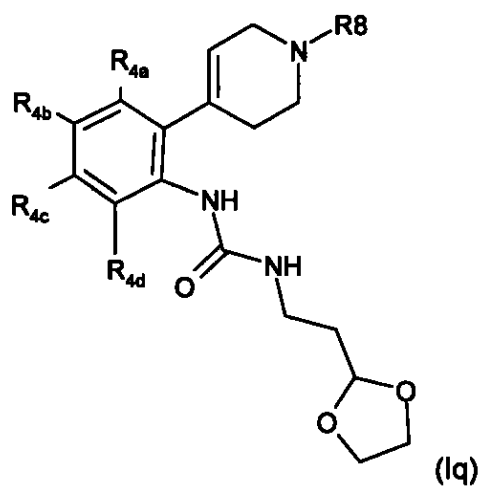
cuyos valores de  $R^8$ ,  $R^{4a}$ ,  $R^{4b}$ ,  $R^{4c}$  y  $R^{4d}$  se indican en la Tabla 1

La Tabla XVI proporciona los 1127 compuestos de Fórmula Ip



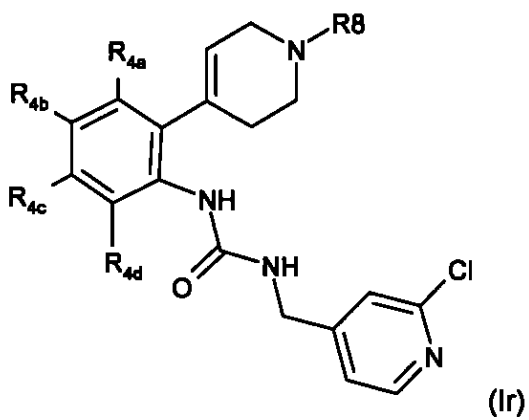
cuyos valores de  $R^8$ ,  $R^{4a}$ ,  $R^{4b}$ ,  $R^{4c}$  y  $R^{4d}$  se indican en la Tabla 1.

La Tabla XVII proporciona los 1127 compuestos de Fórmula Iq



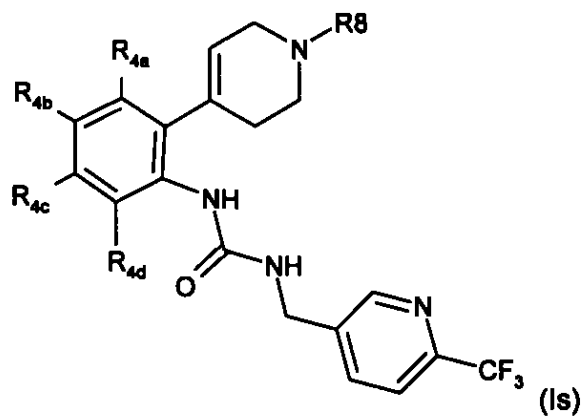
5 cuyos valores de  $R^8$ ,  $R^{4a}$ ,  $R^{4b}$ ,  $R^{4c}$  y  $R^{4d}$  se indican en la Tabla 1.

La Tabla XVIII proporciona los 1127 compuestos de Fórmula Ir



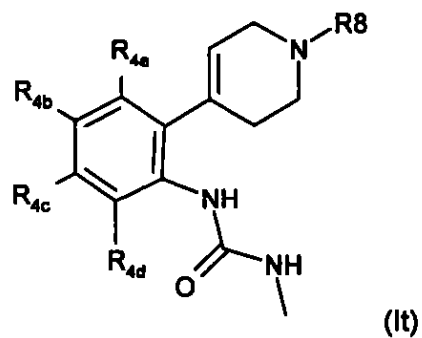
cuyos valores de  $R^8$ ,  $R^{4a}$ ,  $R^{4b}$ ,  $R^{4c}$  y  $R^{4d}$  se indican en la Tabla 1.

La Tabla XIX proporciona los 1127 compuestos de Fórmula Is



cuyos valores de  $R^8$ ,  $R^{4a}$ ,  $R^{4b}$ ,  $R^{4c}$  y  $R^{4d}$  se indican en la Tabla 1.

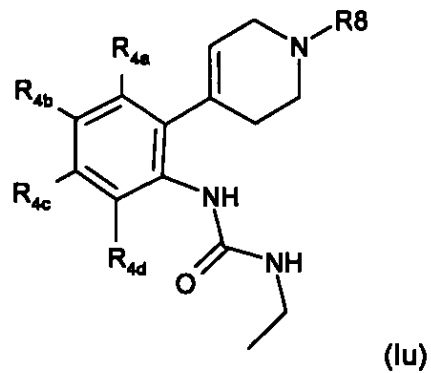
La Tabla XX proporciona los 1127 compuestos de Fórmula It



5

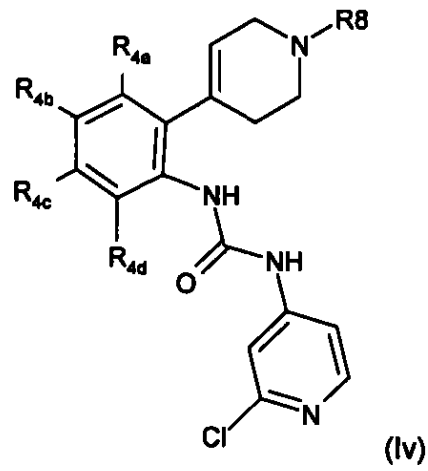
cuyos valores de  $R^8$ ,  $R^{4a}$ ,  $R^{4b}$ ,  $R^{4c}$  y  $R^{4d}$  se indican en la Tabla 1.

La Tabla XXI proporciona los 1127 compuestos de Fórmula Iu



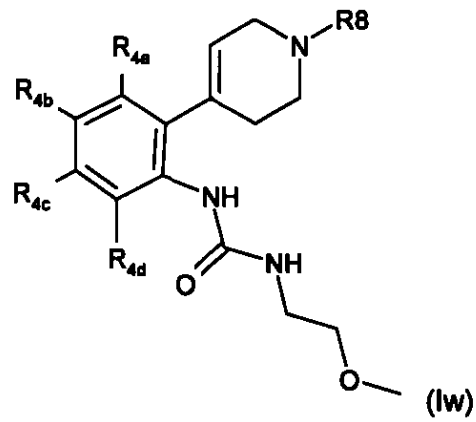
cuyos valores de  $R^8$ ,  $R^{4a}$ ,  $R^{4b}$ ,  $R^{4c}$  y  $R^{4d}$  se indican en la Tabla 1

La Tabla XXII proporciona los 1127 compuestos de Fórmula Iv



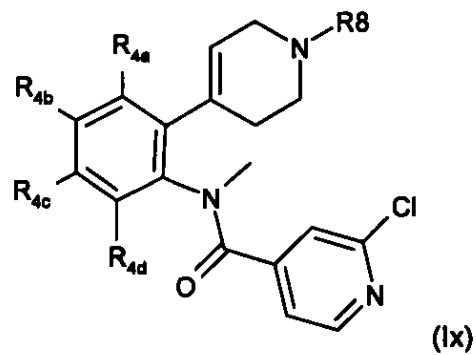
cuyos valores de  $R^8$ ,  $R^{4a}$ ,  $R^{4b}$ ,  $R^{4c}$  y  $R^{4d}$  se indican en la Tabla 1

La Tabla XXIII proporciona los 1127 compuestos de Fórmula Iw



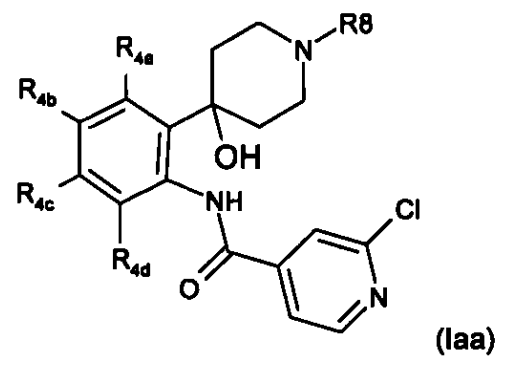
cuyos valores de  $R^8$ ,  $R^{4a}$ ,  $R^{4b}$ ,  $R^{4c}$  y  $R^{4d}$  se indican en la Tabla 1

La Tabla XXIV proporciona los 1127 compuestos de Fórmula Ix



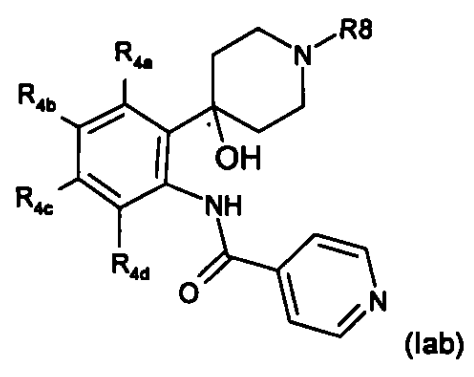
cuyos valores de  $R^8$ ,  $R^{4a}$ ,  $R^{4b}$ ,  $R^{4c}$  y  $R^{4d}$  se indican en la Tabla 1

La Tabla XXV proporciona los 1127 compuestos de Fórmula Iaa



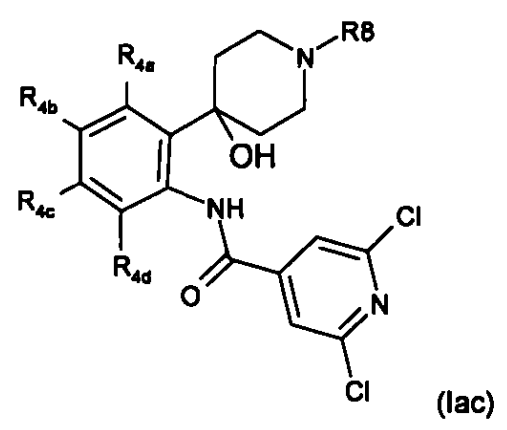
cuyos valores de  $R^8$ ,  $R^{4a}$ ,  $R^{4b}$ ,  $R^{4c}$  y  $R^{4d}$  se indican en la Tabla 1

La Tabla XXVI proporciona los 1127 compuestos de Fórmula Iab



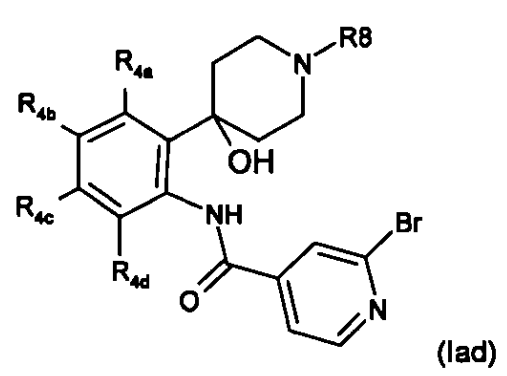
5      cuyos valores de  $R^8$ ,  $R^{4a}$ ,  $R^{4b}$ ,  $R^{4c}$  y  $R^{4d}$  se indican en la Tabla 1

La Tabla XXVII proporciona los 1127 compuestos de Fórmula Iac



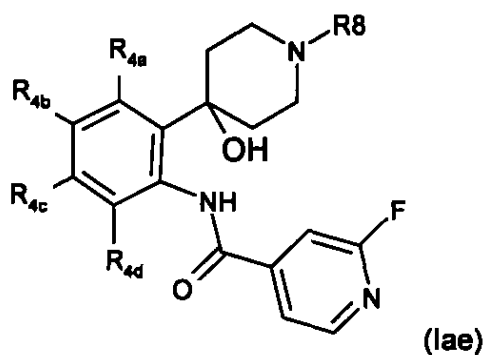
cuyos valores de  $R^8$ ,  $R^{4a}$ ,  $R^{4b}$ ,  $R^{4c}$  y  $R^{4d}$  se indican en la Tabla 1

La Tabla XXVIII proporciona los 1127 compuestos de Fórmula Iad



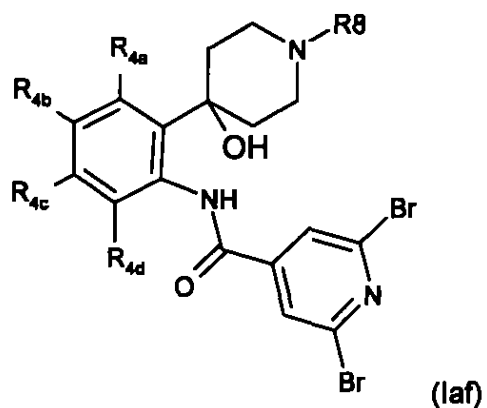
cuyos valores de  $R^8$ ,  $R^{4a}$ ,  $R^{4b}$ ,  $R^{4c}$  y  $R^{4d}$  se indican en la Tabla 1

La Tabla XXIX proporciona los 1127 compuestos de Fórmula lae



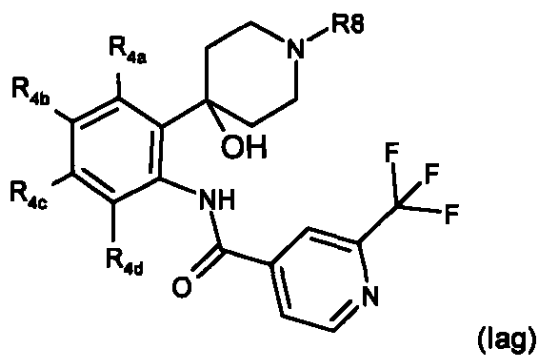
donde y los valores de  $R^8$ ,  $R^{4a}$ ,  $R^{4b}$ ,  $R^{4c}$  y  $R^{4d}$  se indican en la Tabla 1

5 La Tabla XXX proporciona los 1127 compuestos de Fórmula laf



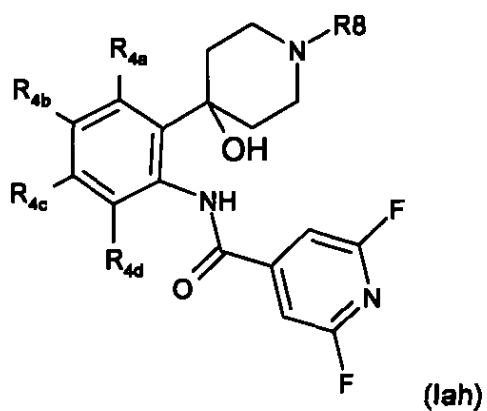
cuyos valores de  $R^8$ ,  $R^{4a}$ ,  $R^{4b}$ ,  $R^{4c}$  y  $R^{4d}$  se indican en la Tabla 1

La Tabla XXXI proporciona los 1127 compuestos de Fórmula lag



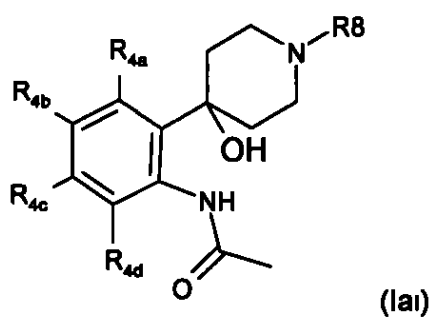
10 cuyos valores de  $R^8$ ,  $R^{4a}$ ,  $R^{4b}$ ,  $R^{4c}$  y  $R^{4d}$  se indican en la Tabla 1

La Tabla XXXII proporciona los 1127 compuestos de Fórmula lah



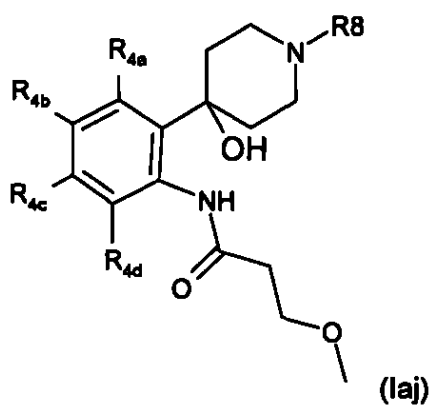
cuyos valores de  $R^8$ ,  $R^{4a}$ ,  $R^{4b}$ ,  $R^{4c}$  y  $R^{4d}$  se indican en la Tabla 1

La Tabla XXXIII proporciona los 1127 compuestos de Fórmula Iai



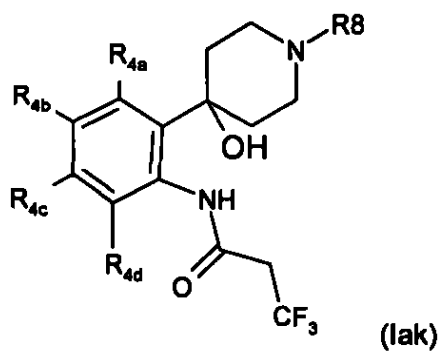
5 cuyos valores de  $R^8$ ,  $R^{4a}$ ,  $R^{4b}$ ,  $R^{4c}$  y  $R^{4d}$  se indican en la Tabla 1.

La Tabla XXXIV proporciona los 1127 compuestos de Fórmula Iaj



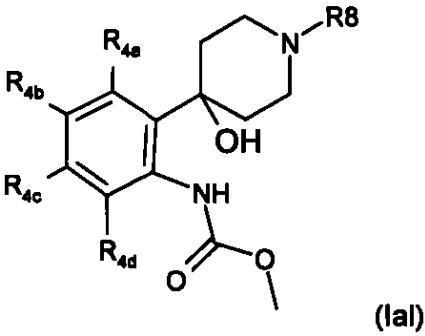
cuyos valores de  $R^8$ ,  $R^{4a}$ ,  $R^{4b}$ ,  $R^{4c}$  y  $R^{4d}$  se indican en la Tabla 1

La Tabla XXXV proporciona los 1127 compuestos de Fórmula Iak



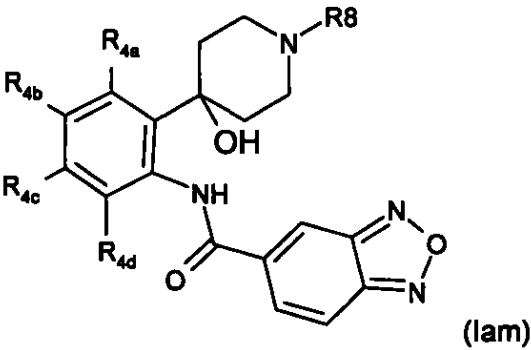
cuyos valores de  $R^8$ ,  $R^{4a}$ ,  $R^{4b}$ ,  $R^{4c}$  y  $R^{4d}$  se indican en la Tabla 1

La Tabla XXXVI proporciona los 1127 compuestos de Fórmula Ial



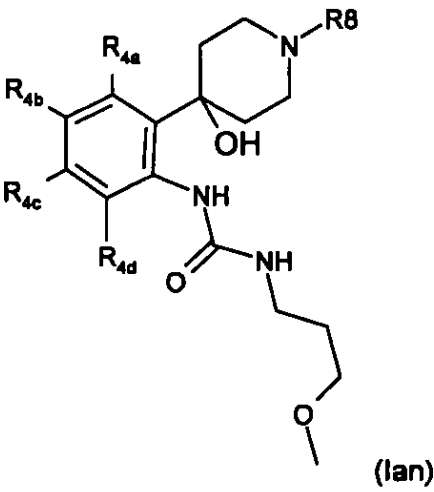
cuyos valores de  $R^8$ ,  $R^{4a}$ ,  $R^{4b}$ ,  $R^{4c}$  y  $R^{4d}$  se indican en la Tabla 1.

La Tabla XXXVII proporciona los 1127 compuestos de Fórmula Iam



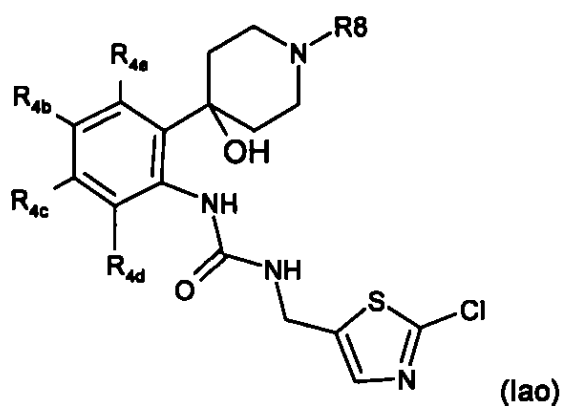
cuyos valores de  $R^8$ ,  $R^{4a}$ ,  $R^{4b}$ ,  $R^{4c}$  y  $R^{4d}$  se indican en la Tabla 1.

La Tabla XXXVIII proporciona los 1127 compuestos de Fórmula Ian



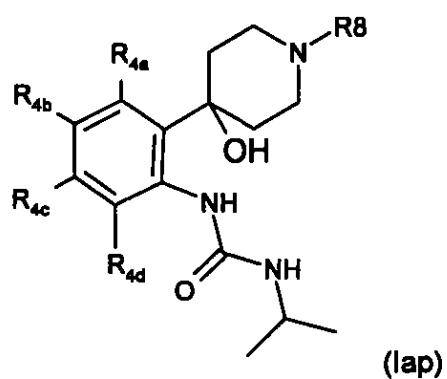
cuyos valores de  $R^8$ ,  $R^{4a}$ ,  $R^{4b}$ ,  $R^{4c}$  y  $R^{4d}$  se indican en la Tabla 1

La Tabla XXXIX proporciona los 1127 compuestos de Fórmula Iao



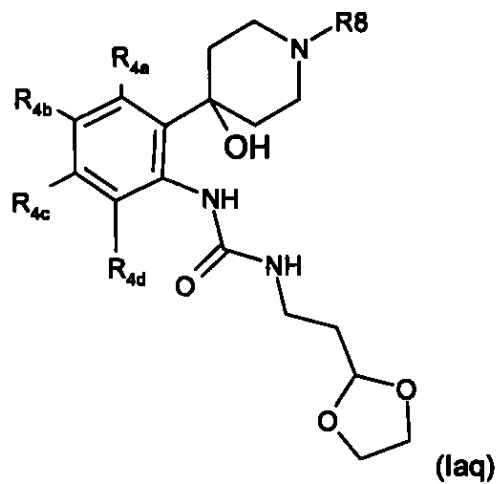
cuyos valores de  $R^8$ ,  $R^{4a}$ ,  $R^{4b}$ ,  $R^{4c}$  y  $R^{4d}$  se indican en la Tabla 1

La Tabla XL proporciona los 1127 compuestos de Fórmula lap



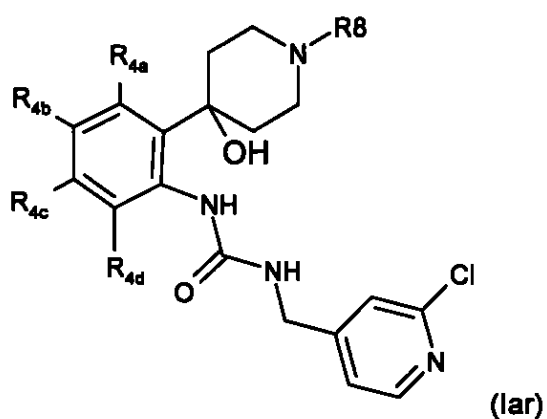
5 cuyos valores de  $R^8$ ,  $R^{4a}$ ,  $R^{4b}$ ,  $R^{4c}$  y  $R^{4d}$  se indican en la Tabla 1

La Tabla XLI proporciona los 1127 compuestos de Fórmula laq



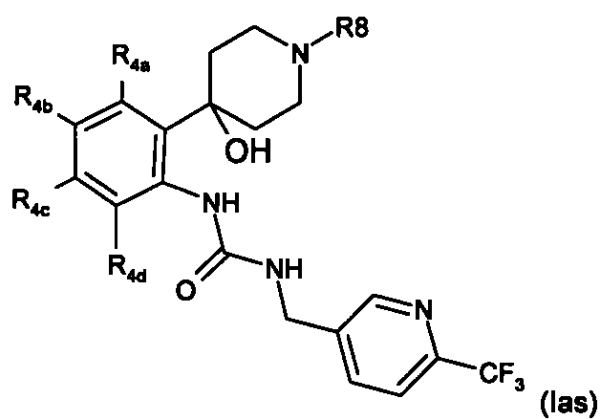
cuyos valores de  $R^8$ ,  $R^{4a}$ ,  $R^{4b}$ ,  $R^{4c}$  y  $R^{4d}$  se indican en la Tabla 1.

La Tabla XLII proporciona los 1127 compuestos de Fórmula lar



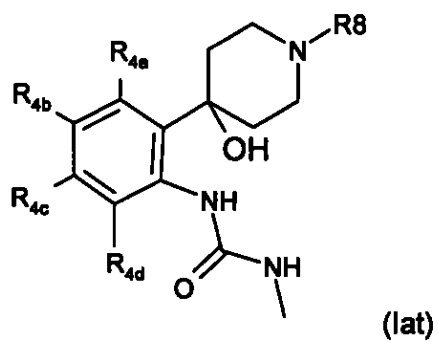
cuyos valores de  $R^8$ ,  $R^{4a}$ ,  $R^{4b}$ ,  $R^{4c}$  y  $R^{4d}$  se indican en la Tabla 1

La Tabla XLIII proporciona los 1127 compuestos de Fórmula Ias



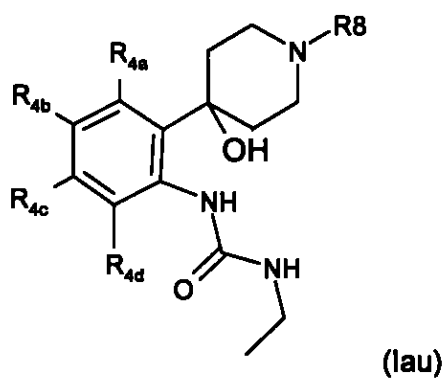
5 cuyos valores de  $R^8$ ,  $R^{4a}$ ,  $R^{4b}$ ,  $R^{4c}$  y  $R^{4d}$  se indican en la Tabla 1

La Tabla XLIV proporciona los 1127 compuestos de Fórmula Iat



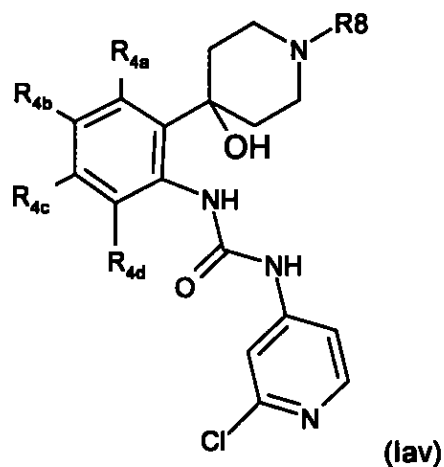
cuyos valores de  $R^8$ ,  $R^{4a}$ ,  $R^{4b}$ ,  $R^{4c}$  y  $R^{4d}$  se indican en la Tabla 1

La Tabla XLV proporciona los 1127 compuestos de Fórmula Iau



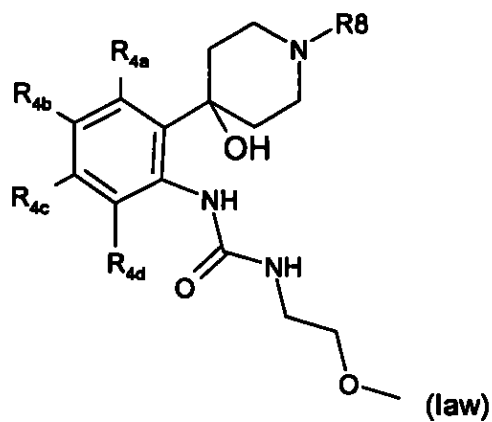
cuyos valores de  $R^8$ ,  $R^{4a}$ ,  $R^{4b}$ ,  $R^{4c}$  y  $R^{4d}$  se indican en la Tabla 1

La Tabla XLVI proporciona los 1127 compuestos de Fórmula lav



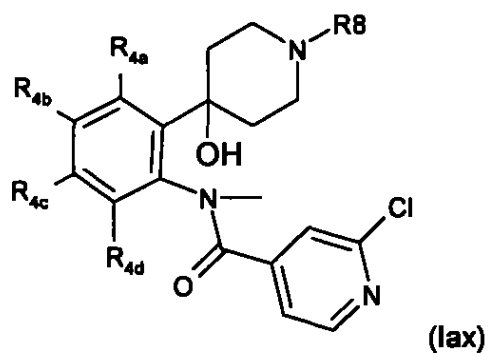
5 cuyos valores de  $R^8$ ,  $R^{4a}$ ,  $R^{4b}$ ,  $R^{4c}$  y  $R^{4d}$  se indican en la Tabla 1

La Tabla XLVII proporciona los 1127 compuestos de Fórmula law



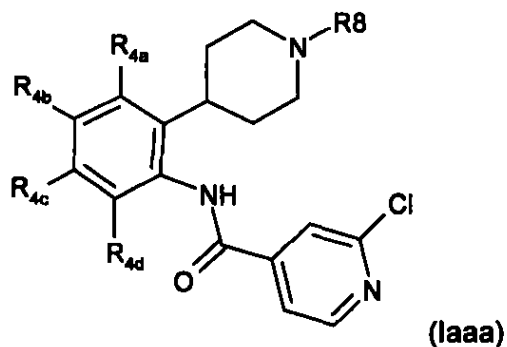
cuyos valores de  $R^8$ ,  $R^{4a}$ ,  $R^{4b}$ ,  $R^{4c}$  y  $R^{4d}$  se indican en la Tabla 1

La Tabla XLVIII proporciona los 1127 compuestos de Fórmula lax



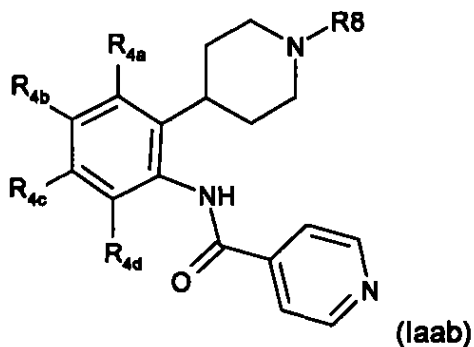
cuyos valores de  $R^8$ ,  $R^{4a}$ ,  $R^{4b}$ ,  $R^{4c}$  y  $R^{4d}$  se indican en la Tabla 1

La Tabla IL proporciona los 1127 compuestos de Fórmula Iaaa



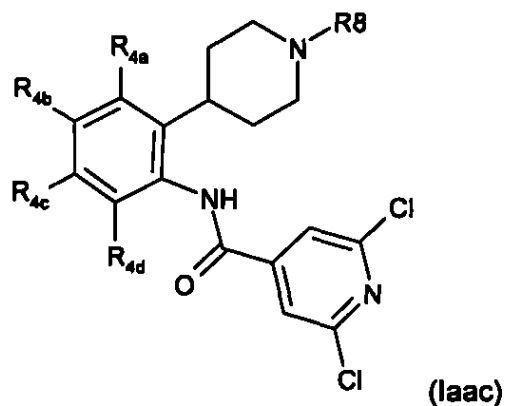
5

La Tabla L proporciona los 1127 compuestos de Fórmula Iaab



cuyos valores de  $R^8$ ,  $R^{4a}$ ,  $R^{4b}$ ,  $R^{4c}$  y  $R^{4d}$  se indican en la Tabla 1

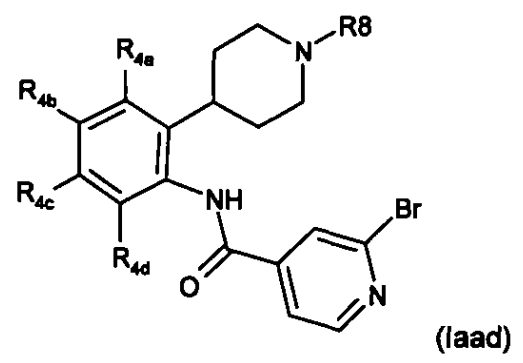
La Tabla LI proporciona los 1127 compuestos de Fórmula Iaac



10

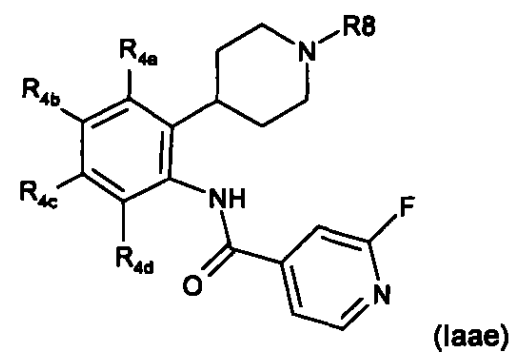
cuyos valores de  $R^8$ ,  $R^{4a}$ ,  $R^{4b}$ ,  $R^{4c}$  y  $R^{4d}$  se indican en la Tabla 1

La Tabla LII proporciona los 1127 compuestos de Fórmula laad



cuyos valores de R<sup>8</sup>, R<sup>4a</sup>, R<sup>4b</sup>, R<sup>4c</sup> y R<sup>4d</sup> se indican en la Tabla 1

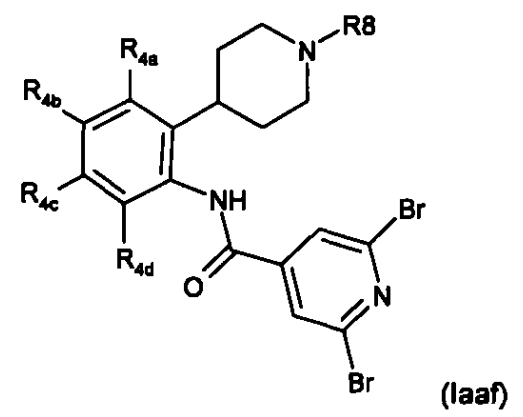
La Tabla LIII proporciona los 1127 compuestos de Fórmula laae



5

donde y los valores de R<sup>8</sup>, R<sup>4a</sup>, R<sup>4b</sup>, R<sup>4c</sup> y R<sup>4d</sup> se indican en la Tabla 1

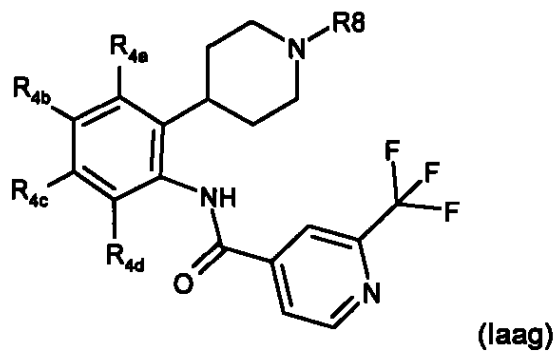
La Tabla LIV proporciona los 1127 compuestos de Fórmula laaf



cuyos valores de R<sup>8</sup>, R<sup>4a</sup>, R<sup>4b</sup>, R<sup>4c</sup> y R<sup>4d</sup> se indican en la Tabla 1

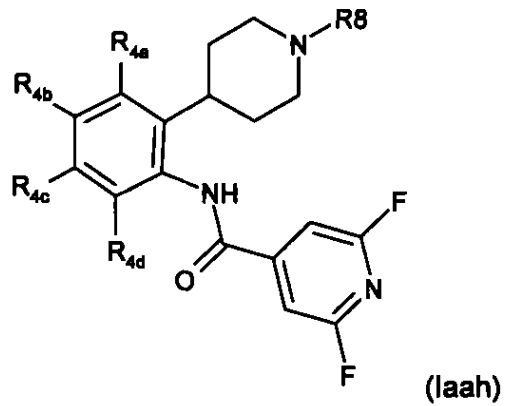
10

La Tabla LV proporciona los 1127 compuestos de Fórmula laag



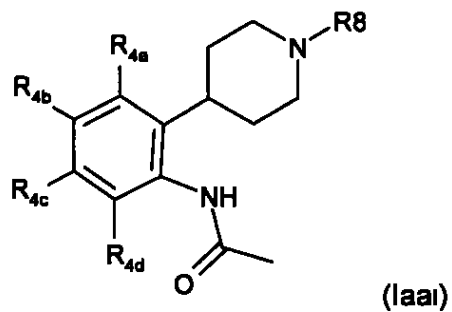
cuyos valores de  $R^8$ ,  $R^{4a}$ ,  $R^{4b}$ ,  $R^{4c}$  y  $R^{4d}$  se indican en la Tabla 1

La Tabla LVI proporciona los 1127 compuestos de Fórmula laah



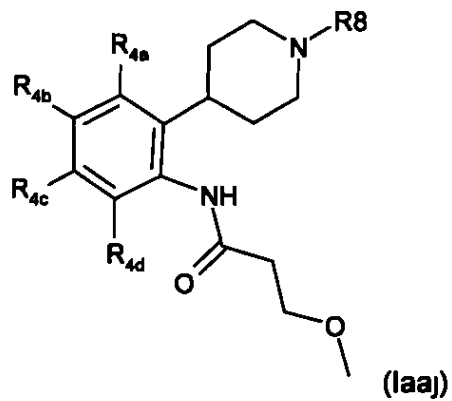
5 cuyos valores de  $R^8$ ,  $R^{4a}$ ,  $R^{4b}$ ,  $R^{4c}$  y  $R^{4d}$  se indican en la Tabla 1

La Tabla LVII proporciona los 1127 compuestos de Fórmula laai



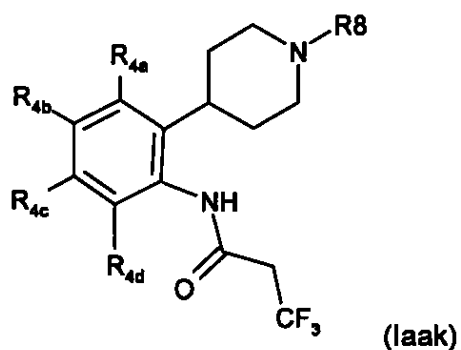
cuyos valores de  $R^8$ ,  $R^{4a}$ ,  $R^{4b}$ ,  $R^{4c}$  y  $R^{4d}$  se indican en la Tabla 1

La Tabla LVIII proporciona los 1127 compuestos de Fórmula laaj



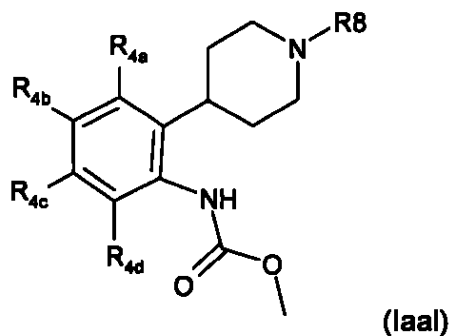
cuyos valores de  $R^6$ ,  $R^{4a}$ ,  $R^{4b}$ ,  $R^{4c}$  y  $R^{4d}$  se indican en la Tabla 1

La Tabla LIX proporciona los 1127 compuestos de Fórmula laak



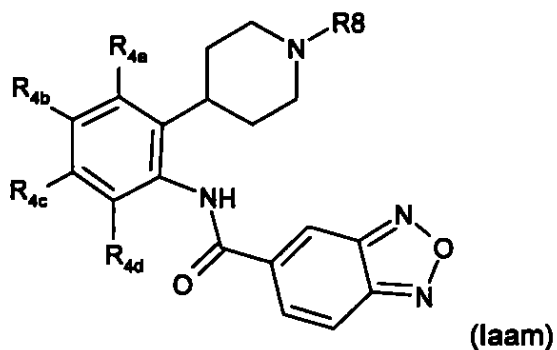
cuyos valores de  $R^6$ ,  $R^{4a}$ ,  $R^{4b}$ ,  $R^{4c}$  y  $R^{4d}$  se indican en la Tabla 1

5 La Tabla LX proporciona los 1127 compuestos de Fórmula laal



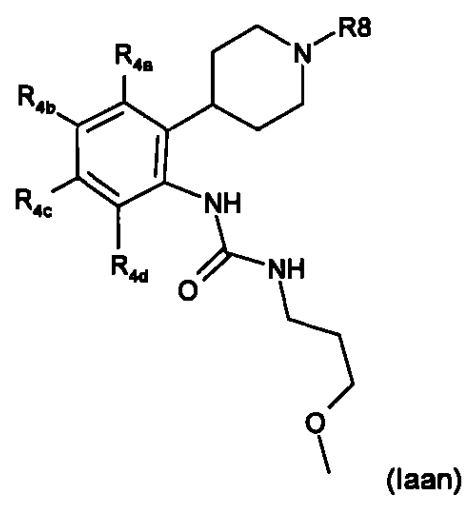
cuyos valores de  $R^6$ ,  $R^{4a}$ ,  $R^{4b}$ ,  $R^{4c}$  y  $R^{4d}$  se indican en la Tabla 1

La Tabla LXI proporciona los 1127 compuestos de Fórmula laam



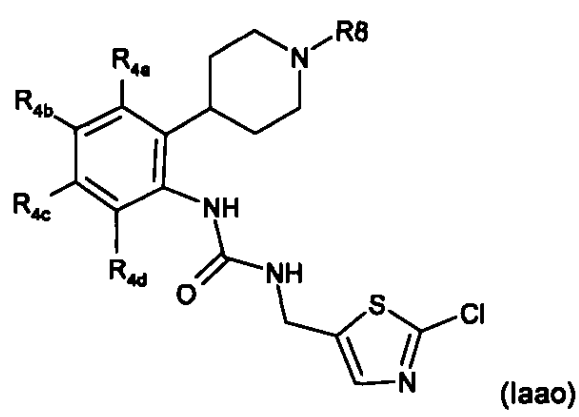
10 cuyos valores de  $R^6$ ,  $R^{4a}$ ,  $R^{4b}$ ,  $R^{4c}$  y  $R^{4d}$  se indican en la Tabla 1

La Tabla LXII proporciona los 1127 compuestos de Fórmula laan



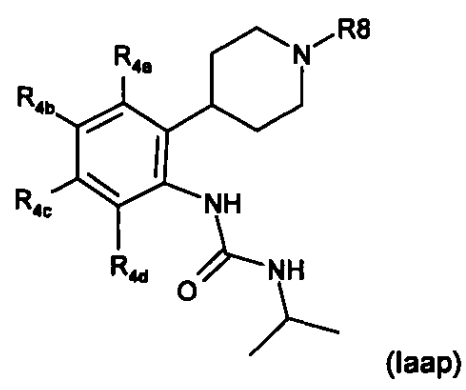
cuyos valores de R<sup>8</sup>, R<sup>4a</sup>, R<sup>4b</sup>, R<sup>4c</sup> y R<sup>4d</sup> se indican en la Tabla 1.

La Tabla LXIII proporciona los 1127 compuestos de Fórmula Iaa0



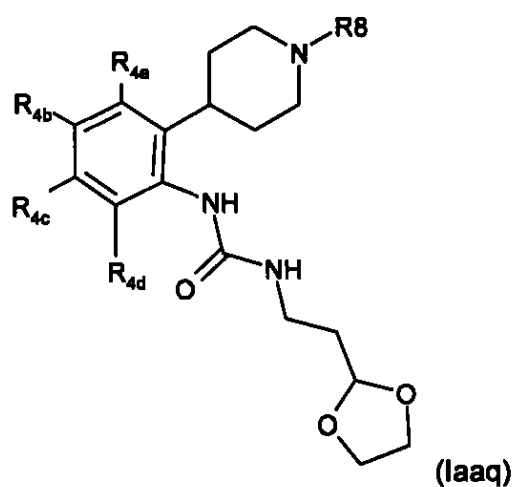
5      cuyos valores de R<sup>8</sup>, R<sup>4a</sup>, R<sup>4b</sup>, R<sup>4c</sup> y R<sup>4d</sup> se indican en la Tabla 1

La Tabla LXIV proporciona los 1127 compuestos de Fórmula IaaP



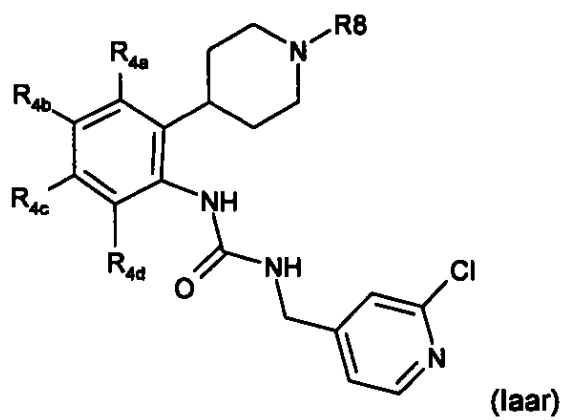
cuyos valores de R<sup>8</sup>, R<sup>4a</sup>, R<sup>4b</sup>, R<sup>4c</sup> y R<sup>4d</sup> se indican en la Tabla 1

La Tabla LXV proporciona los 1127 compuestos de Fórmula Iaaq



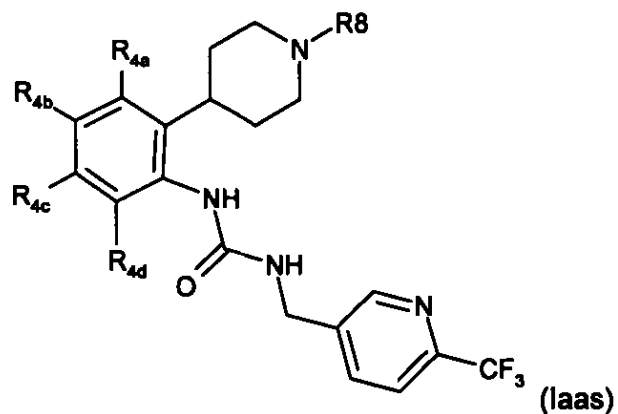
cuyos valores de  $R^8$ ,  $R^{4a}$ ,  $R^{4b}$ ,  $R^{4c}$  y  $R^{4d}$  se indican en la Tabla 1

La Tabla LXVI proporciona los 1127 compuestos de Fórmula laar



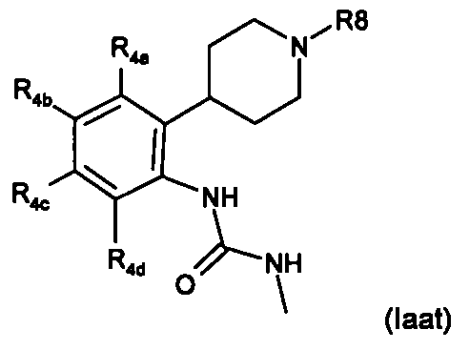
5 cuyos valores de  $R^8$ ,  $R^{4a}$ ,  $R^{4b}$ ,  $R^{4c}$  y  $R^{4d}$  se indican en la Tabla 1.

La Tabla LXVII proporciona los 1127 compuestos de Fórmula laas



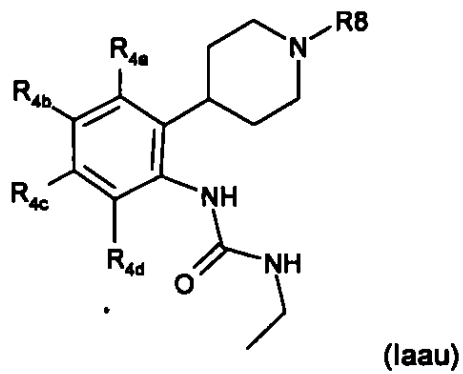
cuyos valores de  $R^8$ ,  $R^{4a}$ ,  $R^{4b}$ ,  $R^{4c}$  y  $R^{4d}$  se indican en la Tabla 1.

La Tabla LXVIII proporciona los 1127 compuestos de Fórmula laat



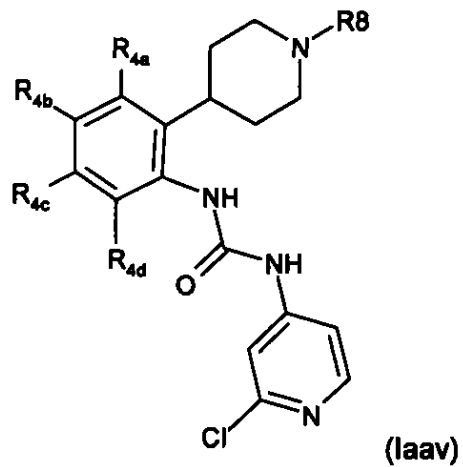
cuyos valores de  $R^8$ ,  $R^{4a}$ ,  $R^{4b}$ ,  $R^{4c}$  y  $R^{4d}$  se indican en la Tabla 1

La Tabla LXIX proporciona los 1127 compuestos de Fórmula laau



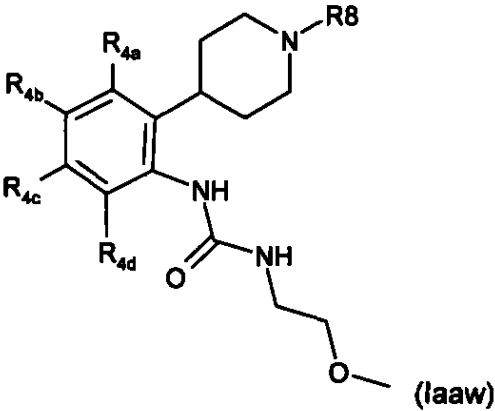
5 cuyos valores de  $R^8$ ,  $R^{4a}$ ,  $R^{4b}$ ,  $R^{4c}$  y  $R^{4d}$  se indican en la Tabla 1.

La Tabla LXX proporciona los 1127 compuestos de Fórmula laav



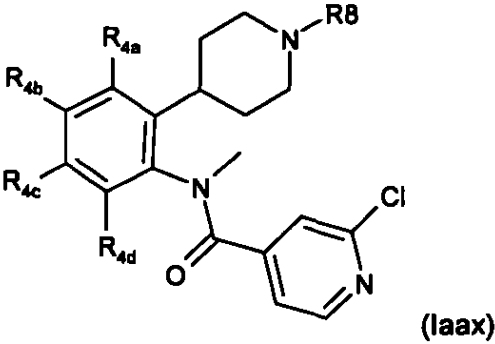
cuyos valores de  $R^8$ ,  $R^{4a}$ ,  $R^{4b}$ ,  $R^{4c}$  y  $R^{4d}$  se indican en la Tabla 1

La Tabla LXXI proporciona los 1127 compuestos de Fórmula laaw



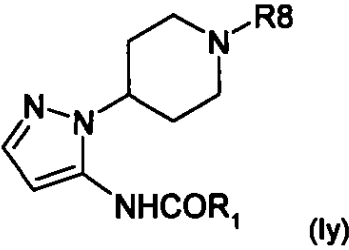
cuyos valores de R<sup>8</sup>, R<sup>4a</sup>, R<sup>4b</sup>, R<sup>4c</sup> y R<sup>4d</sup> se indican en la Tabla 1

La Tabla LXXII proporciona los 1127 compuestos de Fórmula Iaax



5      cuyos valores de R<sup>8</sup>, R<sup>4a</sup>, R<sup>4b</sup>, R<sup>4c</sup> y R<sup>4d</sup> se indican en la Tabla 1

La Tabla LXXIII proporciona los 506 compuestos de Fórmula Iy



cuyos valores de R<sup>8</sup> y R<sup>1</sup> se indican en la Tabla 73

Tabla 73

| Compuesto<br>No | R <sup>8</sup>           | R <sup>1</sup>      |
|-----------------|--------------------------|---------------------|
| LXXIII-1        | Cinamilo                 | 2-cloro-pírid-4-ilo |
| LXXIII-2        | 4-clorocinamilo          | 2-cloro-pírid-4-ilo |
| LXXIII-3        | 4-fluorocinamilo         | 2-cloro-pírid-4-ilo |
| LXXIII-4        | 4-bromocinamilo          | 2-cloro-pírid-4-ilo |
| LXXIII-5        | 4-trifluorometilcinamilo | 2-cloro-pírid-4-ilo |

|           |                                          |                    |
|-----------|------------------------------------------|--------------------|
| LXXIII-6  | 4-trifluorometoxicinamilo                | 2-cloro-pind-4-ilo |
| LXXIII-7  | 4-pentafluoroetoxicinamilo               | 2-cloro-pind-4-ilo |
| LXXIII-8  | 4-metoxicinamilo                         | 2-cloro-pind-4-ilo |
| LXXIII-9  | 4-etoxicinamilo                          | 2-cloro-pind-4-ilo |
| LXXIII-10 | 4-cianocinamilo                          | 2-cloro-pind-4-ilo |
| LXXIII-11 | 3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo           | 2-cloro-pind-4-ilo |
| LXXIII-12 | 3-(4-clorofenil)-but-2-enilo             | 2-cloro-pind-4-ilo |
| LXXIII-13 | 3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo          | 2-cloro-pind-4-ilo |
| LXXIII-14 | 3-cloro-4-fluoro-cinamilo                | 2-cloro-pind-4-ilo |
| LXXIII-15 | 3,5-dicloro-cinamilo                     | 2-cloro-pind-4-ilo |
| LXXIII-16 | 5-fenil-penta-2,4-dienilo                | 2-cloro-pind-4-ilo |
| LXXIII-17 | 4-isopropiloxicarbonilamino-<br>cinamilo | 2-cloro-pind-4-ilo |
| LXXIII-18 | 3-naftalen-2-il-alilo                    | 2-cloro-pind-4-ilo |
| LXXIII-19 | 3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo  | 2-cloro-pind-4-ilo |
| LXXIII-20 | 3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo           | 2-cloro-pind-4-ilo |
| LXXIII-21 | 3-piridin-4-il-alilo                     | 2-cloro-pind-4-ilo |
| LXXIII-22 | 3-(2-cloro-piridin-4-il)-alilo           | 2-cloro-pind-4-ilo |
| LXXIII-23 | Cinamilo                                 | pind-4-ilo         |
| LXXIII-24 | 4-clorocinamilo                          | pind-4-ilo         |
| LXXIII-25 | 4-fluorocinamilo                         | pind-4-ilo         |
| LXXIII-26 | 4-bromocinamilo                          | pind-4-ilo         |
| LXXIII-27 | 4-trifluorometilcinamilo                 | pind-4-ilo         |
| LXXIII-28 | 4-trifluorometoxicinamilo                | pind-4-ilo         |
| LXXIII-29 | 4-pentafluoroetoxicinamilo               | pind-4-ilo         |
| LXXIII-30 | 4-metoxicinamilo                         | pind-4-ilo         |
| LXXIII-31 | 4-etoxicinamilo                          | pind-4-ilo         |
| LXXIII-32 | 4-cianocinamilo                          | pind-4-ilo         |
| LXXIII-33 | 3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo           | pind-4-ilo         |

|           |                                          |                         |
|-----------|------------------------------------------|-------------------------|
| LXXIII-34 | 3-(4-clorofenil)-but-2-enilo             | pirid-4-ilo             |
| LXXIII-35 | 3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo          | pirid-4-ilo             |
| LXXIII-36 | 3-cloro-4-fluoro-cinamilo                | pirid-4-ilo             |
| LXXIII-37 | 3,5-dicloro-cinamilo                     | pirid-4-ilo             |
| LXXIII-38 | 5-fenil-penta-2,4-dienilo                | pirid-4-ilo             |
| LXXIII-39 | 4-isopropiloxicarbonilamino-<br>cinamilo | pirid-4-ilo             |
| LXXIII-40 | 3-naftalen-2-il-alilo                    | pirid-4-ilo             |
| LXXIII-41 | 3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo  | pirid-4-ilo             |
| LXXIII-42 | 3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo           | pirid-4-ilo             |
| LXXIII-43 | 3-piridin-4-il-alilo                     | pirid-4-ilo             |
| LXXIII-44 | 3-(2-cloro-piridin-4-il)-alilo           | pirid-4-ilo             |
| LXXIII-45 | Cinamilo                                 | 2,6-dicloro-pirid-4-ilo |
| LXXIII-46 | 4-clorocinamilo                          | 2,6-dicloro-pirid-4-ilo |
| LXXIII-47 | 4-fluorocinamilo                         | 2,6-dicloro-pirid-4-ilo |
| LXXIII-48 | 4-bromocinamilo                          | 2,6-dicloro-pirid-4-ilo |
| LXXIII-49 | 4-trifluorometilcinamilo                 | 2,6-dicloro-pirid-4-ilo |
| LXXIII-50 | 4-trifluorometoxicinamilo                | 2,6-dicloro-pirid-4-ilo |
| LXXIII-51 | 4-pentafluoroetoxicinamilo               | 2,6-dicloro-pirid-4-ilo |
| LXXIII-52 | 4-metoxicinamilo                         | 2,6-dicloro-pirid-4-ilo |
| LXXIII-53 | 4-etoxicinamilo                          | 2,6-dicloro-pirid-4-ilo |
| LXXIII-54 | 4-cianocinamilo                          | 2,6-dicloro-pirid-4-ilo |
| LXXIII-55 | 3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo           | 2,6-dicloro-pirid-4-ilo |
| LXXIII-56 | 3-(4-clorofenil)-but-2-enilo             | 2,6-dicloro-pirid-4-ilo |
| LXXIII-57 | 3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo          | 2,6-dicloro-pirid-4-ilo |
| LXXIII-58 | 3-cloro-4-fluoro-cinamilo                | 2,6-dicloro-pirid-4-ilo |
| LXXIII-59 | 3,5-dicloro-cinamilo                     | 2,6-dicloro-pirid-4-ilo |
| LXXIII-60 | 5-fenil-penta-2,4-dienilo                | 2,6-dicloro-pirid-4-ilo |

|           |                                          |                         |
|-----------|------------------------------------------|-------------------------|
| LXXIII-61 | 4-isopropiloxicarbonilamino-<br>cinamilo | 2,6-dicloro-pirid-4-ilo |
| LXXIII-62 | 3-naftalen-2-il-alilo                    | 2,6-dicloro-pirid-4-ilo |
| LXXIII-63 | 3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo  | 2,6-dicloro-pirid-4-ilo |
| LXXIII-64 | 3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo           | 2,6-dicloro-pirid-4-ilo |
| LXXIII-65 | 3-piridin-4-il-alilo                     | 2,6-dicloro-pirid-4-ilo |
| LXXIII-66 | 3-(2-cloro-piridin-4-il)-alilo           | 2,6-dicloro-pirid-4-ilo |
| LXXIII-67 | Cinamilo                                 | 2-bromo-pirid-4-ilo     |
| LXXIII-68 | 4-clorocinamilo                          | 2-bromo-pirid-4-ilo     |
| LXXIII-69 | 4-fluorocinamilo                         | 2-bromo-pirid-4-ilo     |
| LXXIII-70 | 4-bromocinamilo                          | 2-bromo-pirid-4-ilo     |
| LXXIII-71 | 4-trifluorometilcinamilo                 | 2-bromo-pirid-4-ilo     |
| LXXIII-72 | 4-trifluorometoxicinamilo                | 2-bromo-pirid-4-ilo     |
| LXXIII-73 | 4-pentafluoroetoxicinamilo               | 2-bromo-pirid-4-ilo     |
| LXXIII-74 | 4-metoxicinamilo                         | 2-bromo-pirid-4-ilo     |
| LXXIII-75 | 4-etoxicinamilo                          | 2-bromo-pirid-4-ilo     |
| LXXIII-76 | 4-cianocinamilo                          | 2-bromo-pirid-4-ilo     |
| LXXIII-77 | 3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo           | 2-bromo-pirid-4-ilo     |
| LXXIII-78 | 3-(4-clorofenil)-but-2-enilo             | 2-bromo-pirid-4-ilo     |
| LXXIII-79 | 3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo          | 2-bromo-pirid-4-ilo     |
| LXXIII-80 | 3-cloro-4-fluoro-cinamilo                | 2-bromo-pirid-4-ilo     |
| LXXIII-81 | 3,5-dicloro-cinamilo                     | 2-bromo-pirid-4-ilo     |
| LXXIII-82 | 5-fenil-penta-2,4-dienilo                | 2-bromo-pirid-4-ilo     |
| LXXIII-83 | 4-isopropiloxicarbonilamino-<br>cinamilo | 2-bromo-pirid-4-ilo     |
| LXXIII-84 | 3-naftalen-2-il-alilo                    | 2-bromo-pirid-4-ilo     |
| LXXIII-85 | 3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo  | 2-bromo-pirid-4-ilo     |
| LXXIII-86 | 3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo           | 2-bromo-pirid-4-ilo     |
| LXXIII-87 | 3-piridin-4-il-alilo                     | 2-bromo-pirid-4-ilo     |

|            |                                          |                         |
|------------|------------------------------------------|-------------------------|
| LXXIII-88  | 3-(2-cloro-piridin-4-il)-alilo           | 2-bromo-pirid-4-ilo     |
| LXXIII-89  | Cinamilo                                 | 2-fluoro-pirid-4-ilo    |
| LXXIII-90  | 4-clorocinamilo                          | 2-fluoro-pirid-4-ilo    |
| LXXIII-91  | 4-fluorocinamilo                         | 2-fluoro-pirid-4-ilo    |
| LXXIII-92  | 4-bromocinamilo                          | 2-fluoro-pirid-4-ilo    |
| LXXIII-93  | 4-trifluorometilcinamilo                 | 2-fluoro-pirid-4-ilo    |
| LXXIII-94  | 4-trifluorometoxicinamilo                | 2-fluoro-pirid-4-ilo    |
| LXXIII-95  | 4-pentafluoroetoxicinamilo               | 2-fluoro-pirid-4-ilo    |
| LXXIII-96  | 4-metoxicinamilo                         | 2-fluoro-pirid-4-ilo    |
| LXXIII-97  | 4-etoxicinamilo                          | 2-fluoro-pirid-4-ilo    |
| LXXIII-98  | 4-cianocinamilo                          | 2-fluoro-pirid-4-ilo    |
| LXXIII-99  | 3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo           | 2-fluoro-pirid-4-ilo    |
| LXXIII-100 | 3-(4-clorofenil)-but-2-enilo             | 2-fluoro-pirid-4-ilo    |
| LXXIII-101 | 3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo          | 2-fluoro-pirid-4-ilo    |
| LXXIII-102 | 3-cloro-4-fluoro-cinamilo                | 2-fluoro-pirid-4-ilo    |
| LXXIII-103 | 3,5-dicloro-cinamilo                     | 2-fluoro-pirid-4-ilo    |
| LXXIII-104 | 5-fenil-penta-2,4-dienilo                | 2-fluoro-pirid-4-ilo    |
| LXXIII-105 | 4-isopropiloxicarbonilamino-<br>cinamilo | 2-fluoro-pirid-4-ilo    |
| LXXIII-106 | 3-naftalen-2-il-alilo                    | 2-fluoro-pirid-4-ilo    |
| LXXIII-107 | 3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo  | 2-fluoro-pirid-4-ilo    |
| LXXIII-108 | 3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo           | 2-fluoro-pirid-4-ilo    |
| LXXIII-109 | 3-piridin-4-il-alilo                     | 2-fluoro-pirid-4-ilo    |
| LXXIII-110 | 3-(2-cloro-piridin-4-il)-alilo           | 2-fluoro-pirid-4-ilo    |
| LXXIII-111 | Cinamilo                                 | 2,6-dibromo-pirid-4-ilo |
| LXXIII-112 | 4-clorocinamilo                          | 2,6-dibromo-pirid-4-ilo |
| LXXIII-113 | 4-fluorocinamilo                         | 2,6-dibromo-pirid-4-ilo |
| LXXIII-114 | 4-bromocinamilo                          | 2,6-dibromo-pirid-4-ilo |
| LXXIII-115 | 4-trifluorometilcinamilo                 | 2,6-dibromo-pirid-4-ilo |

|            |                                          |                              |
|------------|------------------------------------------|------------------------------|
| LXXIII-116 | 4-trifluorometoxicinamilo                | 2,6-dibromo-pirid-4-ilo      |
| LXXIII-117 | 4-pentafluoroetoxicinamilo               | 2,6-dibromo-pirid-4-ilo      |
| LXXIII-118 | 4-metoxicinamilo                         | 2,6-dibromo-pirid-4-ilo      |
| LXXIII-119 | 4-etoxicinamilo                          | 2,6-dibromo-pirid-4-ilo      |
| LXXIII-120 | 4-cianocinamilo                          | 2,6-dibromo-pirid-4-ilo      |
| LXXIII-121 | 3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo           | 2,6-dibromo-pirid-4-ilo      |
| LXXIII-122 | 3-(4-clorofenil)-but-2-enilo             | 2,6-dibromo-pirid-4-ilo      |
| LXXIII-123 | 3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo          | 2,6-dibromo-pirid-4-ilo      |
| LXXIII-124 | 3-cloro-4-fluoro-cinamilo                | 2,6-dibromo-pirid-4-ilo      |
| LXXIII-125 | 3,5-dicloro-cinamilo                     | 2,6-dibromo-pirid-4-ilo      |
| LXXIII-126 | 5-fenil-penta-2,4-dienilo                | 2,6-dibromo-pirid-4-ilo      |
| LXXIII-127 | 4-isopropiloxicarbonilamino-<br>cinamilo | 2,6-dibromo-pirid-4-ilo      |
| LXXIII-128 | 3-naftalen-2-il-alilo                    | 2,6-dibromo-pirid-4-ilo      |
| LXXIII-129 | 3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo  | 2,6-dibromo-pirid-4-ilo      |
| LXXIII-130 | 3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo           | 2,6-dibromo-pirid-4-ilo      |
| LXXIII-131 | 3-piridin-4-il-alilo                     | 2,6-dibromo-pirid-4-ilo      |
| LXXIII-132 | 3-(2-cloro-piridin-4-il)-alilo           | 2,6-dibromo-pirid-4-ilo      |
| LXXIII-133 | Cinamilo                                 | 2-trifluorometil-pirid-4-ilo |
| LXXIII-134 | 4-clorocinamilo                          | 2-trifluorometil-pirid-4-ilo |
| LXXIII-135 | 4-fluorocinamilo                         | 2-trifluorometil-pirid-4-ilo |
| LXXIII-136 | 4-bromocinamilo                          | 2-trifluorometil-pirid-4-ilo |
| LXXIII-137 | 4-trifluorometilcinamilo                 | 2-trifluorometil-pirid-4-ilo |
| LXXIII-138 | 4-trifluorometoxicinamilo                | 2-trifluorometil-pirid-4-ilo |
| LXXIII-139 | 4-pentafluoroetoxicinamilo               | 2-trifluorometil-pirid-4-ilo |
| LXXIII-140 | 4-metoxicinamilo                         | 2-trifluorometil-pirid-4-ilo |
| LXXIII-141 | 4-etoxicinamilo                          | 2-trifluorometil-pirid-4-ilo |
| LXXIII-142 | 4-cianocinamilo                          | 2-trifluorometil-pirid-4-ilo |
| LXXIII-143 | 3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo           | 2-trifluorometil-pirid-4-ilo |

|            |                                          |                              |
|------------|------------------------------------------|------------------------------|
| LXXIII-144 | 3-(4-clorofenil)-but-2-enilo             | 2-trifluorometil-pirid-4-ilo |
| LXXIII-145 | 3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo          | 2-trifluorometil-pirid-4-ilo |
| LXXIII-146 | 3-cloro-4-fluoro-cinamilo                | 2-trifluorometil-pirid-4-ilo |
| LXXIII-147 | 3,5-dicloro-cinamilo                     | 2-trifluorometil-pirid-4-ilo |
| LXXIII-148 | 5-fenil-penta-2,4-dienilo                | 2-trifluorometil-pirid-4-ilo |
| LXXIII-149 | 4-isopropiloxicarbonilamino-<br>cinamilo | 2-trifluorometil-pirid-4-ilo |
| LXXIII-150 | 3-naftalen-2-il-alilo                    | 2-trifluorometil-pirid-4-ilo |
| LXXIII-151 | 3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo  | 2-trifluorometil-pirid-4-ilo |
| LXXIII-152 | 3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo           | 2-trifluorometil-pirid-4-ilo |
| LXXIII-153 | 3-piridin-4-il-alilo                     | 2-trifluorometil-pirid-4-ilo |
| LXXIII-154 | 3-(2-cloro-piridin-4-il)-alilo           | 2-trifluorometil-pirid-4-ilo |
| LXXIII-155 | Cinamilo                                 | 2,6-difluoro-pirid-4-ilo     |
| LXXIII-156 | 4-clorocinamilo                          | 2,6-difluoro-pirid-4-ilo     |
| LXXIII-157 | 4-fluorocinamilo                         | 2,6-difluoro-pirid-4-ilo     |
| LXXIII-158 | 4-bromocinamilo                          | 2,6-difluoro-pirid-4-ilo     |
| LXXIII-159 | 4-trifluorometilcinamilo                 | 2,6-difluoro-pirid-4-ilo     |
| LXXIII-160 | 4-trifluorometoxicinamilo                | 2,6-difluoro-pirid-4-ilo     |
| LXXIII-161 | 4-pentafluoroetoxicinamilo               | 2,6-difluoro-pirid-4-ilo     |
| LXXIII-162 | 4-metoxicinamilo                         | 2,6-difluoro-pirid-4-ilo     |
| LXXIII-163 | 4-etoxicinamilo                          | 2,6-difluoro-pirid-4-ilo     |
| LXXIII-164 | 4-cianocinamilo                          | 2,6-difluoro-pirid-4-ilo     |
| LXXIII-165 | 3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo           | 2,6-difluoro-pirid-4-ilo     |
| LXXIII-166 | 3-(4-clorofenil)-but-2-enilo             | 2,6-difluoro-pirid-4-ilo     |
| LXXIII-167 | 3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo          | 2,6-difluoro-pirid-4-ilo     |
| LXXIII-168 | 3-cloro-4-fluoro-cinamilo                | 2,6-difluoro-pirid-4-ilo     |
| LXXIII-169 | 3,5-dicloro-cinamilo                     | 2,6-difluoro-pirid-4-ilo     |
| LXXIII-170 | 5-fenil-penta-2,4-dienilo                | 2,6-difluoro-pirid-4-ilo     |

|            |                                          |                          |
|------------|------------------------------------------|--------------------------|
| LXXIII-171 | 4-isopropiloxycarbonilamino-<br>cinamilo | 2,6-difluoro-pirid-4-ilo |
| LXXIII-172 | 3-naftalen-2-il-alilo                    | 2,6-difluoro-pirid-4-ilo |
| LXXIII-173 | 3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo  | 2,6-difluoro-pirid-4-ilo |
| LXXIII-174 | 3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo           | 2,6-difluoro-pirid-4-ilo |
| LXXIII-175 | 3-piridin-4-il-alilo                     | 2,6-difluoro-pirid-4-ilo |
| LXXIII-176 | 3-(2-cloro-piridin-4-il)-alilo           | 2,6-difluoro-pirid-4-ilo |
| LXXIII-177 | Cinamilo                                 | metilo                   |
| LXXIII-178 | 4-clorocinamilo                          | metilo                   |
| LXXIII-179 | 4-fluorocinamilo                         | metilo                   |
| LXXIII-180 | 4-bromocinamilo                          | metilo                   |
| LXXIII-181 | 4-trifluorometilcinamilo                 | metilo                   |
| LXXIII-182 | 4-trifluorometoxicinamilo                | metilo                   |
| LXXIII-183 | 4-pentafluoroetoxicinamilo               | metilo                   |
| LXXIII-184 | 4-metoxicinamilo                         | metilo                   |
| LXXIII-185 | 4-etoxicinamilo                          | metilo                   |
| LXXIII-186 | 4-cianocinamilo                          | metilo                   |
| LXXIII-187 | 3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo           | metilo                   |
| LXXIII-188 | 3-(4-clorofenil)-but-2-enilo             | metilo                   |
| LXXIII-189 | 3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo          | metilo                   |
| LXXIII-190 | 3-cloro-4-fluoro-cinamilo                | metilo                   |
| LXXIII-191 | 3,5-dicloro-cinamilo                     | metilo                   |
| LXXIII-192 | 5-fenil-penta-2,4-dienilo                | metilo                   |
| LXXIII-193 | 4-isopropiloxycarbonilamino-<br>cinamilo | metilo                   |
| LXXIII-194 | 3-naftalen-2-il-alilo                    | metilo                   |
| LXXIII-195 | 3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo  | metilo                   |
| LXXIII-196 | 3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo           | metilo                   |
| LXXIII-197 | 3-piridin-4-il-alilo                     | metilo                   |

|            |                                          |                      |
|------------|------------------------------------------|----------------------|
| LXXIII-198 | 3-(2-cloro-piridin-4-il)-alilo           | metilo               |
| LXXIII-199 | Cinamilo                                 | metoxietilo          |
| LXXIII-200 | 4-clorocinamilo                          | metoxietilo          |
| LXXIII-201 | 4-fluorocinamilo                         | metoxietilo          |
| LXXIII-202 | 4-bromocinamilo                          | metoxietilo          |
| LXXIII-203 | 4-trifluorometilcinamilo                 | metoxietilo          |
| LXXIII-204 | 4-trifluorometoxicinamilo                | metoxietilo          |
| LXXIII-205 | 4-pentafluoroetoxicinamilo               | metoxietilo          |
| LXXIII-206 | 4-metoxicinamilo                         | metoxietilo          |
| LXXIII-207 | 4-etoxicinamilo                          | metoxietilo          |
| LXXIII-208 | 4-cianocinamilo                          | metoxietilo          |
| LXXIII-209 | 3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo           | metoxietilo          |
| LXXIII-210 | 3-(4-clorofenil)-but-2-enilo             | metoxietilo          |
| LXXIII-211 | 3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo          | metoxietilo          |
| LXXIII-212 | 3-cloro-4-fluoro-cinamilo                | metoxietilo          |
| LXXIII-213 | 3,5-dicloro-cinamilo                     | metoxietilo          |
| LXXIII-214 | 5-fenil-penta-2,4-dienilo                | metoxietilo          |
| LXXIII-215 | 4-isopropiloxycarbonilamino-<br>cinamilo | metoxietilo          |
| LXXIII-216 | 3-naftalen-2-il-alilo                    | metoxietilo          |
| LXXIII-217 | 3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo  | metoxietilo          |
| LXXIII-218 | 3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo           | metoxietilo          |
| LXXIII-219 | 3-piridin-4-il-alilo                     | metoxietilo          |
| LXXIII-220 | 3-(2-cloro-piridin-4-il)-alilo           | metoxietilo          |
| LXXIII-221 | Cinamilo                                 | 2,2,2-trifluoroetilo |
| LXXIII-222 | 4-clorocinamilo                          | 2,2,2-trifluoroetilo |
| LXXIII-223 | 4-fluorocinamilo                         | 2,2,2-trifluoroetilo |
| LXXIII-224 | 4-bromocinamilo                          | 2,2,2-trifluoroetilo |
| LXXIII-225 | 4-trifluorometilcinamilo                 | 2,2,2-trifluoroetilo |

|            |                                          |                      |
|------------|------------------------------------------|----------------------|
| LXXIII-226 | 4-trifluorometoxicinamilo                | 2,2,2-trifluoroetilo |
| LXXIII-227 | 4-pentafluoroetoxicinamilo               | 2,2,2-trifluoroetilo |
| LXXIII-228 | 4-metoxicinamilo                         | 2,2,2-trifluoroetilo |
| LXXIII-229 | 4-etoxicinamilo                          | 2,2,2-trifluoroetilo |
| LXXIII-230 | 4-cianocinamilo                          | 2,2,2-trifluoroetilo |
| LXXIII-231 | 3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo           | 2,2,2-trifluoroetilo |
| LXXIII-232 | 3-(4-clorofenil)-but-2-enilo             | 2,2,2-trifluoroetilo |
| LXXIII-233 | 3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo          | 2,2,2-trifluoroetilo |
| LXXIII-234 | 3-cloro-4-fluoro-cinamilo                | 2,2,2-trifluoroetilo |
| LXXIII-235 | 3,5-dicloro-cinamilo                     | 2,2,2-trifluoroetilo |
| LXXIII-236 | 5-fenil-penta-2,4-dienilo                | 2,2,2-trifluoroetilo |
| LXXIII-237 | 4-isopropiloxycarbonilamino-<br>cinamilo | 2,2,2-trifluoroetilo |
| LXXIII-238 | 3-naftalen-2-il-alilo                    | 2,2,2-trifluoroetilo |
| LXXIII-239 | 3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo  | 2,2,2-trifluoroetilo |
| LXXIII-240 | 3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo           | 2,2,2-trifluoroetilo |
| LXXIII-241 | 3-piridin-4-il-alilo                     | 2,2,2-trifluoroetilo |
| LXXIII-242 | 3-(2-cloro-piridin-4-il)-alilo           | 2,2,2-trifluoroetilo |
| LXXIII-243 | Cinamilo                                 | metoxi               |
| LXXIII-244 | 4-clorocinamilo                          | metoxi               |
| LXXIII-245 | 4-fluorocinamilo                         | metoxi               |
| LXXIII-246 | 4-bromocinamilo                          | metoxi               |
| LXXIII-247 | 4-trifluorometilcinamilo                 | metoxi               |
| LXXIII-248 | 4-trifluorometoxicinamilo                | metoxi               |
| LXXIII-249 | 4-pentafluoroetoxicinamilo               | metoxi               |
| LXXIII-250 | 4-metoxicinamilo                         | metoxi               |
| LXXIII-251 | 4-etoxicinamilo                          | metoxi               |
| LXXIII-252 | 4-cianocinamilo                          | metoxi               |
| LXXIII-253 | 3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo           | metoxi               |

|            |                                         |                           |
|------------|-----------------------------------------|---------------------------|
| LXXIII-254 | 3-(4-clorofenil)-but-2-enilo            | metoxi                    |
| LXXIII-255 | 3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo         | metoxi                    |
| LXXIII-256 | 3-cloro-4-fluoro-cinamilo               | metoxi                    |
| LXXIII-257 | 3,5-dicloro-cinamilo                    | metoxi                    |
| LXXIII-258 | 5-fenil-penta-2,4-dienilo               | metoxi                    |
| LXXIII-259 | 4-isopropiloxicarbonilamino-cinamilo    | metoxi                    |
| LXXIII-260 | 3-naftalen-2-il-alilo                   | metoxi                    |
| LXXIII-261 | 3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo | metoxi                    |
| LXXIII-262 | 3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo          | metoxi                    |
| LXXIII-263 | 3-piridin-4-il-alilo                    | metoxi                    |
| LXXIII-264 | 3-(2-cloro-piridin-4-il)-alilo          | metoxi                    |
| LXXIII-265 | Cinamilo                                | 2,1,3-benzoxadiazol-5-ilo |
| LXXIII-266 | 4-clorocinamilo                         | 2,1,3-benzoxadiazol-5-ilo |
| LXXIII-267 | 4-fluorocinamilo                        | 2,1,3-benzoxadiazol-5-ilo |
| LXXIII-268 | 4-bromocinamilo                         | 2,1,3-benzoxadiazol-5-ilo |
| LXXIII-269 | 4-trifluorometilcinamilo                | 2,1,3-benzoxadiazol-5-ilo |
| LXXIII-270 | 4-trifluorometoxicinamilo               | 2,1,3-benzoxadiazol-5-ilo |
| LXXIII-271 | 4-pentafluoroetoxicinamilo              | 2,1,3-benzoxadiazol-5-ilo |
| LXXIII-272 | 4-metoxicinamilo                        | 2,1,3-benzoxadiazol-5-ilo |
| LXXIII-273 | 4-etoxicinamilo                         | 2,1,3-benzoxadiazol-5-ilo |
| LXXIII-274 | 4-cianocinamilo                         | 2,1,3-benzoxadiazol-5-ilo |
| LXXIII-275 | 3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo          | 2,1,3-benzoxadiazol-5-ilo |
| LXXIII-276 | 3-(4-clorofenil)-but-2-enilo            | 2,1,3-benzoxadiazol-5-ilo |
| LXXIII-277 | 3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo         | 2,1,3-benzoxadiazol-5-ilo |
| LXXIII-278 | 3-cloro-4-fluoro-cinamilo               | 2,1,3-benzoxadiazol-5-ilo |
| LXXIII-279 | 3,5-dicloro-cinamilo                    | 2,1,3-benzoxadiazol-5-ilo |
| LXXIII-280 | 5-fenil-penta-2,4-dienilo               | 2,1,3-benzoxadiazol-5-ilo |

|            |                                          |                           |
|------------|------------------------------------------|---------------------------|
| LXXIII-281 | 4-isopropiloxicarbonilamino-<br>cinamilo | 2,1,3-benzoxadiazol-5-ilo |
| LXXIII-282 | 3-naftalen-2-il-alilo                    | 2,1,3-benzoxadiazol-5-ilo |
| LXXIII-283 | 3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo  | 2,1,3-benzoxadiazol-5-ilo |
| LXXIII-284 | 3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo           | 2,1,3-benzoxadiazol-5-ilo |
| LXXIII-285 | 3-piridin-4-il-alilo                     | 2,1,3-benzoxadiazol-5-ilo |
| LXXIII-286 | 3-(2-cloro-piridin-4-il)-alilo           | 2,1,3-benzoxadiazol-5-ilo |
| LXXIII-287 | Cinamilo                                 | metoxipropilamino         |
| LXXIII-288 | 4-clorocinamilo                          | metoxipropilamino         |
| LXXIII-289 | 4-fluorocinamilo                         | metoxipropilamino         |
| LXXIII-290 | 4-bromocinamilo                          | metoxipropilamino         |
| LXXIII-291 | 4-trifluorometilcinamilo                 | metoxipropilamino         |
| LXXIII-292 | 4-trifluorometoxicinamilo                | metoxipropilamino         |
| LXXIII-293 | 4-pentafluoroetoxicinamilo               | metoxipropilamino         |
| LXXIII-294 | 4-metoxicinamilo                         | metoxipropilamino         |
| LXXIII-295 | 4-etoxicinamilo                          | metoxipropilamino         |
| LXXIII-296 | 4-cianocinamilo                          | metoxipropilamino         |
| LXXIII-297 | 3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo           | metoxipropilamino         |
| LXXIII-298 | 3-(4-clorofenil)-but-2-enilo             | metoxipropilamino         |
| LXXIII-299 | 3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo          | metoxipropilamino         |
| LXXIII-300 | 3-cloro-4-fluoro-cinamilo                | metoxipropilamino         |
| LXXIII-301 | 3,5-dicloro-cinamilo                     | metoxipropilamino         |
| LXXIII-302 | 5-fenil-penta-2,4-dienilo                | metoxipropilamino         |
| LXXIII-303 | 4-isopropiloxicarbonilamino-<br>cinamilo | metoxipropilamino         |
| LXXIII-304 | 3-naftalen-2-il-alilo                    | metoxipropilamino         |
| LXXIII-305 | 3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo  | metoxipropilamino         |
| LXXIII-306 | 3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo           | metoxipropilamino         |
| LXXIII-307 | 3-piridin-4-il-alilo                     | metoxipropilamino         |

|            |                                          |                      |
|------------|------------------------------------------|----------------------|
| LXXIII-308 | 3-(2-cloro-piridin-4-il)-alilo           | metoxipropilamino    |
| LXXIII-309 | Cinamilo                                 | 2-cloro-tiazol-5-ilo |
| LXXIII-310 | 4-clorocinamilo                          | 2-cloro-tiazol-5-ilo |
| LXXIII-311 | 4-fluorocinamilo                         | 2-cloro-tiazol-5-ilo |
| LXXIII-312 | 4-bromocinamilo                          | 2-cloro-tiazol-5-ilo |
| LXXIII-313 | 4-trifluorometilcinamilo                 | 2-cloro-tiazol-5-ilo |
| LXXIII-314 | 4-trifluorometoxicinamilo                | 2-cloro-tiazol-5-ilo |
| LXXIII-315 | 4-pentafluoroetoxicinamilo               | 2-cloro-tiazol-5-ilo |
| LXXIII-316 | 4-metoxicinamilo                         | 2-cloro-tiazol-5-ilo |
| LXXIII-317 | 4-etoxicinamilo                          | 2-cloro-tiazol-5-ilo |
| LXXIII-318 | 4-cianocinamilo                          | 2-cloro-tiazol-5-ilo |
| LXXIII-319 | 3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo           | 2-cloro-tiazol-5-ilo |
| LXXIII-320 | 3-(4-clorofenil)-but-2-enilo             | 2-cloro-tiazol-5-ilo |
| LXXIII-321 | 3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo          | 2-cloro-tiazol-5-ilo |
| LXXIII-322 | 3-cloro-4-fluoro-cinamilo                | 2-cloro-tiazol-5-ilo |
| LXXIII-323 | 3,5-dicloro-cinamilo                     | 2-cloro-tiazol-5-ilo |
| LXXIII-324 | 5-fenil-penta-2,4-dienilo                | 2-cloro-tiazol-5-ilo |
| LXXIII-325 | 4-isopropiloxicarbonilamino-<br>cinamilo | 2-cloro-tiazol-5-ilo |
| LXXIII-326 | 3-naftalen-2-il-alilo                    | 2-cloro-tiazol-5-ilo |
| LXXIII-327 | 3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo  | 2-cloro-tiazol-5-ilo |
| LXXIII-328 | 3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo           | 2-cloro-tiazol-5-ilo |
| LXXIII-329 | 3-piridin-4-il-alilo                     | 2-cloro-tiazol-5-ilo |
| LXXIII-330 | 3-(2-cloro-piridin-4-il)-alilo           | 2-cloro-tiazol-5-ilo |
| LXXIII-331 | Cinamilo                                 | i-propilamino        |
| LXXIII-332 | 4-clorocinamilo                          | i-propilamino        |
| LXXIII-333 | 4-fluorocinamilo                         | i-propilamino        |
| LXXIII-334 | 4-bromocinamilo                          | i-propilamino        |
| LXXIII-335 | 4-trifluorometilcinamilo                 | i-propilamino        |

|            |                                          |                             |
|------------|------------------------------------------|-----------------------------|
| LXXIII-336 | 4-trifluorometoxicinamilo                | i-propilamino               |
| LXXIII-337 | 4-pentafluoroetoxicinamilo               | i-propilamino               |
| LXXIII-338 | 4-metoxicinamilo                         | i-propilamino               |
| LXXIII-339 | 4-etoxicinamilo                          | i-propilamino               |
| LXXIII-340 | 4-cianocinamilo                          | i-propilamino               |
| LXXIII-341 | 3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo           | i-propilamino               |
| LXXIII-342 | 3-(4-clorofenil)-but-2-enilo             | i-propilamino               |
| LXXIII-343 | 3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo          | i-propilamino               |
| LXXIII-344 | 3-cloro-4-fluoro-cinamilo                | i-propilamino               |
| LXXIII-345 | 3,5-dicloro-cinamilo                     | i-propilamino               |
| LXXIII-346 | 5-fenil-penta-2,4-dienilo                | i-propilamino               |
| LXXIII-347 | 4-isopropiloxicarbonilamino-<br>cinamilo | i-propilamino               |
| LXXIII-348 | 3-naftalen-2-il-alilo                    | i-propilamino               |
| LXXIII-349 | 3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo  | i-propilamino               |
| LXXIII-350 | 3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo           | i-propilamino               |
| LXXIII-351 | 3-piridin-4-il-alilo                     | i-propilamino               |
| LXXIII-352 | 3-(2-cloro-piridin-4-il)-alilo           | i-propilamino               |
| LXXIII-353 | Cinamilo                                 | 1,3-dioxolan-2-il-etilamino |
| LXXIII-354 | 4-clorocinamilo                          | 1,3-dioxolan-2-il-etilamino |
| LXXIII-355 | 4-fluorocinamilo                         | 1,3-dioxolan-2-il-etilamino |
| LXXIII-356 | 4-bromocinamilo                          | 1,3-dioxolan-2-il-etilamino |
| LXXIII-357 | 4-trifluorometilcinamilo                 | 1,3-dioxolan-2-il-etilamino |
| LXXIII-358 | 4-trifluorometoxicinamilo                | 1,3-dioxolan-2-il-etilamino |
| LXXIII-359 | 4-pentafluoroetoxicinamilo               | 1,3-dioxolan-2-il-etilamino |
| LXXIII-360 | 4-metoxicinamilo                         | 1,3-dioxolan-2-il-etilamino |
| LXXIII-361 | 4-etoxicinamilo                          | 1,3-dioxolan-2-il-etilamino |
| LXXIII-362 | 4-cianocinamilo                          | 1,3-dioxolan-2-il-etilamino |
| LXXIII-363 | 3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo           | 1,3-dioxolan-2-il-etilamino |

|            |                                          |                               |
|------------|------------------------------------------|-------------------------------|
| LXXIII-364 | 3-(4-clorofenil)-but-2-enilo             | 1,3-dioxolan-2-il-etilamino   |
| LXXIII-365 | 3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo          | 1,3-dioxolan-2-il-etilamino   |
| LXXIII-366 | 3-cloro-4-fluoro-cinamilo                | 1,3-dioxolan-2-il-etilamino   |
| LXXIII-367 | 3,5-dicloro-cinamilo                     | 1,3-dioxolan-2-il-etilamino   |
| LXXIII-368 | 5-fenil-penta-2,4-dienilo                | 1,3-dioxolan-2-il-etilamino   |
| LXXIII-369 | 4-isopropiloxicarbonilamino-<br>cinamilo | 1,3-dioxolan-2-il-etilamino   |
| LXXIII-370 | 3-naftalen-2-il-alilo                    | 1,3-dioxolan-2-il-etilamino   |
| LXXIII-371 | 3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo  | 1,3-dioxolan-2-il-etilamino   |
| LXXIII-372 | 3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo           | 1,3-dioxolan-2-il-etilamino   |
| LXXIII-373 | 3-piridin-4-il-alilo                     | 1,3-dioxolan-2-il-etilamino   |
| LXXIII-374 | 3-(2-cloro-piridin-4-il)-alilo           | 1,3-dioxolan-2-il-etilamino   |
| LXXIII-375 | Cinamilo                                 | 2-cloro-pirid-4-il-metilamino |
| LXXIII-376 | 4-clorocinamilo                          | 2-cloro-pirid-4-il-metilamino |
| LXXIII-377 | 4-fluorocinamilo                         | 2-cloro-pirid-4-il-metilamino |
| LXXIII-378 | 4-bromocinamilo                          | 2-cloro-pirid-4-il-metilamino |
| LXXIII-379 | 4-trifluorometilcinamilo                 | 2-cloro-pirid-4-il-metilamino |
| LXXIII-380 | 4-trifluorometoxicinamilo                | 2-cloro-pirid-4-il-metilamino |
| LXXIII-381 | 4-pentafluoroetoxicinamilo               | 2-cloro-pirid-4-il-metilamino |
| LXXIII-382 | 4-metoxicinamilo                         | 2-cloro-pirid-4-il-metilamino |
| LXXIII-383 | 4-etoxicinamilo                          | 2-cloro-pirid-4-il-metilamino |
| LXXIII-384 | 4-cianocinamilo                          | 2-cloro-pirid-4-il-metilamino |
| LXXIII-385 | 3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo           | 2-cloro-pirid-4-il-metilamino |
| LXXIII-386 | 3-(4-clorofenil)-but-2-enilo             | 2-cloro-pirid-4-il-metilamino |
| LXXIII-387 | 3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo          | 2-cloro-pirid-4-il-metilamino |
| LXXIII-388 | 3-cloro-4-fluoro-cinamilo                | 2-cloro-pirid-4-il-metilamino |
| LXXIII-389 | 3,5-dicloro-cinamilo                     | 2-cloro-pirid-4-il-metilamino |
| LXXIII-390 | 5-fenil-penta-2,4-dienilo                | 2-cloro-pirid-4-il-metilamino |

|            |                                          |                                            |
|------------|------------------------------------------|--------------------------------------------|
| LXXIII-391 | 4-isopropiloxycarbonilamino-<br>cinamilo | 2-cloro-pirid-4-il-metilamino              |
| LXXIII-392 | 3-naftalen-2-il-alilo                    | 2-cloro-pirid-4-il-metilamino              |
| LXXIII-393 | 3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo  | 2-cloro-pirid-4-il-metilamino              |
| LXXIII-394 | 3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo           | 2-cloro-pirid-4-il-metilamino              |
| LXXIII-395 | 3-piridin-4-il-alilo                     | 2-cloro-pirid-4-il-metilamino              |
| LXXIII-396 | 3-(2-cloro-piridin-4-il)-alilo           | 2-cloro-pirid-4-il-metilamino              |
| LXXIII-397 | Cinamilo                                 | 2-trifluorometil-pirid-5-il-<br>metilamino |
| LXXIII-398 | 4-clorocinamilo                          | 2-trifluorometil-pirid-5-il-<br>metilamino |
| LXXIII-399 | 4-fluorocinamilo                         | 2-trifluorometil-pirid-5-il-<br>metilamino |
| LXXIII-400 | 4-bromocinamilo                          | 2-trifluorometil-pirid-5-il-<br>metilamino |
| LXXIII-401 | 4-trifluorometilcinamilo                 | 2-trifluorometil-pirid-5-il-<br>metilamino |
| LXXIII-402 | 4-trifluorometoxicinamilo                | 2-trifluorometil-pirid-5-il-<br>metilamino |
| LXXIII-403 | 4-pentafluoroetoxicinamilo               | 2-trifluorometil-pirid-5-il-<br>metilamino |
| LXXIII-404 | 4-metoxicinamilo                         | 2-trifluorometil-pirid-5-il-<br>metilamino |
| LXXIII-405 | 4-etoxicinamilo                          | 2-trifluorometil-pirid-5-il-<br>metilamino |
| LXXIII-406 | 4-cianocinamilo                          | 2-trifluorometil-pirid-5-il-<br>metilamino |
| LXXIII-407 | 3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo           | 2-trifluorometil-pirid-5-il-<br>metilamino |

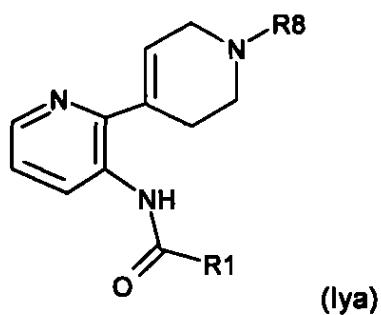
|            |                                          |                                            |
|------------|------------------------------------------|--------------------------------------------|
| LXXIII-408 | 3-(4-clorofenil)-but-2-enilo             | 2-trifluorometil-pirid-5-il-<br>metilamino |
| LXXIII-409 | 3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo          | 2-trifluorometil-pirid-5-il-<br>metilamino |
| LXXIII-410 | 3-cloro-4-fluoro-cinamilo                | 2-trifluorometil-pirid-5-il-<br>metilamino |
| LXXIII-411 | 3,5-dicloro-cinamilo                     | 2-trifluorometil-pirid-5-il-<br>metilamino |
| LXXIII-412 | 5-fenil-penta-2,4-dienilo                | 2-trifluorometil-pirid-5-il-<br>metilamino |
| LXXIII-413 | 4-isopropiloxicarbonilamino-<br>cinamilo | 2-trifluorometil-pirid-5-il-<br>metilamino |
| LXXIII-414 | 3-naftalen-2-il-alilo                    | 2-trifluorometil-pirid-5-il-<br>metilamino |
| LXXIII-415 | 3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo  | 2-trifluorometil-pirid-5-il-<br>metilamino |
| LXXIII-416 | 3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo           | 2-trifluorometil-pirid-5-il-<br>metilamino |
| LXXIII-417 | 3-piridin-4-il-alilo                     | 2-trifluorometil-pirid-5-il-<br>metilamino |
| LXXIII-418 | 3-(2-cloro-piridin-4-il)-alilo           | 2-trifluorometil-pirid-5-il-<br>metilamino |
| LXXIII-419 | Cinamilo                                 | metilamino                                 |
| LXXIII-420 | 4-clorocinamilo                          | metilamino                                 |
| LXXIII-421 | 4-fluorocinamilo                         | metilamino                                 |
| LXXIII-422 | 4-bromocinamilo                          | metilamino                                 |
| LXXIII-423 | 4-trifluorometilcinamilo                 | metilamino                                 |
| LXXIII-424 | 4-trifluorometoxicinamilo                | metilamino                                 |
| LXXIII-425 | 4-pentafluoroetoxicinamilo               | metilamino                                 |

|            |                                          |            |
|------------|------------------------------------------|------------|
| LXXIII-426 | 4-metoxicinamilo                         | metilamino |
| LXXIII-427 | 4-etoxicinamilo                          | metilamino |
| LXXIII-428 | 4-cianocinamilo                          | metilamino |
| LXXIII-429 | 3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo           | metilamino |
| LXXIII-430 | 3-(4-clorofenil)-but-2-enilo             | metilamino |
| LXXIII-431 | 3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo          | metilamino |
| LXXIII-432 | 3-cloro-4-fluoro-cinamilo                | metilamino |
| LXXIII-433 | 3,5-dicloro-cinamilo                     | metilamino |
| LXXIII-434 | 5-fenil-penta-2,4-dienilo                | metilamino |
| LXXIII-435 | 4-isopropiloxycarbonilamino-<br>cinamilo | metilamino |
| LXXIII-436 | 3-naftalen-2-il-alilo                    | metilamino |
| LXXIII-437 | 3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo  | metilamino |
| LXXIII-438 | 3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo           | metilamino |
| LXXIII-439 | 3-piridin-4-il-alilo                     | metilamino |
| LXXIII-440 | 3-(2-cloro-piridin-4-il)-alilo           | metilamino |
| LXXIII-441 | Cinamilo                                 | etilamino  |
| LXXIII-442 | 4-clorocinamilo                          | etilamino  |
| LXXIII-443 | 4-fluorocinamilo                         | etilamino  |
| LXXIII-444 | 4-bromocinamilo                          | etilamino  |
| LXXIII-445 | 4-trifluorometilcinamilo                 | etilamino  |
| LXXIII-446 | 4-trifluorometoxicinamilo                | etilamino  |
| LXXIII-447 | 4-pentafluoroetoxicinamilo               | etilamino  |
| LXXIII-448 | 4-metoxicinamilo                         | etilamino  |
| LXXIII-449 | 4-etoxicinamilo                          | etilamino  |
| LXXIII-450 | 4-cianocinamilo                          | etilamino  |
| LXXIII-451 | 3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo           | etilamino  |
| LXXIII-452 | 3-(4-clorofenil)-but-2-enilo             | etilamino  |
| LXXIII-453 | 3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo          | etilamino  |

|            |                                          |                          |
|------------|------------------------------------------|--------------------------|
| LXXIII-454 | 3-cloro-4-fluoro-cinamilo                | etilamino                |
| LXXIII-455 | 3,5-dicloro-cinamilo                     | etilamino                |
| LXXIII-456 | 5-fenil-penta-2,4-dienilo                | etilamino                |
| LXXIII-457 | 4-isopropiloxicarbonilamino-<br>cinamilo | etilamino                |
| LXXIII-458 | 3-naftalen-2-il-alilo                    | etilamino                |
| LXXIII-459 | 3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo  | etilamino                |
| LXXIII-460 | 3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo           | etilamino                |
| LXXIII-461 | 3-piridin-4-il-alilo                     | etilamino                |
| LXXIII-462 | 3-(2-cloro-piridin-4-il)-alilo           | etilamino                |
| LXXIII-463 | Cinamilo                                 | 2-cloro-pirid-4-il-amino |
| LXXIII-464 | 4-clorocinamilo                          | 2-cloro-pirid-4-il-amino |
| LXXIII-465 | 4-fluorocinamilo                         | 2-cloro-pirid-4-il-amino |
| LXXIII-466 | 4-bromocinamilo                          | 2-cloro-pirid-4-il-amino |
| LXXIII-467 | 4-trifluorometilcinamilo                 | 2-cloro-pirid-4-il-amino |
| LXXIII-468 | 4-trifluorometoxicinamilo                | 2-cloro-pirid-4-il-amino |
| LXXIII-469 | 4-pentafluoroetoxicinamilo               | 2-cloro-pirid-4-il-amino |
| LXXIII-470 | 4-metoxicinamilo                         | 2-cloro-pirid-4-il-amino |
| LXXIII-471 | 4-etoxicinamilo                          | 2-cloro-pirid-4-il-amino |
| LXXIII-472 | 4-cianocinamilo                          | 2-cloro-pirid-4-il-amino |
| LXXIII-473 | 3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo           | 2-cloro-pirid-4-il-amino |
| LXXIII-474 | 3-(4-clorofenil)-but-2-enilo             | 2-cloro-pirid-4-il-amino |
| LXXIII-475 | 3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo          | 2-cloro-pirid-4-il-amino |
| LXXIII-476 | 3-cloro-4-fluoro-cinamilo                | 2-cloro-pirid-4-il-amino |
| LXXIII-477 | 3,5-dicloro-cinamilo                     | 2-cloro-pirid-4-il-amino |
| LXXIII-478 | 5-fenil-penta-2,4-dienilo                | 2-cloro-pirid-4-il-amino |
| LXXIII-479 | 4-isopropiloxicarbonilamino-<br>cinamilo | 2-cloro-pirid-4-il-amino |
| LXXIII-480 | 3-naftalen-2-il-alilo                    | 2-cloro-pirid-4-il-amino |

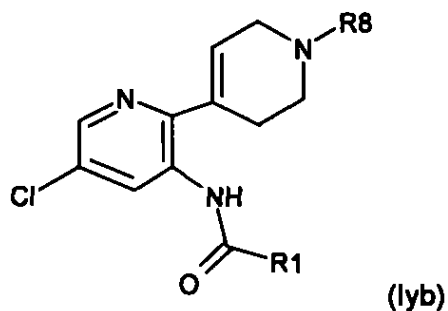
|            |                                          |                          |
|------------|------------------------------------------|--------------------------|
| LXXIII-481 | 3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo  | 2-cloro-pirid-4-il-amino |
| LXXIII-482 | 3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo           | 2-cloro-pirid-4-il-amino |
| LXXIII-483 | 3-piridin-4-il-alilo                     | 2-cloro-pirid-4-il-amino |
| LXXIII-484 | 3-(2-cloro-piridin-4-il)-alilo           | 2-cloro-pirid-4-il-amino |
| LXXIII-485 | Cinamilo                                 | metoxietilamino          |
| LXXIII-486 | 4-clorocinamilo                          | metoxietilamino          |
| LXXIII-487 | 4-fluorocinamilo                         | metoxietilamino          |
| LXXIII-488 | 4-bromocinamilo                          | metoxietilamino          |
| LXXIII-489 | 4-trifluorometilcinamilo                 | metoxietilamino          |
| LXXIII-490 | 4-trifluorometoxicinamilo                | metoxietilamino          |
| LXXIII-491 | 4-pentafluoroetoxicinamilo               | metoxietilamino          |
| LXXIII-492 | 4-metoxicinamilo                         | metoxietilamino          |
| LXXIII-493 | 4-etoxicinamilo                          | metoxietilamino          |
| LXXIII-494 | 4-cianocinamilo                          | metoxietilamino          |
| LXXIII-495 | 3-(6-cloro-piridin-3-il)-alilo           | metoxietilamino          |
| LXXIII-496 | 3-(4-clorofenil)-but-2-enilo             | metoxietilamino          |
| LXXIII-497 | 3-(4-clorofenil)-3-fluoro-alilo          | metoxietilamino          |
| LXXIII-498 | 3-cloro-4-fluoro-cinamilo                | metoxietilamino          |
| LXXIII-499 | 3,5-dicloro-cinamilo                     | metoxietilamino          |
| LXXIII-500 | 5-fenil-penta-2,4-dienilo                | metoxietilamino          |
| LXXIII-501 | 4-isopropiloxycarbonilamino-<br>cinamilo | metoxietilamino          |
| LXXIII-502 | 3-naftalen-2-il-alilo                    | metoxietilamino          |
| LXXIII-503 | 3-(5-trifluorometil-piridin-2-il)-alilo  | metoxietilamino          |
| LXXIII-504 | 3-(5-cloro-piridin-2-il)-alilo           | metoxietilamino          |
| LXXIII-505 | 3-piridin-4-il-alilo                     | metoxietilamino          |
| LXXIII-506 | 3-(2-cloro-piridin-4-il)-alilo           | metoxietilamino          |

La Tabla LXXIV proporciona los 506 compuestos de Fórmula Iya



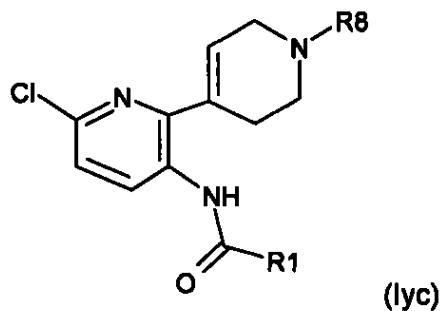
cuyos valores de  $R^8$  y  $R^1$  se indican en la Tabla 73.

La Tabla LXXV proporciona los 506 compuestos de Fórmula Iyb



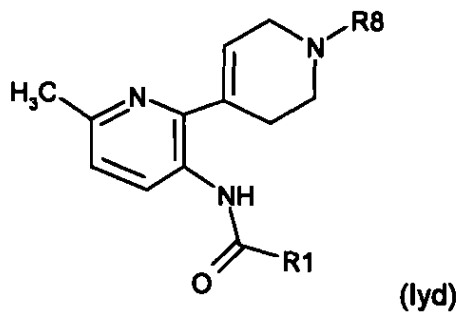
cuyos valores de  $R^8$  y  $R^1$  se indican en la Tabla 73.

La Tabla LXXVI proporciona los 506 compuestos de Fórmula Iyc



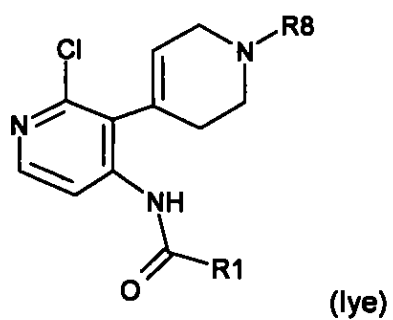
cuyos valores de  $R^8$  y  $R^1$  se indican en la Tabla 73.

La Tabla LXXVII proporciona los 506 compuestos de Fórmula Iyd



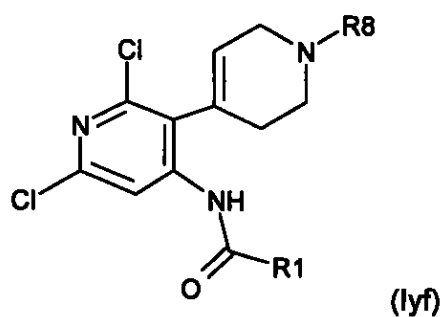
cuyos valores de  $R^8$  y  $R^1$  se indican en la Tabla 73

La Tabla LXXVIII proporciona los 506 compuestos de Fórmula Iye



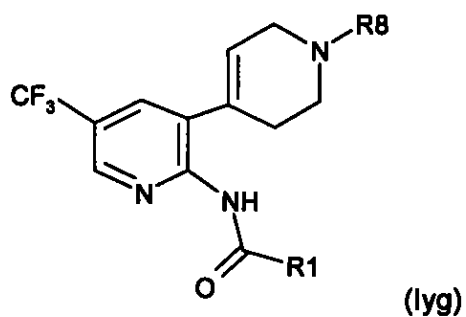
cuyos valores de  $R^8$  y  $R^1$  se indican en la Tabla 73

La Tabla LXXIX proporciona los 506 compuestos de Fórmula Iyf



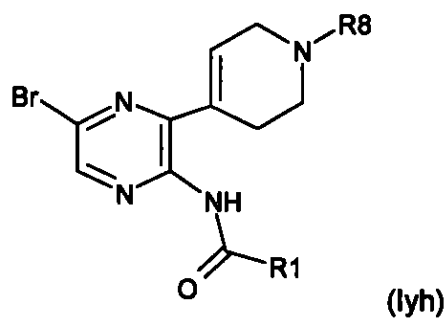
cuyos valores de  $R^8$  y  $R^1$  se indican en la Tabla 73.

La Tabla LXXX proporciona los 506 compuestos de Fórmula Iyg



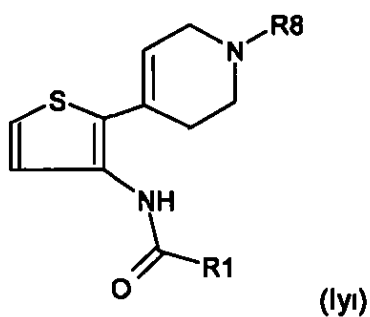
cuyos valores de  $R^8$  y  $R^1$  se indican en la Tabla 73

La Tabla LXXXI proporciona los 506 compuestos de Fórmula Iyh



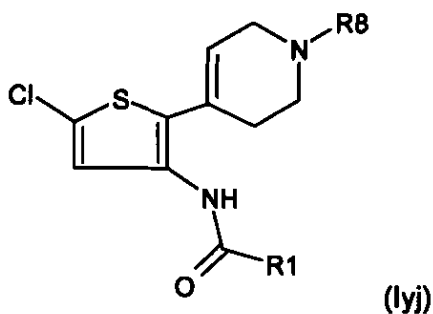
cuyos valores de  $R^8$  y  $R^1$  se indican en la Tabla 73.

La Tabla LXXXII proporciona los 506 compuestos de Fórmula Iyi



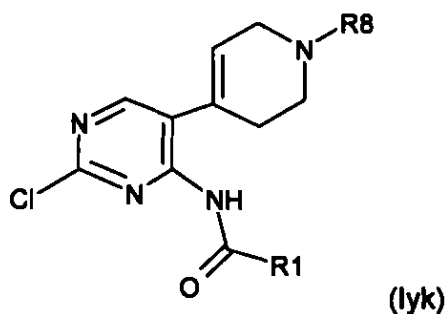
cuyos valores de  $R^8$  y  $R^1$  se indican en la Tabla 73

La Tabla LXXXIII proporciona los 506 compuestos de Fórmula lyj



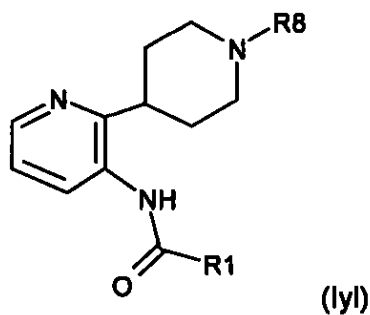
cuyos valores de  $R^8$  y  $R^1$  se indican en la Tabla 73

La Tabla LXXXIV proporciona los 506 compuestos de Fórmula lyk



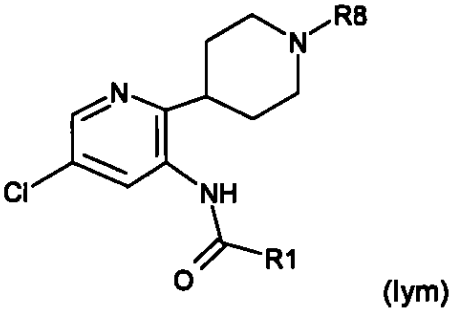
cuyos valores de  $R^8$  y  $R^1$  se indican en la Tabla 73

La Tabla LXXXV proporciona los 506 compuestos de Fórmula lyl



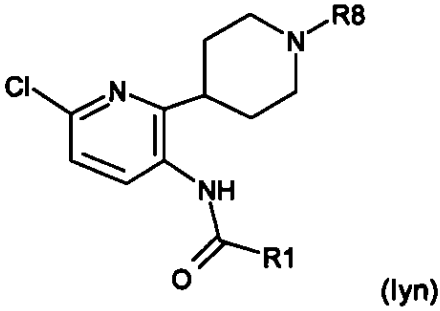
cuyos valores de  $R^8$  y  $R^1$  se indican en la Tabla 73

La Tabla LXXXVI proporciona los 506 compuestos de Fórmula lym



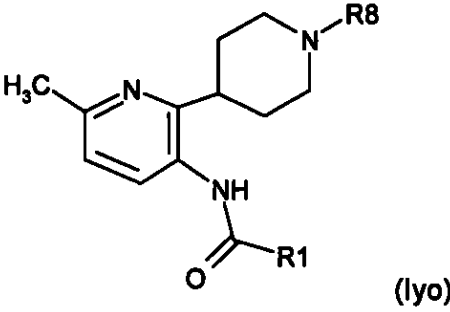
cuyos valores de R<sup>8</sup> y R<sup>1</sup> se indican en la Tabla 73

La Tabla LXXXVII proporciona los 506 compuestos de Fórmula lyn



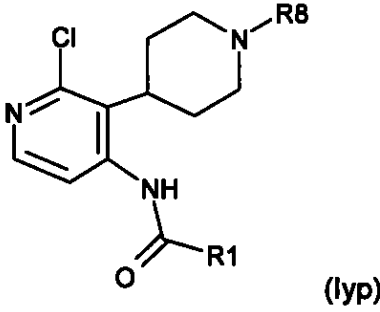
5      cuyos valores de R<sup>8</sup> y R<sup>1</sup> se indican en la Tabla 73.

La Tabla LXXXVIII proporciona los 506 compuestos de Fórmula lyo



cuyos valores de R<sup>8</sup> y R<sup>1</sup> se indican en la Tabla 73

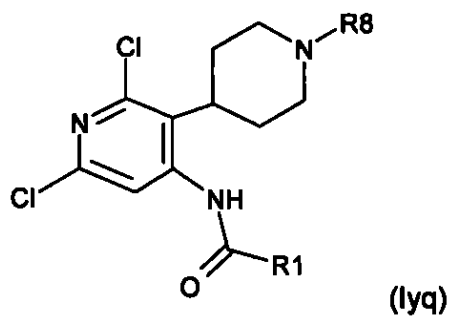
La Tabla LXXXIX proporciona los 506 compuestos de Fórmula lyp



10

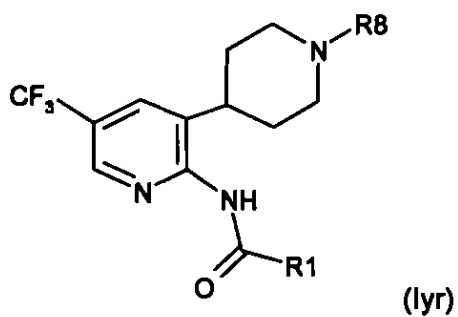
cuyos valores de R<sup>8</sup> y R<sup>1</sup> se indican en la Tabla 73

La Tabla XC proporciona los 506 compuestos de Fórmula lyq



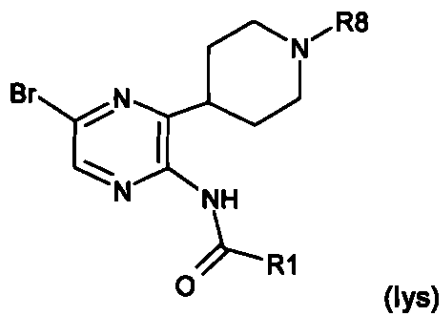
cuyos valores de  $R^8$  y  $R^1$  se indican en la Tabla 73

La Tabla XCI proporciona los 506 compuestos de Fórmula lyr



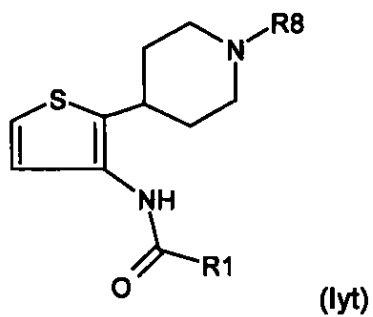
5 cuyos valores de  $R^8$  y  $R^1$  se indican en la Tabla 73.

La Tabla XCII proporciona los 506 compuestos de Fórmula lys



cuyos valores de  $R^8$  y  $R^1$  se indican en la Tabla 73.

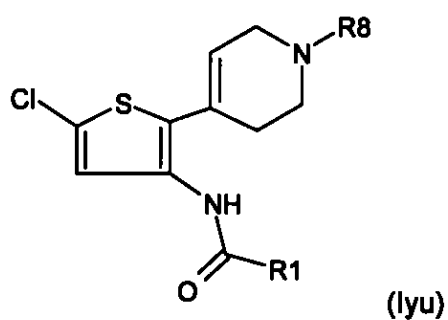
La Tabla XCIII proporciona los 506 compuestos de Fórmula lyt



10

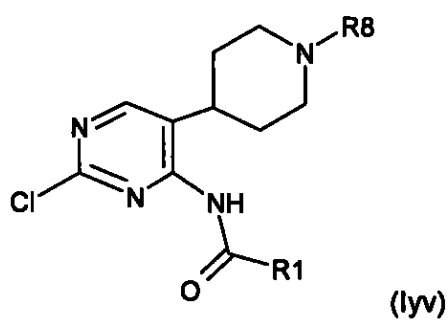
cuyos valores de  $R^8$  y  $R^1$  se indican en la Tabla 73

La Tabla XCIV proporciona los 506 compuestos de Fórmula lyu



cuyos valores de  $R^8$  y  $R^1$  se indican en la Tabla 73

La Tabla XCV proporciona los 506 compuestos de Fórmula Iyv

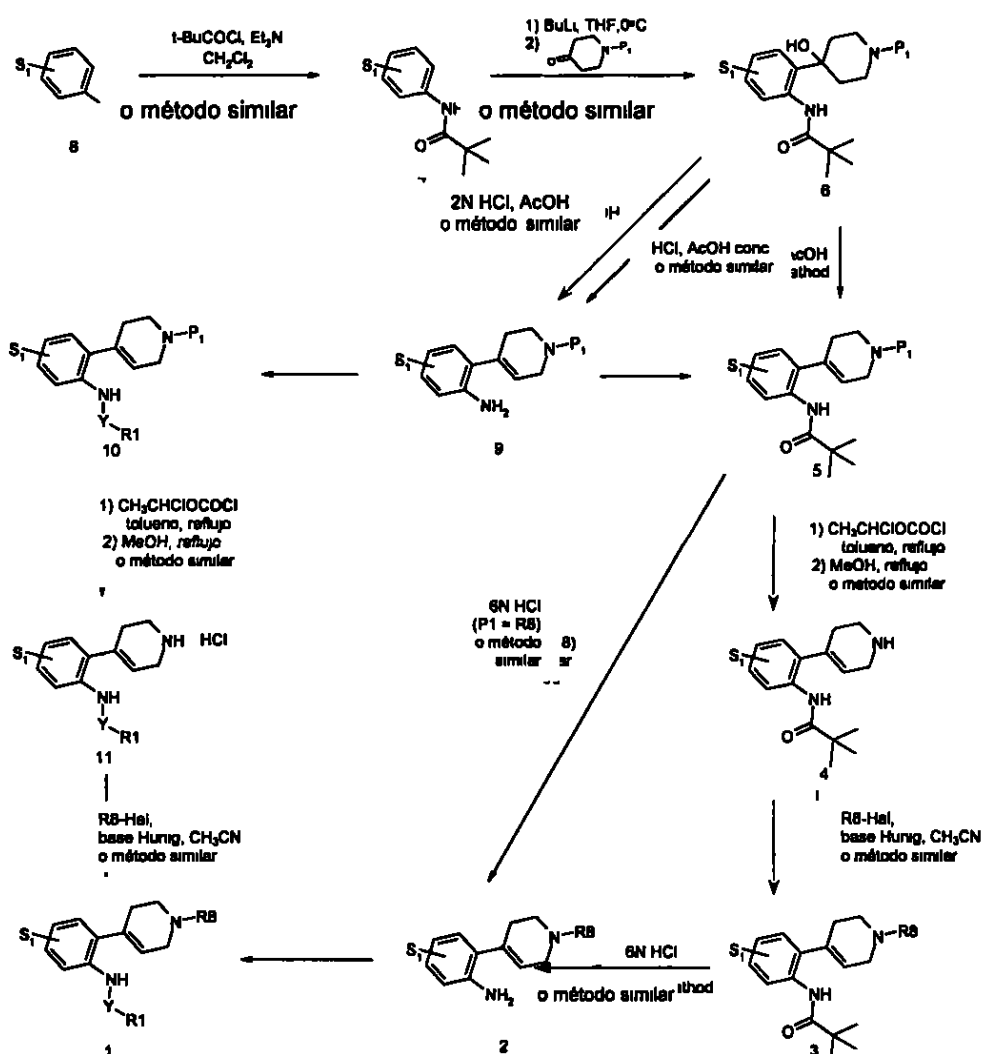


5 cuyos valores de  $R^8$  y  $R^1$  se indican en la Tabla 73.

Los compuestos de la invención pueden producirse con diversos métodos

Por ejemplo los compuestos de tetrahidropiridilo de la Fórmula General I pueden prepararse de acuerdo con las reacciones del Esquema 1 .

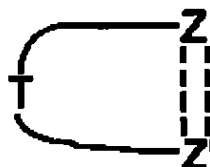
Esquema 1



**P<sub>1</sub> es R<sup>6</sup> o es un grupo protector adecuado, por ejemplo un grupo tal como BOC, bencilo**

o alquilo y  $S_1$  es el grupo  $(R^4)_n$

La ruta sintética ilustrada en el Esquema 1 también puede utilizarse para la preparación de algunos compuestos de Fórmula I donde el anillo



**es un anillo heteroaromático de cinco o seis miembros en lugar del grupo fenilo**

En consecuencia, un compuesto de Fórmula I puede obtenerse a partir de un compuesto de Fórmula 2 por reacción con una especie electrofílica adecuada. Los compuestos de Fórmula I donde Y es un grupo carbonilo pueden obtenerse por la reacción de compuestos de Fórmula 2 con un derivado de ácido carboxílico de fórmula  $R^1-C(O)-Z'$  donde  $Z'$  es cloruro, hidroxilo, alcoxilo o

aciloxi a una temperatura entre 0°C y 150°C opcionalmente en un solvente orgánico tal como diclorometano, cloroformo o 1,2-dicloroetano, opcionalmente en presencia de una amina terciaria básica tal como trietilamina o diisopropiletilamina y opcionalmente en presencia de un agente de acoplamiento tal como diciclohexilcarbodiimida. Los compuestos de Fórmula I donde Y es un grupo carbonilo y R<sup>1</sup> es un sustituyente amino de fórmula R'-NH- pueden obtenerse por la reacción de compuestos de Fórmula 2 con un isocianato de fórmula R'-N=C=O en condiciones similares. Los compuestos de Fórmula I donde Y es un grupo de fórmula S(O)<sub>m</sub> pueden obtenerse de compuestos de Fórmula 2 por tratamiento con compuestos de fórmula R<sup>1</sup>-S(O)<sub>m</sub>-Cl en condiciones similares. Los compuestos de Fórmula I donde Y es un grupo tiocarbonilo y R<sup>1</sup> es un sustituyente amino de fórmula R'-NH- pueden obtenerse por la reacción de compuestos de Fórmula 2 con un isotiocianato de fórmula R'-N=C=S en condiciones similares.

Alternativamente se pueden obtener los compuestos de Fórmula I, donde Y es un grupo tiocarbonilo y R<sup>1</sup> es un sustituyente carbono, por tratamiento de compuestos de Fórmula I donde Y es un grupo carbonilo y R<sup>1</sup> es un sustituyente carbono con un agente tionador adecuado tal como un reactivo de Lawesson.

En los procedimientos anteriores, los derivados ácidos de la fórmula R<sup>1</sup>-C(O)-Z', los isocianatos de fórmula R'-N=C=O, los isotiocianatos de fórmula R'-N=C=S y los electrófilos de azufre de fórmula R<sup>1</sup>-S(O)<sub>m</sub>-Cl son compuestos conocidos o bien pueden obtenerse a partir de compuestos conocidos con métodos conocidos por cualquier persona capacitada en el arte.

Los compuestos de Fórmula 2 pueden prepararse a partir de compuestos de Fórmula 3 por disociación del enlace amida, de acuerdo con métodos conocidos por cualquier persona capacitada en el arte.

Alternativamente los compuestos de Fórmula 2 pueden prepararse a partir de compuestos de Fórmula 5 donde P<sub>1</sub> es R<sup>8</sup> por disociación del enlace amida, de acuerdo con métodos conocidos por cualquier persona capacitada en el arte.

Los compuestos de Fórmula 3 puede obtenerse a partir de compuestos de Fórmula 4 por reacción con un agente alquilador de la fórmula R<sup>8</sup>-L, donde L es cloruro, bromuro, yoduro o un sulfonato (p. ej. mesilato o tosilato) o un grupo de partida similar a una temperatura entre temperatura ambiente y 100°C, generalmente 65°C, en un solvente orgánico tal como

diclorometano, cloroformo o 1,2-dicloroetano en presencia de una amina terciaria básica tal como trietilamina o diisopropiletilamina y opcionalmente catalizarse con sales de haluro tales como yoduro de sodio, yoduro de potasio o yoduro de tetrabutilamonio. Alternativamente, se puede hacer reaccionar un compuesto de Fórmula 4 con un aldehído de la fórmula  $R^8\text{-CHO}$  a una temperatura entre temperatura ambiente y  $100^\circ\text{C}$  en un solvente orgánico tal como tetrahidrofurano o etanol o mezclas de solventes en presencia de un agente reductor tal como un complejo borano-pindina, borohidruro de sodio, (triacetoxi)borohidruro de sodio, cianoborohidruro de sodio o similares, para producir un compuesto de Fórmula 3 donde  $R^8$  es  $\text{CH}_2\text{-R}$

Los compuestos de Fórmula 4 pueden prepararse a partir de compuestos de Fórmula 5 donde  $P_1$  es bencilo o alquilo mediante una reacción de dealquilación, de acuerdo con métodos conocidos por cualquier persona capacitada en el arte. Los compuestos de Fórmula 4 pueden prepararse a partir de compuestos de Fórmula 5 donde  $P_1$  es BOC por tratamiento con un ácido tal como  $\text{CF}_3\text{COOH}$ , de acuerdo con métodos conocidos por cualquier persona capacitada en el arte

Alternativamente, los compuestos de Fórmula 4 pueden obtenerse por la reacción de compuestos de Fórmula 6 donde  $P_1$  es BOC por tratamiento con  $\text{HCl}$  o  $\text{H}_2\text{SO}_4$  en  $\text{AcOH}$  a una temperatura entre  $0^\circ\text{C}$  y  $150^\circ\text{C}$  opcionalmente en un solvente orgánico inerte

Los compuestos de Fórmula 5 pueden prepararse a partir de compuestos de Fórmula 6 donde  $P_1$  es bencilo o alquilo mediante una reacción de eliminación de  $\text{H}_2\text{O}$ , de acuerdo con métodos conocidos por cualquier persona capacitada en el arte. Lo más conveniente es el tratamiento de un compuesto de Fórmula 6 con  $\text{HCl}$  o  $\text{H}_2\text{SO}_4$  conc. en  $\text{AcOH}$  a una temperatura entre  $0^\circ\text{C}$  y  $150^\circ\text{C}$

Alternativamente, los compuestos de Fórmula 5 pueden prepararse a partir de compuestos de Fórmula 6 por tratamiento con  $\text{SOCl}_2$ , de acuerdo con métodos conocidos por cualquier persona capacitada en el arte

Alternativamente, los compuestos de Fórmula 5 pueden obtenerse por la reacción de compuestos de Fórmula 9 con un derivado de ácido carboxílico de fórmula  $t\text{-Bu-C(O)-Z}''$  donde  $Z''$  es cloruro, hidroxilo, alcoxi o aciloxi a una temperatura entre  $0^\circ\text{C}$  y  $150^\circ\text{C}$  opcionalmente en un solvente orgánico inerte

Los compuestos de Fórmula 6 pueden prepararse a partir de compuestos de Fórmula 7 por tratamiento de compuestos litiados de Fórmula 7 con una pipendinona a una temperatura entre  $-100^{\circ}\text{C}$  y  $0^{\circ}\text{C}$  opcionalmente en un solvente orgánico inerte, de acuerdo con métodos conocidos por cualquier persona capacitada en el arte.

5 Los compuestos de Fórmula 7 y de Fórmula 8 son conocidos o pueden prepararse a partir de compuestos conocidos mediante métodos conocidos

Alternativamente los compuestos de Fórmula 1 pueden obtenerse por alquilación de compuestos de Fórmula 11 como se describió anteriormente para los compuestos de Fórmula 3

10 Los compuestos de Fórmula 11 pueden prepararse a partir de compuestos de Fórmula 10 donde  $P_1$  es bencilo o alquilo mediante una reacción de dealquilación, de acuerdo con métodos conocidos por cualquier persona capacitada en el arte.

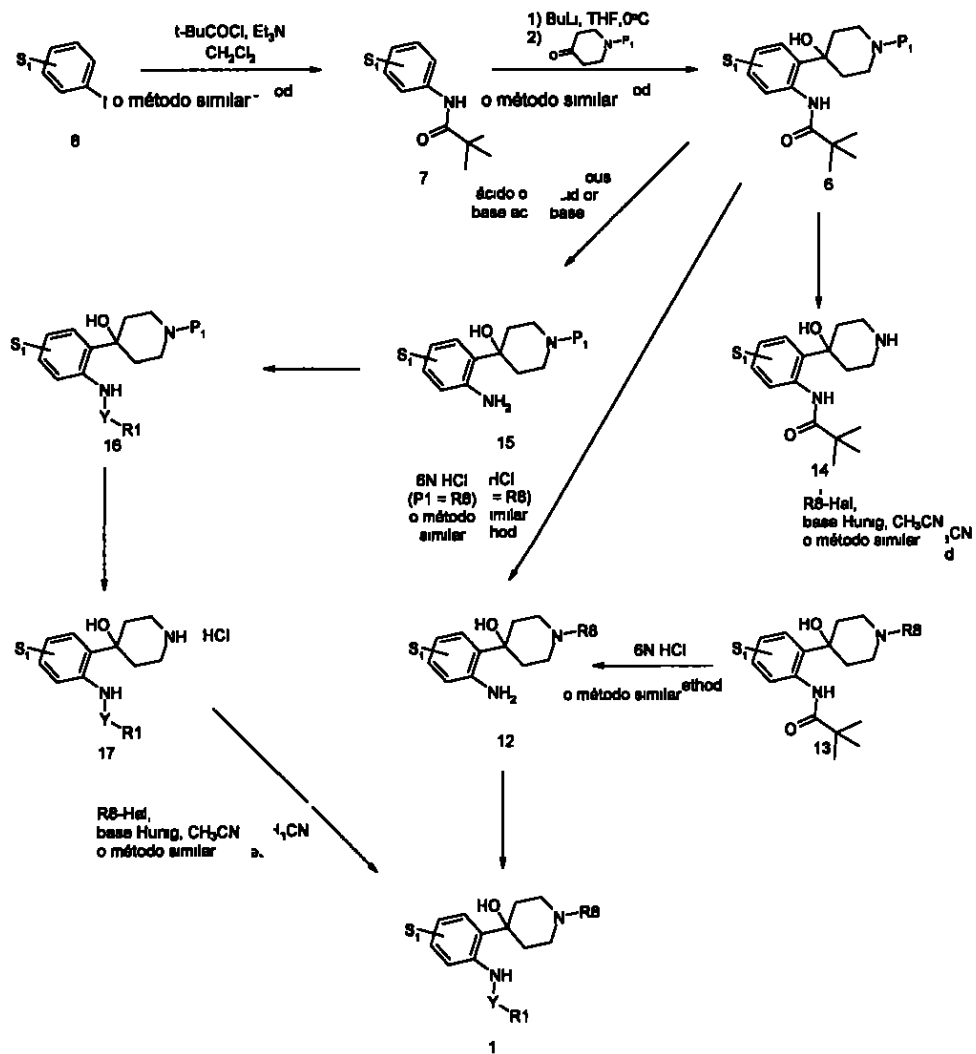
15 Los compuestos de Fórmula 10 pueden prepararse a partir de compuestos de Fórmula 9 por los métodos descritos anteriormente para la conversión de los compuestos de Fórmula 2 a compuestos de Fórmula 1.

Los compuestos de Fórmula 9 pueden prepararse a partir de compuestos de Fórmula 6 mediante una reacción de eliminación de  $\text{H}_2\text{O}$ , de acuerdo con métodos conocidos por cualquier persona capacitada en el arte. Lo más conveniente es el tratamiento de un compuesto de Fórmula 6 con  $\text{HCl}$  o  $\text{H}_2\text{SO}_4$  acuoso en  $\text{AcOH}$  a una temperatura entre  $0^{\circ}\text{C}$  y  $150^{\circ}\text{C}$  o con una base en  $\text{H}_2\text{O}$  y un solvente apropiado.

Ciertos compuestos de Fórmula 2, Fórmula 3, Fórmula 4, Fórmula 5, Fórmula 6, Fórmula 9, Fórmula 10 y Fórmula 11 son novedosos y como tales forman otro aspecto adicional de la invención.

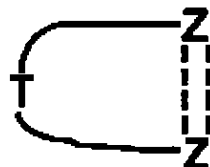
25 Los compuestos de 4-hidroxi-pipendinilo de la Fórmula General 1 pueden prepararse de acuerdo con las reacciones del Esquema 2 usando metodologías sintéticas conocidas por cualquier persona capacitada en el arte y como se describió anteriormente

Esquema 2



$P_1$  es  $R^8$  o es un grupo protector adecuado por ejemplo un grupo tal como BOC, bencilo o alquilo y  $S_1$  es el grupo  $(R^4)_n$

La ruta sintética ilustrada en el Esquema 2 también puede utilizarse para la preparación de algunos compuestos de Fórmula I donde el anillo

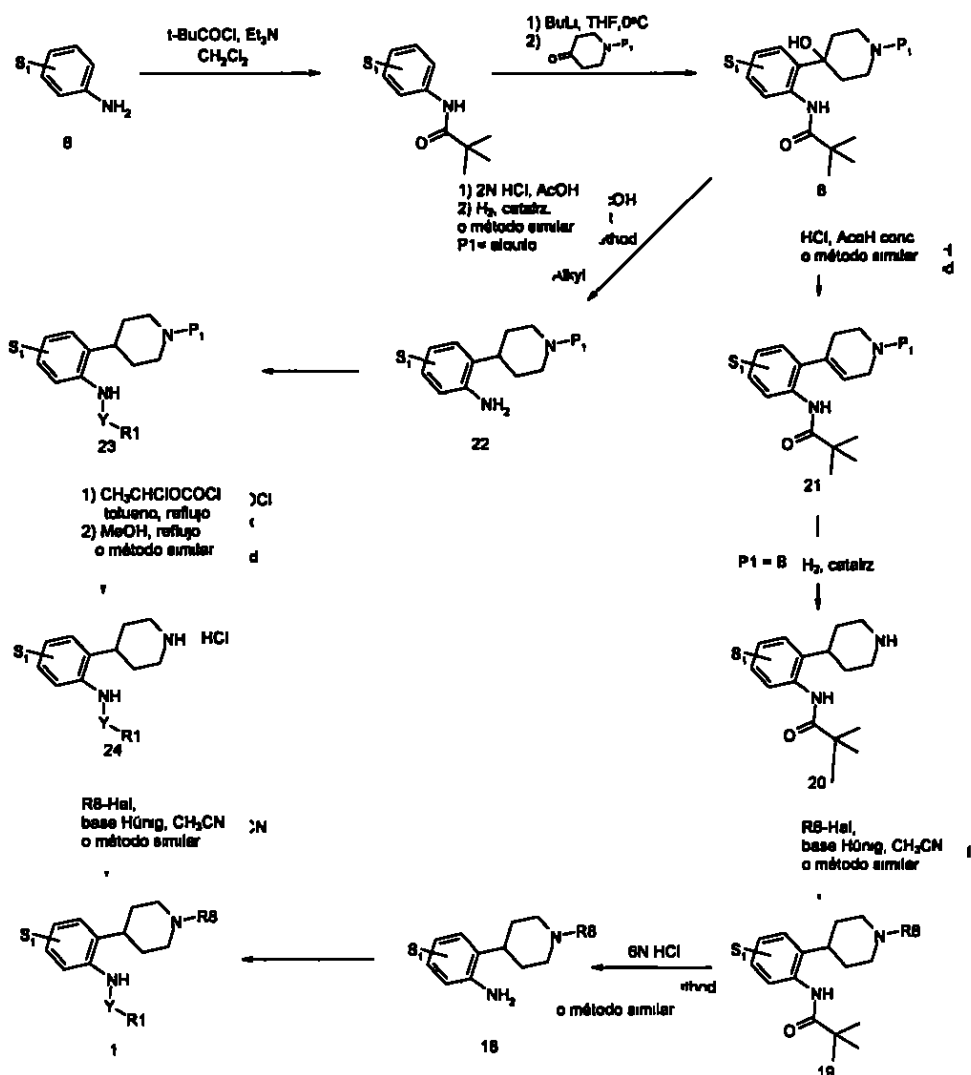


es un anillo heteroaromático de cinco o seis miembros en lugar del grupo fenilo

Ciertos compuestos de Fórmula 12, Fórmula 13, Fórmula 14, Fórmula 15, Fórmula 16, y Fórmula 17 son novedosos y como tales forman otro aspecto adicional de la invención

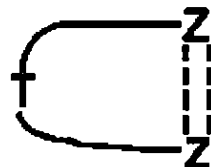
Los compuestos de piperidinilo de la Fórmula General 1 pueden prepararse de acuerdo con las reacciones del Esquema 3 usando metodologías sintéticas conocidas por cualquier persona capacitada en el arte y como se describió anteriormente.

**Esquema 3**



$P_1$  es  $R^8$  o es un grupo protector adecuado por ejemplo un grupo tal como BOC, bencilo o alquilo y  $S_1$  es el grupo  $(R^4)_n$

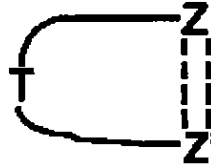
La ruta sintética ilustrada en el Esquema 3 también puede utilizarse para la preparación de algunos compuestos de Fórmula I donde el anillo



es un anillo heteroaromático de cinco o seis miembros en lugar del grupo fenilo

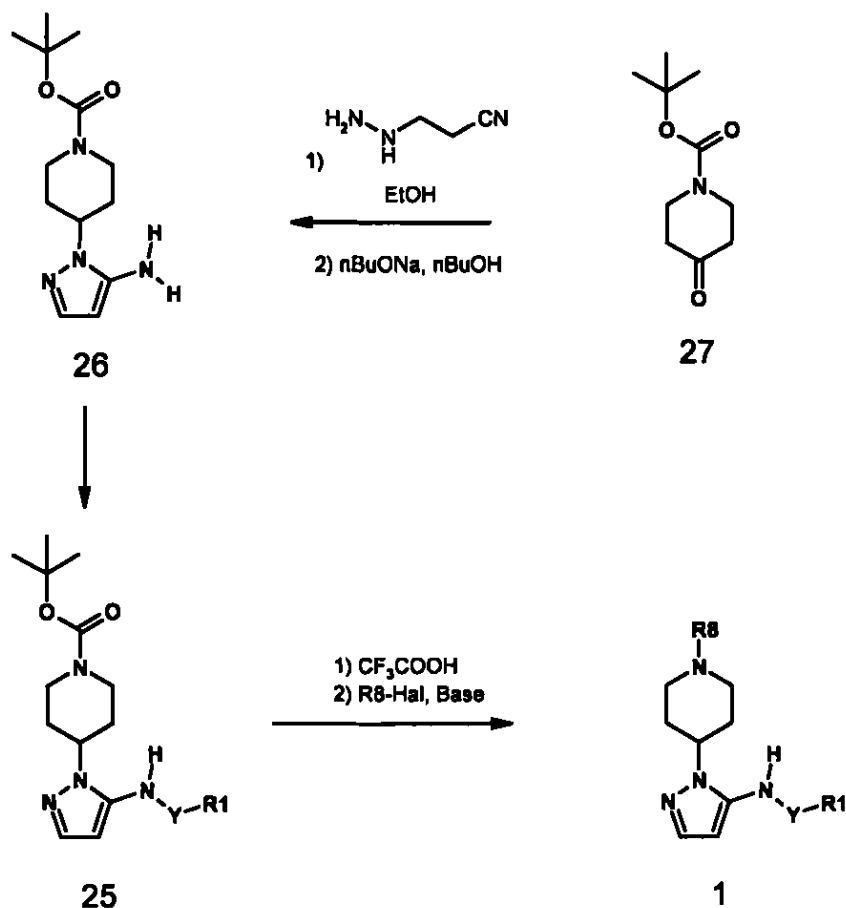
Ciertos compuestos de Fórmula 18, Fórmula 19, Fórmula 20, Fórmula 21, Fórmula 22, Fórmula 23 y Fórmula 24 son novedosos y como tales forman otro aspecto adicional de la invención

Los compuestos donde el anillo



es un anillo heteroaromático de cinco o seis miembros en lugar del grupo fenilo, pueden prepararse por las rutas sintéticas ilustradas en los Esquemas 1 a 3 o muchas otras rutas y métodos conocidos por cualquiera capacitado en el arte. Por ejemplo, los derivados de 2H-pirazol-3-ilo pueden prepararse como se ilustra en el Esquema 4

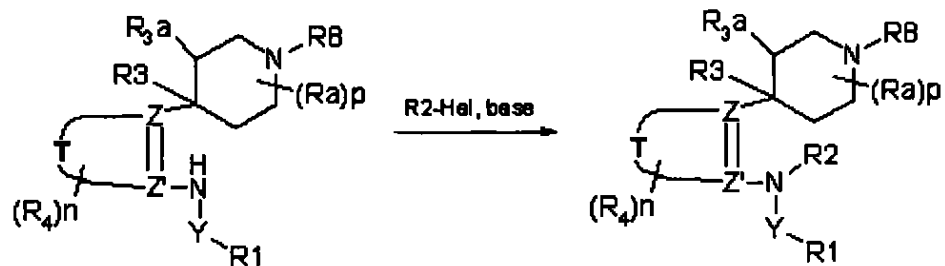
Esquema 4



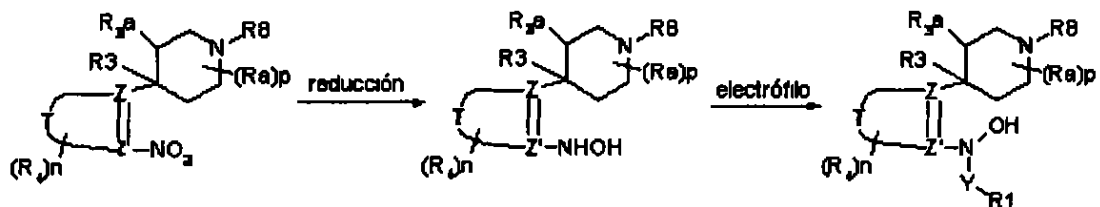
Ciertos compuestos de Fórmula 25 son novedosos y como tales forman otro aspecto adicional de la invención.

La persona capacitada observará fácilmente que se puede convertir un compuesto de Fórmula I donde  $R^2$  es H o un intermediario de los Esquemas 1 a 4 a otros compuestos de Fórmula I o intermediarios de los mismos. Ejemplos de tales transformaciones aparecen en los Esquemas 5, 6 y 7 donde los grupos R tienen los significados definidos para un compuesto de la anterior Fórmula I.

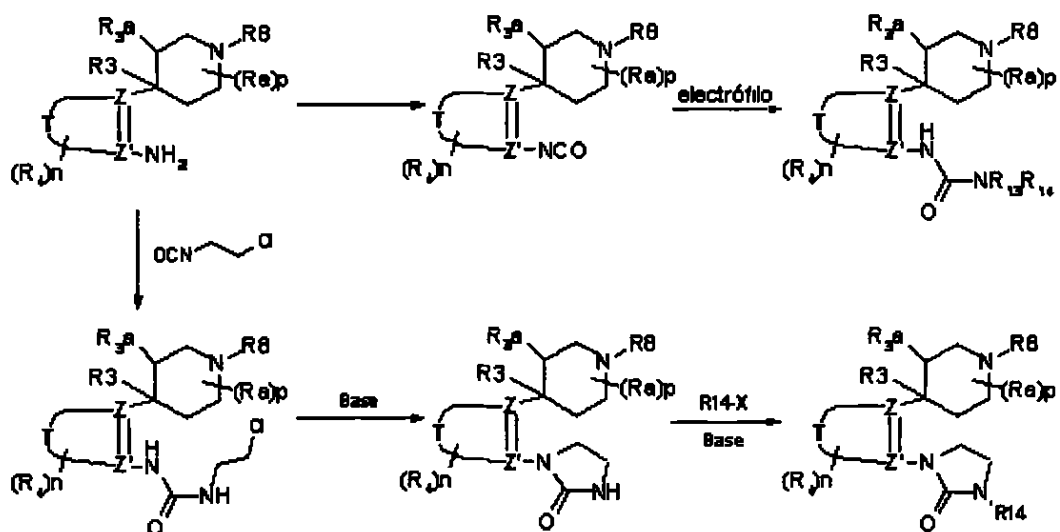
Esquema 5



Esquema 6



Esquema 7

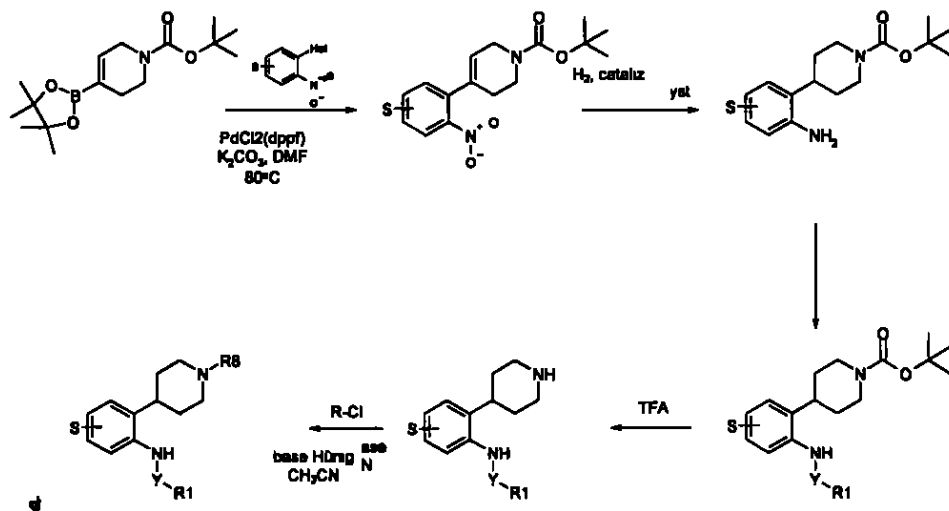


Alternativamente los derivados de piperidinil-anilina de la Fórmula General 1 pueden prepararse de acuerdo con las reacciones de los Esquemas 8 a 13 donde S es el grupo  $(R^4)_n$ .

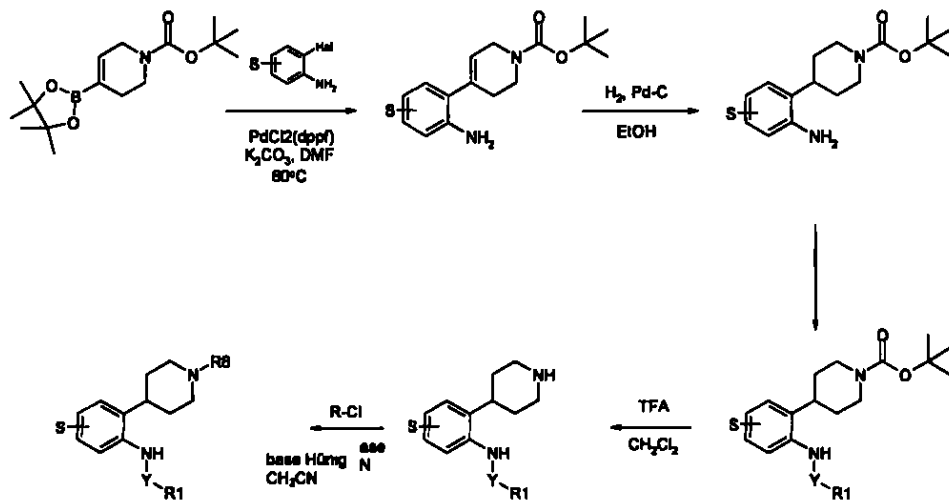
usando metodologías sintéticas conocidas por cualquier persona capacitada en el arte y como se describió anteriormente

Un paso clave en estas rutas sintéticas es una reacción de acoplamiento Suzuki para preparar derivados de tetrahidropiridin-4-il-anilina. También pueden aplicarse otras reacciones de acoplamiento cruzado, tales como los acoplamientos Stille y Negishi. Los reactivos de boronato pueden prepararse como se describe en la literatura; por ejemplo P R Eastwood, THL 41, 3705 (2000). Ejemplos de reacciones de acoplamiento se indican en los Ejemplos 21-23 que describen la síntesis de los compuestos de las Tablas EJ23.1 – EJ23.11

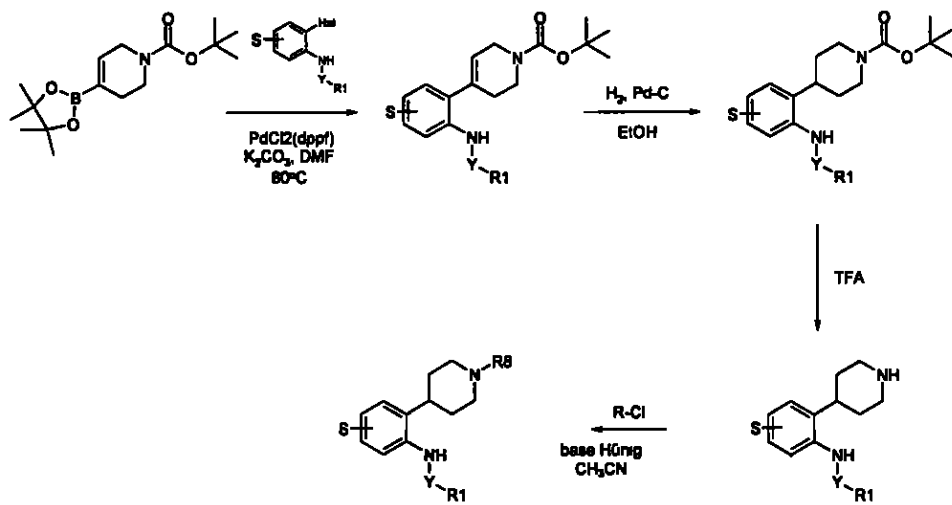
Esquema 8



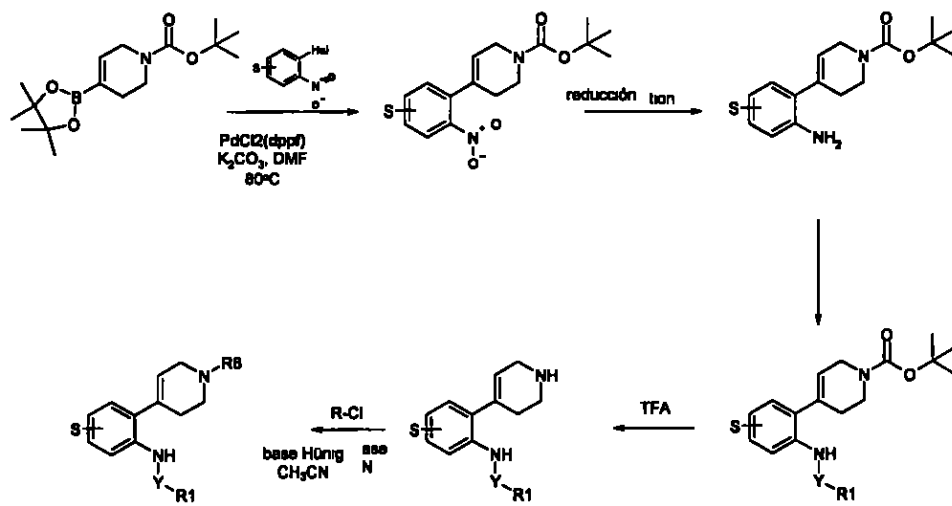
Esquema 9



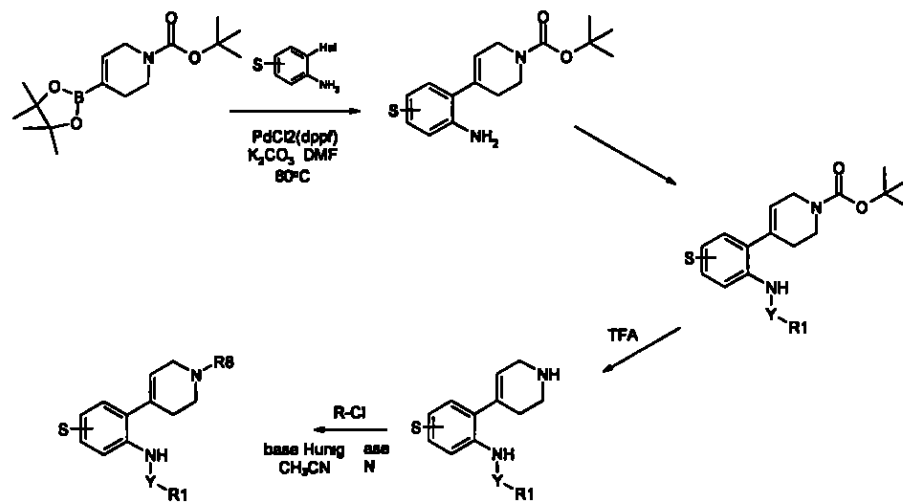
Esquema 10.



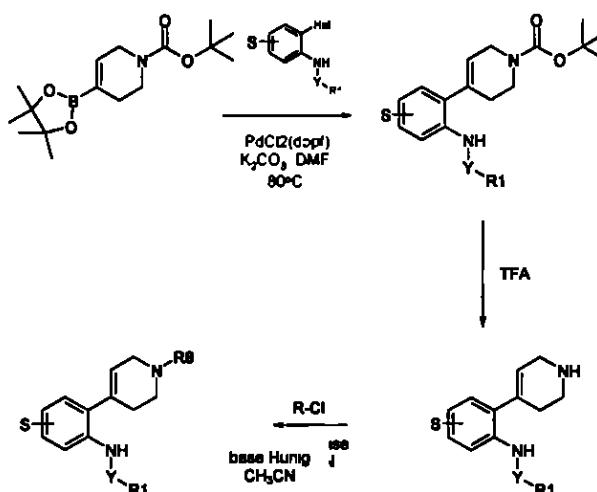
Esquema 11



Esquema 12

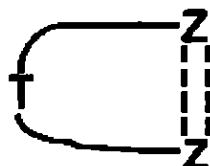


Esquema 13



En lugar del grupo BOC se pueden usar otros grupos protectores adecuados

Las rutas sintéticas ilustradas en los Esquemas 8 a 13 también pueden utilizarse para la preparación de compuestos de Fórmula I donde el anillo



es un anillo heteroaromático de cinco o seis miembros en lugar del grupo fenilo

Los compuestos de Fórmula (I) se pueden utilizar para combatir y controlar infestaciones de plagas de insectos tales como Lepidoptera, Diptera, Hemiptera, Thysanoptera, Orthoptera, Dictyoptera, Coleoptera, Siphonaptera, Hymenoptera e Isoptera y también otras plagas de invertebrados como, por ejemplo, plagas de ácaros, nematodos y moluscos. Los insectos, ácaros, nematodos y moluscos se llamarán de aquí en más genéricamente como plagas. Las plagas que pueden combatirse y controlarse con el uso de los compuestos de la invención incluyen aquellas plagas asociadas a la agricultura (término que incluye el desarrollo de cultivos para productos alimenticios y de fibra), horticultura y ganadería, animales domésticos, silvicultura y almacenamiento de productos de origen vegetal (tales como fruta, grano y madera); aquellas plagas que producen daño a estructuras fabricadas por el hombre y la transmisión de enfermedades del hombre y de animales y también plagas molestas (como las moscas).

Ejemplos de especies que resultan plagas y que pueden controlarse con los compuestos de Fórmula (I) incluyen. *Myzus persicae* (pulgones), *Aphis gossypii* (pulgones), *Aphis fabae* (pulgones), *Lygus spp.* (chinche), *Dysdercus spp.* (chinche manchadora), *Nilaparvata lugens*

(langosta marrón), *Nephotettix inciticeps* (saltahojas), *Nezara* spp (chinche verde), *Euschistus* spp. (chinche), *Leptocorisa* spp. (chinche del arroz), *Frankliniella occidentalis* (trips californiano), *Thrips* spp (trips), *Leptinotarsa decemlineata* (escarabajo de la patata de Colorado), *Anthonomus grandis* (picudo del algodón), *Aonidiella* spp. (cochinillas), *Tnaleurodes* spp (mosca blanca), *Bemisia tabaci* (mosca blanca del algodón), *Ostrinia nubilalis* (taladro europeo del maíz), *Spodoptera littoralis* (rosquilla negra), *Heliothis virescens* (gusano cogollero), *Helicoverpa armigera* (oruga del algodón), *Helicoverpa zea* (gusano del grano), *Sylepta derogata* (enrollador de la hoja de algodón), *Pieris brassicae* (mariposa blanca), *Plutella xylostella* (polilla de crucíferas), *Agrotis* spp (agrotis), *Chilo suppressalis* (barrenador del arroz), *Locusta migratoria* (langosta), *Chortiocetes terminifera* (langosta), *Diabrotica* spp (diabroticas), *Panonychus ulmi* (arañita roja europea), *Panonychus citri* (arañita roja), *Tetranychus urticae* (arañuela roja), *Tetranychus cinnabarinus* (araña roja), *Phyllocoptruta oleivora* (ácaro del tostado de los cítricos), *Polyphagotarsonemus latus* (ácaro blanco), *Brevipalpus* spp. (ácaros planos), *Boophilus microplus* (garrapata del ganado), *Dermacentor variabilis* (garrapata americana canina), *Ctenocephalides felis* (pulga del gato), *Liriomyza* spp (mosca minadora de las hojas), *Musca domestica* (mosca doméstica), *Aedes aegypti* (mosquito de la fiebre amarilla), *Anopheles* spp (mosquitos), *Culex* spp (mosquitos), *Lucilia* spp. (moscarda), *Blattella germanica* (cucaracha), *Periplaneta americana* (cucaracha), *Blatta orientalis* (cucaracha), termitas *Mastotermitidae* (por ejemplo *Mastotermes* spp), *Kalotermitidae* (por ejemplo *Neotermes* spp), *Rhinotermitidae* (por ejemplo *Coptotermes formosanus*, *Reticulitermes flavipes*, *R. speratu*, *R. virginicus*, *R. hesperus*, y *R. santonensis*) y *Termitidae* (por ejemplo *Globitermes sulphureus*), *Solenopsis geminata* (hormiga de fuego), *Monomorium pharaonis* (hormiga faraón), *Damalinea* spp. y *Linognathus* spp. (piojos mordedores y chupadores), *Meloidogyne* spp (nematodos del nudo de la raíz), *Globodera* spp y *Heterodera* spp (nematodos quiste), *Pratylenchus* spp (nematodos de la atrofia), *Rhodopholus* spp. (nematodos barrenadores de la banana), *Tylenchulus* spp (nematodos de los cítricos), *Haemonchus contortus* (nematodo abomasal), *Caenorhabditis elegans* (gusano del vinagre), *Trichostrongylus* spp. (nematodos gastrointestinales) y *Deroceras reticulatum* (babosas)

La invención, por lo tanto, proporciona un método para combatir y controlar insectos, ácaros, nematodos o moluscos que comprende aplicar una cantidad efectiva como insecticida,

acaricida, nematicida o molusquicida de un compuesto de Fórmula (I), o una composición que contiene un compuesto de Fórmula (I), a una plaga, el locus de una plaga, o a una planta, susceptibles de padecer el ataque de una plaga. Los compuestos de Fórmula (I) se usan preferiblemente contra insectos, ácaros o nematodos.

5 El término "planta" tal como se usa en la presente incluye plantines, arbustos y árboles

Para aplicar un compuesto de Fórmula (I) en forma de insecticida, acaricida, nematicida o molusquicida a una plaga, al locus de una plaga, o a una planta susceptibles a padecer el ataque de una plaga, un compuesto de Fórmula (I) generalmente se formula como composición que incluye, además del compuesto de Fórmula (I), un diluyente o vehículo inerte adecuado y, opcionalmente, un agente tensio-activo (SFA). Los SFA son químicos capaces de modificar las propiedades de una interfase (por ejemplo, interfases líquido/sólido, líquido/gaseoso o líquido/líquido) con disminución de la tensión interfases y produciendo con ello cambios en otras propiedades (por ejemplo, dispersión, emulsión e hidratación). Se prefiere que todas las composiciones (formulaciones tanto sólidas como líquidas) comprendan 0,0001 a 95%, más preferiblemente 1 a 85%, por ejemplo 5 a 60%, en peso, de un compuesto de Fórmula (I). En general la composición se usa para el control de plagas de manera tal que un compuesto de Fórmula (I) se aplica en una proporción desde 0,1 g a 10 kg por hectárea, preferiblemente desde 1 g a 6 kg por hectárea, más preferiblemente desde 1 g a 1 kg por hectárea.

20 Cuando se usan para proteger semillas, los compuestos de Fórmula (I) se usan en una proporción de 0,0001 g a 10 g (por ejemplo 0,001 g o 0,05 g), preferiblemente 0,005 g a 10 g, más preferiblemente 0,005 g a 4 g, por kilogramo de semillas.

En otro aspecto, la presente invención proporciona una composición insecticida, acaricida, nematicida o molusquicida que comprende una cantidad efectiva como insecticida, acaricida, nematicida o molusquicida de un compuesto de Fórmula (I) y un vehículo o diluyente adecuado para el mismo. La composición es preferiblemente una composición insecticida, acaricida, nematicida o molusquicida.

25 En otro aspecto adicional, la invención proporciona un método para combatir y controlar plagas en un locus que comprende tratar las plagas o los locus de las plagas con una cantidad efectiva como insecticida, acaricida, nematicida o molusquicida de una composición que

comprende un compuesto de Fórmula (I). Los compuestos de Fórmula (I) se usan preferiblemente contra insectos, ácaros o nematodos.

Las composiciones pueden elegirse entre una serie de tipos de formulación, incluyendo polvos para esparcir (DP), polvos solubles (SP), gránulos solubles en agua (SG), gránulos dispersables en agua (WG), polvos hidratables (WP), gránulos (GR) (liberación lenta o rápida), concentrados solubles (SL), líquidos miscibles en aceite (OL), líquidos de volumen ultra bajo (UL), concentrados emulsionables (EC), concentrados dispersables (DC), emulsiones (tanto aceite en agua (EW) como agua en aceite (EO)), micro-emulsiones (ME), concentrados en suspensión (SC), aerosoles, formulaciones para nebulizar/ahumar, suspensiones en cápsulas (CS) y formulaciones para tratamiento de semillas. El tipo de formulación elegido en cada caso dependerá del propósito a cumplir en particular y de las propiedades físicas, químicas y biológicas del compuesto de Fórmula (I).

Los polvos para esparcir (DP) pueden prepararse mezclando un compuesto de Fórmula (I) con uno o más diluyentes sólidos (por ejemplo arcillas naturales, caolín, pirofilita, bentonita, alúmina, montmorillonita, kieselguhr, tiza, tierra de diatomeas, fosfatos de calcio, carbonatos de calcio y magnesio, azufre, cal, harinas, talco y otros vehículos sólidos orgánicos e inorgánicos) y moliendo mecánicamente la mezcla hasta lograr un polvo fino.

Los polvos solubles (SP) pueden prepararse mezclando un compuesto de Fórmula (I) con una o más sales inorgánicas solubles en agua (tales como bicarbonato de sodio, carbonato de sodio o sulfato de magnesio) o uno o más sólidos orgánicos solubles en agua (tales como un polisacárido) y, opcionalmente, uno o más agentes hidratantes, uno o más agentes dispersantes o una mezcla de dichos agentes para mejorar la dispersión/solubilidad en agua. La mezcla entonces se muele hasta lograr un polvo fino. Composiciones similares también pueden granularse para formar gránulos solubles en agua (SG).

Los polvos hidratables (WP) pueden prepararse mezclando un compuesto de Fórmula (I) con uno o más diluyentes o vehículos sólidos, uno o más agentes hidratantes y, preferiblemente, uno o más agentes dispersantes y, opcionalmente, uno o más agentes de suspensión para facilitar la dispersión en líquidos. La mezcla entonces se muele hasta lograr un polvo fino. Composiciones similares también pueden granularse para formar gránulos dispersables en agua (WG).

Los gránulos (GR) pueden obtenerse ya sea granulando una mezcla de un compuesto de Fórmula (I) y uno o más diluyentes o vehículos sólidos en polvo, o a partir de gránulos huecos pre-formados absorbiendo un compuesto de Fórmula (I) (o una solución del mismo, en un agente adecuado) en un material poroso granular (tal como pómez, arcillas de atapulgita, tierra de batán, kieselguhr, tierras de diatomeas o mazorcas de maíz molidas) o adsorbiendo un compuesto de Fórmula (I) (o una solución del mismo, en un agente adecuado) en un material de núcleo duro (tal como arenas, silicatos y carbonatos, sulfatos o fosfatos minerales) y secando si es necesario. Los agentes que comúnmente se usan para ayudar la absorción o adsorción incluyen solventes (tales como solventes de petróleo alifáticos y aromáticos, alcoholes, éteres, cetonas y ésteres) y agentes aglutinantes (tales como polivinil acetatos, polivinil alcoholes, dextrinas, azúcares y aceites vegetales). También se pueden incluir uno o más de otros aditivos en gránulos (por ejemplo un agente emulsionante, un agente hidratante o un agente dispersante).

Los concentrados dispersables (DC) pueden prepararse disolviendo un compuesto de Fórmula (I) en agua o en un solvente orgánico, tal como una cetona, un alcohol o un glicol éter. Estas soluciones pueden contener un agente tensio-activo (por ejemplo para mejorar la dilución en agua o para impedir la cristalización en un tanque de pulverización).

Los concentrados emulsionables (EC) o emulsiones aceite en agua (EW) pueden prepararse disolviendo un compuesto de Fórmula (I) en un solvente orgánico (opcionalmente con uno o más agentes hidratantes, uno o más agentes emulsionantes o una mezcla de dichos agentes). Los solventes orgánicos adecuados para usar en EC incluyen hidrocarburos aromáticos (tales como alquilbencenos o alquilnaftalenos, por ejemplo SOLVESSO 100, SOLVESSO 150 y SOLVESSO 200; SOLVESSO es Marca Registrada), cetonas (tales como ciclohexanona o metilciclohexanona) y alcoholes (tales como bencil alcohol, furfural alcohol o butanol), N-alquilpirrolidonas (tales como N-metilpirrolidona o N-octilpirrolidona), dimetil amidas de ácidos grasos (tales como una dimetilamida de ácido graso  $C_8$ - $C_{10}$ ) e hidrocarburos clorados. Un producto EC puede emulsionar espontáneamente si se agrega a agua, para producir una emulsión con suficiente estabilidad para permitir la aplicación del spray mediante equipo apropiado. La preparación de una EW requiere obtener un compuesto de Fórmula (I) ya sea como líquido (si no es un líquido a temperatura ambiente, se lo puede derretir a una

temperatura razonable, generalmente inferior a 70°C) o solución (disolviéndolo en un solvente apropiado) y entonces emulsionando el líquido o solución resultante en agua que contiene uno o más SFA, bajo alto corte, para producir una emulsión. Los solventes adecuados para usar en EW incluyen aceites vegetales, hidrocarburos clorados (tales como clorobenzenos), solventes aromáticos (tales como alquilbenzenos o alquilnaftalenos) y otros solventes orgánicos adecuados de baja solubilidad en agua.

Las microemulsiones (ME) pueden prepararse mezclando agua con una mezcla de uno o más solventes con uno o más SFA, para producir espontáneamente una formulación líquida isotrópica termodinámicamente adecuada. Un compuesto de Fórmula (I) está inicialmente presente ya sea en el agua o en la mezcla solvente/SFA. Solventes adecuados para usar en ME incluyen aquellos descritos hasta aquí para el uso en EC o en EW. Una ME puede ser un sistema aceite en agua o bien agua en aceite (se puede determinar qué sistema se halla presente con mediciones de conductividad) y puede resultar adecuado para mezclar pesticidas solubles en agua o solubles en aceite en la misma formulación. Una ME es adecuada para dilución en agua, ya sea permaneciendo como microemulsión o formando una emulsión convencional aceite en agua.

Los concentrados en suspensión (SC) pueden comprender suspensiones acuosas o no acuosas de partículas sólidas insolubles finamente divididas de un compuesto de Fórmula (I). Los SC pueden prepararse moliendo con bola o perlas el compuesto sólido de Fórmula (I) en un medio adecuado, opcionalmente con uno o más agentes dispersantes, para producir una suspensión de partículas finas del compuesto. Se pueden incluir uno o más agentes hidratantes en la composición y se puede incluir un agente de suspensión para reducir la proporción en que decantan las partículas. Alternativamente, un compuesto de Fórmula (I) puede molerse en seco y agregarse a agua, que contiene agentes de los ya nombrados hasta aquí, para producir el producto final deseado.

Las formulaciones en aerosol comprenden un compuesto de Fórmula (I) y un propelente adecuado (por ejemplo n-butano). Un compuesto de Fórmula (I) también puede disolverse o dispersarse en un medio adecuado (por ejemplo agua o un líquido miscible en agua, tal como n-propanol) para obtener composiciones para utilizar en bombas de pulverización manuales no presurizadas.

Un compuesto de Fórmula (I) puede mezclarse en estado seco con una mezcla pirotécnica para formar una composición adecuada para generar, en un espacio cerrado, un humo que contiene el compuesto

Las suspensiones en cápsulas (CS) pueden prepararse de manera similar a la preparación de las formulaciones EW pero con una etapa adicional de polimerización de modo que se obtiene una dispersión acuosa de gotas de aceite en la que cada gota de aceite es encapsulada en una cubierta polimérica y contiene un compuesto de Fórmula (I) y, opcionalmente, un vehículo o diluyente para el mismo. La cubierta polimérica puede producirse con una reacción de policondensación interfacial o con un procedimiento de coacervación. Las composiciones pueden asegurar la liberación controlada del compuesto de Fórmula (I) y pueden emplearse en el tratamiento de semillas. Un compuesto de Fórmula (I) también puede formularse en una matriz polimérica biodegradable para conseguir una liberación lenta y controlada del compuesto

Una composición puede incluir uno o más aditivos para mejorar la acción biológica de la composición (por ejemplo mejorando la hidratación, retención o distribución en las superficies, la resistencia a la lluvia en las superficies tratadas, o la absorción o movilidad de un compuesto de Fórmula (I)). Tales aditivos incluyen agentes tensio-activos, aditivos en spray a base de aceites, por ejemplo ciertos aceites minerales o aceites vegetales naturales (tales como aceite de soja y de colza), y mezclas de estos con otros adyuvantes bio-potenciadores (ingredientes que pueden ayudar o modificar la acción de un compuesto de Fórmula (I)).

Un compuesto de Fórmula (I) también puede formularse para su empleo en el tratamiento de semillas, por ejemplo como composición en polvo, incluyendo un polvo para tratamiento en seco de semillas (DS), un polvo soluble en agua (SS) o un polvo dispersable en agua para una suspensión de tratamiento (WS), o como composición líquida, incluyendo un concentrado fluido (FS), una solución (LS) o una suspensión en cápsulas (CS). La preparación de las composiciones DS, SS, WS, FS y LS es muy similar a la de las composiciones DP, SP, WP, SC y DC, respectivamente, descritas más arriba. Las composiciones para el tratamiento de semillas pueden incluir un agente para facilitar la adhesión de la composición a la semilla (por ejemplo un aceite mineral o una barrera formadora de película).

Los agentes hidratantes, los agentes dispersantes y los agentes emulsionantes pueden ser SFA de superficie del tipo catiónico, aniónico, anfotérico o no iónico

SFA adecuados de tipo catiónico incluyen compuestos de amonio cuaternario (por ejemplo bromuro de cetiltrimetil amonio), imidazolinas y sales de amina

SFA adecuados de tipo aniónico incluyen sales de metal alcalino de ácidos grasos, sales de monoésteres alifáticos de ácido sulfúrico (por ejemplo lauril sulfato de sodio), sales de compuestos aromáticos sulfonados (por ejemplo dodecibencensulfonato de sodio, dodecibencensulfonato de calcio, sulfonato de butilnaftaleno y mezclas de di-isopropil- y tri-isopropil-naftalen sulfonatos de sodio), éter sulfatos, alcohol éter sulfatos (por ejemplo laureth-3-sulfato de sodio), éter carboxilatos (por ejemplo laureth-3-carboxilato de sodio), ésteres de fosfato (productos de la reacción entre uno o más alcoholes grasos y ácido fosfórico (sobre todo mono-ésteres) o pentóxido de fósforo (sobre todo di-ésteres, por ejemplo la reacción entre lauril alcohol y ácido tetrafosfórico, adicionalmente estos productos pueden etoxilarse), sulfosuccinamatos, sulfonatos de parafina o de olefina, tauratos y lignosulfonatos

SFA adecuados de tipo anfotérico incluyen betáinas, propionatos y glicinatos

SFA adecuados de tipo no iónico incluyen productos de condensación de óxidos de alquileo, tales como óxido de etileno, óxido de propileno, óxido de butileno o mezclas de los mismos, con alcoholes grasos (tales como oleil alcohol o cetil alcohol) o con alquifenoles (tales como octilfenol, nonilfenol u octilcresol); ésteres parciales derivados de ácidos grasos de cadena larga o anhídridos de hexitol, productos de condensación de dichos ésteres parciales con óxido de etileno, polímeros de bloque (que comprenden óxido de etileno y óxido de propileno); alcanolamidas, ésteres simples (por ejemplo polietilén glicol ésteres de ácido graso); óxidos de amina (por ejemplo óxido de lauril dimetil amina); y lecitinas

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

Un compuesto de Fórmula (I) puede aplicarse mediante cualquiera de los medios conocidos para aplicar compuestos pesticidas. Por ejemplo, pueden aplicarse, formulados o sin formular, a la plaga o al locus de la plaga (tal como el hábitat de una plaga, o una planta en desarrollo propensa a la infestación de plagas) o a cualquier parte de la planta, incluyendo

follaje, tallos, ramas o raíces, a la semilla antes de sembrarla o a otros medios en los que se cultivan plantas o se van a plantar (tal como la tierra alrededor de las raíces, tierra en general, agua de arrozal o sistemas de cultivo hidropónico), de manera directa o pueden pulverizarse por encima, espolvorearse, aplicarse por inmersión, aplicarse como una formulación en crema o pasta, aplicarse como vapor o aplicarse por distribución o incorporación de una composición (tal como una composición granular o una composición empacada en una bolsa soluble en agua) en tierra o en un ambiente acuoso.

Un compuesto de Fórmula (I) también puede inyectarse en las plantas o pulverizarse sobre la vegetación usando técnicas de pulverización electrodinámica u otros métodos de bajo volumen o aplicarse con sistemas de irrigación terrestres o aéreos

Las composiciones para emplear como preparaciones acuosas (soluciones o dispersiones acuosas) se presentan en general en forma de un concentrado que contiene una alta proporción del ingrediente activo, el concentrado se agrega al agua antes de su uso. Estos concentrados, que pueden ser del tipo DC, SC, EC, EW, ME SG, SP, WP, WG y CS, a menudo deben soportar el almacenamiento durante periodos prolongados y, después de ese tiempo, estar en condiciones de sufrir la adición de agua para formar preparaciones acuosas que permanezcan homogéneas durante un tiempo suficiente para permitir su aplicación con equipo de pulverización convencional. Dichas preparaciones acuosas pueden contener diversas cantidades de un compuesto de Fórmula (I) (por ejemplo 0,0001 a 10%, en peso) según el destino que se les va a dar.

Un compuesto de Fórmula (I) puede usarse mezclado con fertilizantes (por ejemplo fertilizantes con contenido de nitrógeno, potasio o fósforo). Tipos de formulación adecuados incluyen gránulos de fertilizante. Las mezclas preferiblemente contienen hasta un 25% en peso del compuesto de Fórmula (I)

La invención, por lo tanto, también proporciona una composición fertilizante que comprende un fertilizante y un compuesto de Fórmula (I)

Las composiciones de esta invención pueden contener otros compuestos que posean actividad biológica, por ejemplo micronutrientes o compuestos que tengan actividad funguicida o que posean actividad herbicida, insecticida, nematocida o acaricida, reguladora del crecimiento vegetal

El compuesto de Fórmula (I) puede ser el único ingrediente activo de la composición o puede mezclarse con uno o más ingredientes activos adicionales tales como un plaguicida, funguicida, sinergista, herbicida o regulador del crecimiento vegetal cuando corresponda. Un ingrediente activo adicional puede proporcionar una composición con un espectro más amplio de actividad o una persistencia mayor en un locus; sinergizar la actividad o complementar la actividad (por ejemplo aumentar la velocidad del efecto o superar la repelencia) del compuesto de Fórmula (I), o ayudar a vencer o impedir el desarrollo de la resistencia a los componentes individuales. El ingrediente activo adicional en particular dependerá del destino que se le quiera dar a la composición. Ejemplos de pesticidas adecuados incluyen los siguientes:

a) Piretroides, tales como permetrina, cipermetrina, fenvalerato, esfenvalerato, deltametrina, cihalotrina (en particular lambda-cihalotrina), bifentrina, fenpropatrina, ciflutrina, teflutrina, piretroides a prueba de peces (por ejemplo etofenprox), piretrina natural, tetrametrina, s-bioaletrina, fenflutrina, praletrina o 5-bencil-3-furilmetil-(E)-(1R,3S)-2,2-dimetil-3-(2-oxotiolan-3-ildenmetil)ciclopropan carboxilato,

b) Organofosfatos, tales como profenofós, sulprofós, acefato, metil paratión, azinfos-metilo, demeton-s-metilo, heptenofós, tiometón, fenamifós, monocrotofós, profenofós, triazofós, metamidofós, dimetoato, fosfamidón, malatión, clorpirifós, fosalone, terbufós, fensulfotión, fonofós, forato, foxim, pirimifos-metilo, pirimifos-etilo, fenitrotión, fostiazato o diazinón,

c) Carbamatos (incluyendo aril carbamatos), tales como pirimicarb, tnazamato, cloetocarb, carbofurán, furatiocarb, etiofencarb, aldicarb, tiofurox, carbosulfán, bendiocarb, fenobucarb, propoxur, metomilo u oxamilo,

d) Ureas de benzoilo, tales como diflubenzurón, triflumurón, hexaflumurón, flufenoxurón o clorfluazurón,

e) Compuestos orgánicos de estaño, tales como cihexatina, óxido de fenbutatina o azociclotina,

f) Pirazoles, tales como tebufenpirad y fenpiroximato,

g) Macrólidos, tales como avermectinas o milbemecinas, por ejemplo abamectina, benzoato de emamectina, ivermectina, milbemecina, spinosad o azadiractina,

h) Hormonas o feromonas;

i) Compuestos organoclorados tales como endosulfán, hexacloruro de benceno, DDT, clordano o dieldrina,

j) Amidinas, tales como clordimeformo o amitraz;

k) Agentes fumigantes, tales como cloropicrina, dicloropropano, metil bromuro o metam,

l) Compuestos de cloronicotilo tales como imidacloprid, tiacloprid, acetamiprid, nitenpiram o tiametoxam;

m) Diacilhidrazinas, tales como tebufenozida, cromafenozida o metoxifenozida,

n) Difenil éteres, tales como diofenolán o pirproxifeno;

o) Indoxacarb,

p) Clorfenapir, o

q) Pimetrozina

Además de las grandes clases químicas de pesticidas enumeradas anteriormente, en la composición se pueden emplear otros pesticidas que tengan objetivos específicos, si corresponde de acuerdo al destino que se le quiera dar a la composición. Por ejemplo, se pueden emplear insecticidas selectivos para cultivos particulares, por ejemplo insecticidas específicos para taladros del tallo (tales como cartap) o insecticidas específicos para langosta (tales como buprofezin) en el caso del arroz. Alternativamente, se pueden incluir en las composiciones ciertos insecticidas o acaricidas específicos para determinadas especies o estadios de insectos (por ejemplo ovo-larvicidas para ácaros, tales como clofentezina, flubenzimina, hexitiazox o tetradifón, motilicidas para ácaros, tales como dicofol o propargita, acaricidas, tales como bromopropilato o clorobencilato, o reguladores del crecimiento, tales como hidrametilón, ciromazina, metopreno, clorfluazurón o dflubenzurón).

Ejemplos de compuestos funguicidas que pueden incluirse en la composición de la invención son (E)-N-metil-2-[2-(2,5-dimetilfenoximetil)fenil]-2-metoxi-iminoacetamida (SSF-129), 4-bromo-2-ciano-N,N-dimetil-6-trifluorometilbenzimidazol-1-sulfonamida,  $\alpha$ -[N-(3-cloro-2,6-xilil)-2-metoxiacetamido]- $\gamma$ -butirolactona, 4-cloro-2-ciano-N,N-dimetil-5-p-tolilimidazol-1-sulfonamida (IKF-916, ciamidazosulfamid), 3-5-dicloro-N-(3-cloro-1-etil-1-metil-2-oxopropil)-4-metilbenzamida (RH-7281, zoxamida), N-alil-4,5-dimetil-2-trimetilsililtiofeno-3-carboxamida (MON65500), N-(1-ciano-1,2-dimetilpropil)-2-(2,4-diclorofenoxi)propionamida (AC382042), N-(2-metoxi-5-piridil)-

ciclopropan carboxamida, acibenzolar (CGA245704), alanicarb, aldimorf, anilazina, azaconazol, azoxistrobina, benalaxilo, benomilo, biloxazol, bitertanol, blasticidina S, bromuconazol, bupirinato, captafol, captan, carbendazim, carbendazim clorhidrato, carboxin, carpropamid, carvona, CGA41396, CGA41397, quinometionato, clorotalonil, clorozolinato, clozilacón, compuestos que contienen cobre tales como oxiclورو de cobre, oxiquinolato de cobre, sulfato de cobre, talato de cobre y mezcla Bordeaux, cimoxanil, ciproconazol, ciprodinil, debacarb, 1,1'-dióxido de di-2-piridil disulfuro, diclofluanid, diclomezina, dicloran, dietofencarb, difenoconazol, difenzoquat, diflumetonm, O,O-di-iso-propil-S-bencil tiofosfato, dimefluazol, dimetconazol, dimetomorf, dimetirimol, diniconazol, dinocap, ditianón, cloruro de dodecil dimetil amonio, dodemorf, dodina, doguadina, edifenfós, epoxiconazol, etirimol, etil(Z)-N-bencil-N([metil(metil-tioetilidenaminoxicarbonil)amino]tio)-β-alaninato, etridiazol, famoxadona, fenamidona (RPA407213), fenarimol, fenbuconazol, fenfuram, fenhexamid (KBR2738), fenpiclonil, fenpropidin, fenpropimorf, fentin acetato, fentin hidróxido, ferbam, ferimzona, fluazinam, fludioxonil, flumetover, fluoroimida, fluquinconazol, flusilazol, flutolanil, flutriafol, folpet, fubendazol, furalaxilo, furametpir, guazatina, hexaconazol, hidroxixoxazol, himexazol, imazalil, imibenconazol, iminoctadina, iminoctadina triacetato, ipconazol, iprobenfós, iprodiona, iprovalicarb (SZX0722), isopropanil butil carbamato, isoprotilano, kasugamicina, kresoxim-metilo, LY186054, LY211795, LY248908, mancozeb, maneb, mefenoxam, mepanipirim, mepronil, metalaxilo, metconazol, metiram, metiram-zinc, metominostrobin, miclobutanil, neoasozin, dimetilditio-carbamato de níquel, nitrotaI-isopropilo, nuanmol, ofurace, compuestos de organomercurio, oxadixilo, oxasulfurón, ácido oxolínico, oxpoconazol, oxicarboxin, pefurazoato, penconazol, pencicurón, óxido de fenazina, fosetil-Al, ácidos de fósforo, ftalida, picoxistrobina (ZA1963), polioxina D, poliram, probenazol, procloraz, procimidona, propamocarb, propiconazol, propineb, ácido propiónico, pirazofós, pinfenox, pirimetanil, piroquilón, piroxifur, pirrolnitrina, compuestos de amonio cuaternario, quinometionato, quinoxifén, quintoceno, sipconazol (F-155), pentaclorofenato de sodio, espiroxamina, estreptomycin, azufre, tebuconazol, tecloftalam, tecnaceno, tetraconazol, tiabendazol, trifluzamid, 2-(tiocianometiltio)benzotiazol, tiofanato-metilo, tiram, timibenconazol, tolclofos-metilo, toliifluanid, triadimefón, triadimenol, triazbutilo, triazóxido, trinciclazol, tridemorf, trifloxistrobina (CGA279202), triforina, triflumizol, triticonazol, validamicina A, vapam, vinclozolin, zineb y ziram

Los compuestos de Fórmula (I) pueden mezclarse con tierra, turba u otro medio para enraizamiento para la protección de plantas contra enfermedades de la semilla, de la tierra o de las hojas, producidas por hongos

Ejemplos de sinergistas adecuados para usar en las composiciones incluyen piperonil butóxido, sesamex, safroxán y dodecil imidazol.

Los herbicidas y reguladores del crecimiento vegetal adecuados para su inclusión en las composiciones dependerán del destino que se les quiera dar y del efecto que se pretenda obtener

Un ejemplo de un herbicida selectivo para arroz que se puede incluir es propanilo Un ejemplo de un regulador del crecimiento vegetal para usar en algodón es PIX™

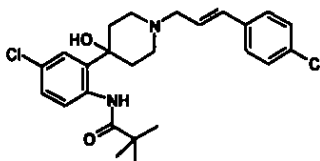
Algunas mezclas pueden comprender ingredientes activos que tengan propiedades físicas, químicas o biológicas tan significativamente diferentes que no se presten fácilmente al mismo tipo de formulación convencional. En estas circunstancias se pueden preparar otros tipos de formulación. Por ejemplo, cuando el ingrediente activo es un sólido insoluble en agua y el otro es un líquido insoluble en agua, se puede, sin embargo, dispersar cada ingrediente activo en la misma fase acuosa continua dispersando el ingrediente activo sólido como una suspensión (usando una preparación análoga a la de un SC) pero dispersando el ingrediente activo líquido como una emulsión (usando una preparación análoga a la de una EW) La composición resultante es una formulación en forma de suspoemulsión (SE)

La invención se ilustra con los siguientes Ejemplos.

Los datos de espectros de masa se obtuvieron para compuestos seleccionados de los siguientes Ejemplos usando LCMS LC5 254nm - gradiente 10% A a 100% B A=H<sub>2</sub>O+0,01%HCOOH B=CH<sub>3</sub>CN/CH<sub>3</sub>OH+0,01%HCOOH electro pulverización positiva 150-1000 m/z

#### Ejemplo 1

Este ejemplo ilustra la preparación de N-(4-cloro-2-{1-[(E)-3-(4-cloro-fenil)-alil]-4-hidroxi-piperidin-4-il}-fenil)-2,2-dimetil-propionamida



#### Paso A: Preparación de N-(4-cloro-fenil)-2,2-dimetil-propionamida

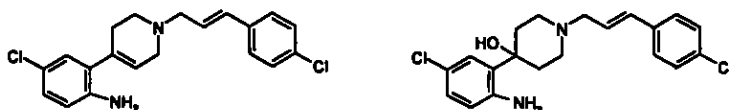
A una solución de 4-cloroanilina (25,51 g) y trietilamina (69,73 ml) en cloroformo (350 ml) se agregó 2,2-dimetil-propionil cloruro (25,32 g) en un periodo de 30 minutos. La solución resultante se agitó a t.a. durante 1 hora, luego se agregó agua y la mezcla se extrajo tres veces con etil acetato. Las capas orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de sodio y se concentraron in vacuo para obtener 35,8 g de producto. P f 149-150°C, tiempo de retención HPLC 2,83 min, MS (ES+) 212 (M+H<sup>+</sup>)

#### Paso B: Preparación de N-(4-cloro-2-{1-[(E)-3-(4-cloro-fenil)-alil]-4-hidroxi-piperidin-4-il}-fenil)-2,2-dimetil-propionamida

Una solución de n-butilitio en hexano (47,0 ml de una solución 1,6 M) se agregó por goteo a una solución de N-(4-cloro-fenil)-2,2-dimetil-propionamida (6,35 g) en THF seco (100 ml) a -5°C bajo una atmósfera de N<sub>2</sub> a lo largo de 15 min. La solución resultante se agitó a 0°C durante 2 horas, y entonces se agregó por goteo una solución de 1-[(E)-3-(4-cloro-fenil)-alil]-piperidin-4-ona (7,49 g) en THF (15 ml) a la solución anterior del dianión a 0°C a lo largo de un periodo de 1 hora. La mezcla de reacción se agitó durante 2 horas a 0°C y luego por 24 horas a t.a. La solución entonces se vertió en agua helada, se tornó ácida con HCl conc. y se extrajo con etil acetato. La capa acuosa se tornó básica y se extrajo tres veces con etil acetato. Las capas orgánicas combinadas se lavaron con agua, se secaron sobre sulfato de sodio y se concentraron in vacuo. El residuo se sometió a cromatografía sobre gel de sílice (hexano etil acetato trietilamina 49:49:2) para obtener el producto del enunciado (6,2 g). P f 177-179°C, tiempo de retención HPLC 2,19 min; MS (ES+) 461 (M+H<sup>+</sup>)

#### Ejemplo 2

Este ejemplo ilustra la preparación de 4-cloro-2-{1-[(E)-3-(4-cloro-fenil)-alil]-1,2,3,6-tetrahidro-piridin-4-il}-fenilamina y 4-(2-amino-5-cloro-fenil)-1-[(E)-3-(4-cloro-fenil)-alil]-piperidin-4-ol

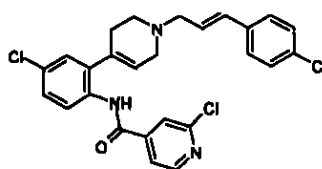


Una suspensión de N-(4-cloro-2-{1-[(E)-3-(4-cloro-fenil)-alil]-4-hidroxi-piperidin-4-il}-fenil)-2,2-dimetil-propionamida (1,00 g) en H<sub>2</sub>SO<sub>4</sub> 3N (7,5 ml) y DMSO (3 ml) se calentó a temperatura de reflujo durante 48 horas. Entonces se agregó agua y la mezcla se extrajo tres veces con

CH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub>, las capas orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de sodio y se concentraron in vacuo. El residuo se sometió a cromatografía sobre gel de sílice (CH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub>:MeOH 95:5) para obtener 4-cloro-2-{1-[(E)-3-(4-cloro-fenil)-alil]-1,2,3,6-tetrahidro-piridin-4-il}-fenilamina (0,205 g, aceite viscoso, tiempo de retención HPLC 2,15 min, MS (ES+) 359 (M+H<sup>+</sup>) y 4-(2-amino-5-cloro-fenil)-1-[(E)-3-(4-cloro-fenil)-alil]-piperidin-4-ol (0,182 g, P.f 168-170°C; tiempo de retención HPLC 1,95 min; MS (ES+) 377 (M+H<sup>+</sup>).

### Ejemplo 3

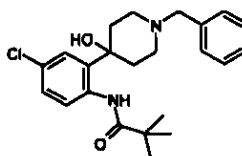
Este ejemplo ilustra la preparación de 2-cloro-N-(4-cloro-2-{1-[(E)-3-(4-cloro-fenil)-alil]-1,2,3,6-tetrahidro-piridin-4-il}-fenil)-isonicotinamida



A una solución de 4-cloro-2-{1-[(E)-3-(4-cloro-fenil)-alil]-1,2,3,6 tetrahidro-piridin-4-il}-fenilamina (60 mg) y trietilamina (0,059 ml) en CH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub> (10 ml) se agregó cloruro de 2-cloro-isonicotinoilo (1,5 equivalentes, como solución 0,2 M en CH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub>) en un periodo de 10 minutos. La solución resultante se agitó a t.a. durante 2 horas, se vertió en solución acuosa saturada de NaHCO<sub>3</sub> y la mezcla se extrajo tres veces con CH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub>. Las capas orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de sodio y se concentraron in vacuo. El residuo se sometió a cromatografía sobre gel de sílice (hexano etil acetato:triethylamina 25:73:2) para obtener el producto del enunciado (28 mg). Aceite viscoso; tiempo de retención HPLC 2,28 min, MS (ES+) 500, 498 (M+H<sup>+</sup>)

### Ejemplo 4

Este ejemplo ilustra la preparación de N-[2-(1-bencil-4-hidroxi-piperidin-4-il)-4-cloro-fenil]-2,2-dimetil-propionamida

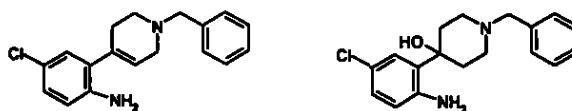


Una solución de n-butililitio en hexano (22,6 ml de una solución que contiene 15% n-butililitio) se agregó por goteo a una solución de N-(4-cloro-fenil)-2,2-dimetil-propionamida (3,00 g) en THF seco (80 ml) a -5°C bajo una atmósfera de N<sub>2</sub> en un periodo de 15 min. La solución

resultante se agitó a 0°C durante 2 horas, y entonces se agregó por goteo una solución de 1-bencil-pipendin-4-ona (2,67) en THF (4,5 ml) a la solución anterior del dianión a 0°C en un periodo de 1 hora. La mezcla de reacción se agitó durante 2 horas a 0°C y luego por 24 horas a t.a. La solución entonces se vertió en agua helada, se tornó ácida con HCl conc y se extrajo con etil acetato. La capa acuosa se tornó básica y se extrajo tres veces con etil acetato. Las capas orgánicas combinadas se lavaron con agua, se secaron sobre sulfato de sodio y se concentraron in vacuo. El residuo se recrystalizó a partir del etil acetato/THF para obtener el producto del enunciado (2,6 g) P f. 252-255°C.

### Ejemplo 5

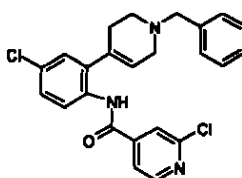
Este ejemplo ilustra la preparación de 2-(1-bencil-1,2,3,6-tetrahidro-piridin-4-il)-4-cloro-fenilamina y 4-(2-amino-5-cloro-fenil)-1-bencil-pipendin-4-ol



Una suspensión de N-[2-(1-bencil-4-hidroxi-piperidin-4-il)-4-cloro-fenil]-2,2-dimetil-propionamida (6,00 g) en n-BuOH (50 ml) y HCl 6N (120 ml) se calentó a temperatura de reflujo durante 5 días. La solución entonces se vertió en agua helada, se tornó ácida con HCl conc y se extrajo con etil acetato. La capa acuosa se tornó básica y se extrajo tres veces con CH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub>, se secó sobre sulfato de sodio y se concentró in vacuo. El residuo se sometió a cromatografía sobre gel de sílice (hexano etil acetato:triethylamina 49:49:2) para obtener 2-(1-bencil-1,2,3,6-tetrahidro-piridin-4-il)-4-cloro-fenilamina (2,11 g, aceite viscoso, tiempo de retención HPLC 1,81 min, MS (ES+) 299 (M+H<sup>+</sup>)) y 4-(2-amino-5-cloro-fenil)-1-bencil-piperidin-4-ol (2,11 g; aceite viscoso, tiempo de retención HPLC 1,58 min, MS (ES+) 317 (M+H<sup>+</sup>)).

### Ejemplo 6

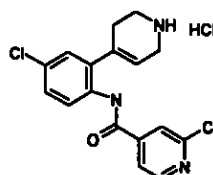
Este ejemplo ilustra la preparación de N-[2-(1-bencil-1,2,3,6-tetrahidro-piridin-4-il)-4-cloro-fenil]-2-cloro-isonicotinamida



A una solución de 2-(1-bencil-1,2,3,6-tetrahidro-piridin-4-il)-4-cloro-fenilamina (500 mg) y trietilamina (0,350 ml) en  $\text{CHCl}_3$  (25 ml) se agregó cloruro de 2-cloro-isonicotinoilo (1,2 equivalentes; como solución 1,0 M en  $\text{CH}_2\text{Cl}_2$ ) en un periodo de 10 minutos. La solución resultante se agitó a t a por 24 horas, se vertió en solución acuosa saturada de  $\text{NaHCO}_3$  y la mezcla se extrajo tres veces con  $\text{CH}_2\text{Cl}_2$ . Las capas orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de sodio y se concentraron in vacuo. El residuo se sometió a cromatografía sobre gel de sílice (hexano:etil acetato:triethylamina 49:49:2) para obtener el producto del enunciado (595 mg). Sólido blanco, tiempo de retención HPLC 1,89 min; MS (ES+) 440, 438 ( $\text{M}+\text{H}^+$ )

### Ejemplo 7

Este ejemplo ilustra la preparación de clorhidrato de 2-cloro-N-[4-cloro-2-(1,2,3,6-tetrahidro-piridin-4-il)-fenil]-isonicotinamida.



Paso A: Preparación de 1-cloro-etil éster de ácido 4-{5-cloro-2-[(2-cloro-piridin-4-carbonil)-amino]fenil}-3,6-dihidro-2H-piridin-1-carboxílico

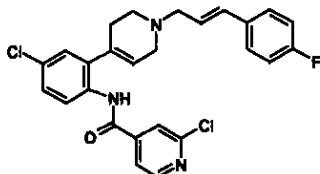
Se agregó 1-cloroetil cloroformiato (2,64 ml) a una suspensión de N-[2-(1-bencil-1,2,3,6-tetrahidro-piridin-4-il)-4-cloro-fenil]-2-cloro-isonicotinamida (530 mg) en tolueno (30 ml). Después de 15 min la solución se calentó a reflujo durante 16 horas, entonces se vertió en solución acuosa saturada de  $\text{NaHCO}_3$  y la mezcla se extrajo tres veces con  $\text{CH}_2\text{Cl}_2$ . Las capas orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de sodio y se concentraron in vacuo para obtener el producto del enunciado en bruto (550 mg).

Paso B: Preparación de clorhidrato de 2-cloro-N-[4-cloro-2-(1,2,3,6-tetrahidro-piridin-4-il)-fenil]-isonicotinamida.

1-cloro-etil éster de ácido 4-{5-cloro-2-[(2-cloro-piridin-4-carbonil)-amino]fenil}-3,6-dihidro-2H-piridin-1-carboxílico en bruto (550 mg) se disolvió en metanol (25 ml) y se calentó hasta reflujo durante 16 horas. La evaporación proporcionó el producto del enunciado en bruto (465 mg). Tiempo de retención HPLC 1,48 min, MS (ES+) 350, 348 ( $\text{M}+\text{H}^+$ )

**Ejemplo 8**

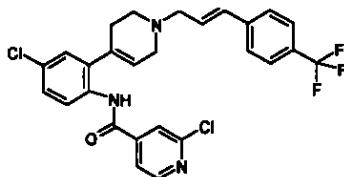
Este ejemplo ilustra la preparación de 2-cloro-N-(4-cloro-2-{1-[(E)-3-(4-fluoro-fenil)-alil]-1,2,3,6-tetrahidro-piridin-4-il}-fenil)-isonicotinamida



Se disolvió clorhidrato de 4-{5-cloro-2-[(2-cloro-piridin-4-carbonil)-amino]-fenil}-1-metil-1,2,3,6-tetrahidro-piridinio en bruto (69 mg; producto obtenido en el Ejemplo 7) en acetonitrilo (5 ml) y se trató con  $K_2CO_3$  (87 mg). Entonces se agregó una solución de 1-[(E)-3-cloro-propenil]-4-fluoro-benceno en acetonitrilo (1,0 ml). Después de agitar durante 3 horas a t.a. y 16 horas a 50°C y calentarse hasta reflujo durante 16 horas la mezcla se filtró y se concentró in vacuo. El residuo se sometió a cromatografía sobre gel de sílice (hexano:etil acetato:tretilamina 74:24:2) para obtener el producto del enunciado (51 mg). Aceite viscoso, tiempo de retención HPLC 2,02 min; MS (ES+) 484, 482 ( $M+H^+$ )

**Ejemplo 9**

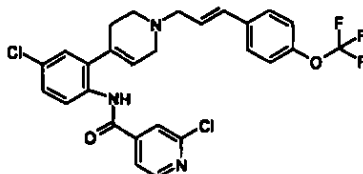
Este ejemplo ilustra la preparación de 2-cloro-N-(4-cloro-2-{1-[(E)-3-(4-trifluorometil-fenil)-alil]-1,2,3,6-tetrahidro-piridin-4-il}-fenil)-isonicotinamida



Se disolvió clorhidrato de 4-{5-cloro-2-[(2-cloro-piridin-4-carbonil)-amino]-fenil}-1-metil-1,2,3,6-tetrahidro-piridinio en bruto (69 mg, producto obtenido en el Ejemplo 7) en acetonitrilo (5 ml) y se trató con base de Hunig (0,068 ml). Entonces se agregó una solución de 1-[(E)-3-cloro-propenil]-4-trifluorometil-benceno (53 mg) en  $CHCl_3$  (1,0 ml). Después de agitar durante 3 horas a t.a. y 16 horas a 50°C y calentarse hasta reflujo durante 16 horas la mezcla se filtró y se concentró in vacuo. El residuo se sometió a cromatografía sobre gel de sílice (hexano:etil acetato:tretilamina 74:24:2) para obtener el producto del enunciado (23 mg). Aceite viscoso; tiempo de retención HPLC 2,02 min; MS (ES+) 534, 532 ( $M+H^+$ )

**Ejemplo 10**

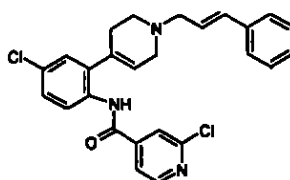
Este ejemplo ilustra la preparación de 2-cloro-N-(4-cloro-2-[1-[(E)-3-(4-trifluorometoxi-fenil)-alil]-1,2,3,6-tetrahidro-piridin-4-il]-fenil)-isonicotinamida



Se disolvió clorhidrato de 4-[5-cloro-2-[(2-cloro-piridin-4-carbonil)-amino]-fenil]-1-metil-1,2,3,6-tetrahidro-piridinio en bruto (69 mg; producto obtenido en el Ejemplo 7) en acetonitrilo (5 ml) y se trató con base de Hunig (0,068 ml). Entonces se agregó una solución de 1-[(E)-3-cloropropenil]-4-trifluorometoxi-benceno (56 mg) en  $\text{CHCl}_3$  (1,0 ml). Después de agitar durante 3 horas a t.a. y 16 horas a  $50^\circ\text{C}$  y calentarse hasta reflujo durante 16 horas la mezcla se filtró y se concentró in vacuo. El residuo se sometió a cromatografía sobre gel de sílice (hexano etil acetato:tretilamina 74:24 2) para obtener el producto del enunciado (46 mg). Aceite viscoso, tiempo de retención HPLC 2,33 min, MS (ES+) 550, 548 ( $\text{M}+\text{H}^+$ ).

**Ejemplo 11**

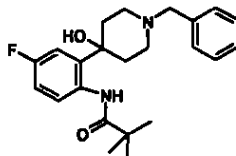
Este ejemplo ilustra la preparación de 2-cloro-N-[4-cloro-2-[1-[(E)-3-fenil-alil]1,2,3,6-tetrahidro-piridin-4-il]-fenil]-isonicotinamida



Se disolvió clorhidrato de 4-[5-cloro-2-[(2-cloro-piridin-4-carbonil)-amino]-fenil]-1-metil-1,2,3,6-tetrahidro-piridinio en bruto (69 mg, producto obtenido en el Ejemplo 7) en acetonitrilo (5 ml) y se trató con base de Hunig (0,068 ml). Entonces se agregó una solución de [(E)-3-cloropropenil]-benceno (32 mg) en  $\text{CHCl}_3$  (1,0 ml). Después de agitar durante 3 horas a t.a. y 16 horas a  $50^\circ\text{C}$  y calentarse hasta reflujo durante 16 horas la mezcla se filtró y se concentró in vacuo. El residuo se sometió a cromatografía sobre gel de sílice (hexano.etil acetato:tretilamina 74:24 2) para obtener el producto del enunciado (36 mg). Aceite viscoso, tiempo de retención HPLC 2,01 min; MS (ES+) 466, 464 ( $\text{M}+\text{H}^+$ ).

**Ejemplo 12**

Este ejemplo ilustra la preparación de N-[2'-(1-bencil-4-hidroxi-piperidin-4-il)-4-fluorofenil]-2,2-dimetil-propionamida

**Paso A: Preparación de N-(4-fluoro-fenil)-2,2-dimetil-propionamida**

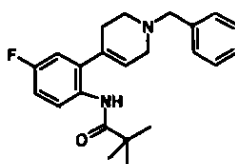
A una solución de 4-fluoroanilina (50,0 g) y trietilamina (157 ml) en CH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub> (700 ml) se agregó 2,2-dimetil-propionil cloruro (58,0 ml) en un periodo de 30 minutos. La solución resultante se agitó a t.a. durante 2 horas, luego se agregó agua y la mezcla se extrajo tres veces con etil acetato. Las capas orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de sodio y se concentraron in vacuo para obtener 86,0 g del compuesto del enunciado. P.f. 124-125°C, tiempo de retención HPLC 2,57 min; MS (ES+) 196 (M+H<sup>+</sup>).

**Paso B Preparación de N-(4-fluoro-2-{1-[(E)-3-(4-cloro-fenil)-alil]-4-hidroxi-piperidin-4-il}-fenil)-2,2-dimetil-propionamida**

Una solución de n-butilitio en hexano (80,0 ml de una solución 1,6 M) se agregó por goteo a una solución de N-(4-fluoro-fenil)-2,2-dimetil-propionamida (10,0 g) en THF seco (200 ml) a -5°C bajo una atmósfera de N<sub>2</sub> en un periodo de 15 min. La solución resultante se agitó a 0°C durante 2 horas, y entonces se agregó por goteo una solución de 1-bencil-piperidin-4-ona (9,20 ml) en THF (20 ml) a la solución anterior del dianión a 0°C en un periodo de 1 hora. La mezcla de reacción se agitó durante 2 horas a 0°C y luego por 24 horas a t.a. La solución entonces se vertió en agua helada, se tornó ácida con HCl conc. y se extrajo con etil acetato. La capa acuosa se tornó básica y se extrajo tres veces con etil acetato. Las capas orgánicas combinadas se lavaron con agua, se secaron sobre sulfato de sodio y se concentraron in vacuo. El residuo se sometió a cromatografía sobre gel de sílice (hexano etil acetato:triethylamina 49:49:2) para obtener el producto del enunciado (8,3 g). P.f. 172-173°C, tiempo de retención HPLC 1,47 min; MS (ES+) 385 (M+H<sup>+</sup>).

**Ejemplo 13**

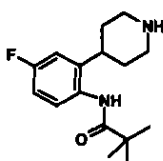
Este ejemplo ilustra la preparación de N-[2-(1-bencil-1,2,3,6-tetrahidro-piridin-4-il)-4-fluorofenil]-2,2-dimetil-propionamida



Una solución de N-(4-fluoro-2-{1-[(E)-3-(4-cloro-fenil)-alil]-4-hidroxi-piperidin-4-il}-fenil)-2,2-dimetil-propionamida (4,00 g) en HCl conc. (2,4 ml) y AcOH conc. (30 ml) se calentó a temperatura de reflujo durante 24 horas. Entonces se agregó agua y la mezcla se extrajo tres veces con CH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub>, las capas orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de sodio y se concentraron in vacuo. El residuo se disolvió en CH<sub>2</sub>Cl<sub>2</sub> (30 ml) y se trató con trietilamina (2,8 ml) y 2,2-dimetil-propionil cloruro (0,61 ml) La solución resultante se agitó a t a durante 2 horas, luego se agregó agua y la mezcla se extrajo tres veces con etil acetato Las capas orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de sodio y se concentraron in vacuo. El residuo se sometió a cromatografía sobre gel de sílice (hexano etil acetato:triethylamina 79 19 2) para obtener el producto del enunciado (3,1 g) Aceite viscoso, tiempo de retención HPLC 2,00 min, MS (ES+) 367 (M+H<sup>+</sup>)

#### Ejemplo 14

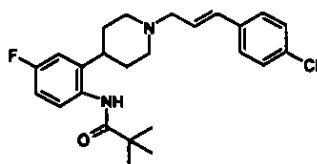
Este ejemplo ilustra la preparación de N-(4-fluoro-2-piperidin-4-il-fenil)-2,2-dimetil-propionamida



Una suspensión de N-[2-(1-bencil-1,2,3,6-tetrahidro-piridin-4-il)-4-fluoro-fenil]-2,2-dimetil-propionamida (500 mg) y Pd/C al 10% (50 mg) en EtOH (50 ml) se agitó en una atmósfera de H<sub>2</sub> durante 16 horas. Entonces, la mezcla se filtró y la solución resultante se concentró in vacuo para obtener el compuesto del enunciado (380 mg) Aceite viscoso; tiempo de retención HPLC 1,61 min, MS (ES+) 279 (M+H<sup>+</sup>)

#### Ejemplo 15

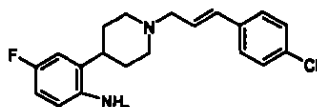
Este ejemplo ilustra la preparación de N-(2-{1-[(E)-3-(4-cloro-fenil)-alil]-piperidin-4-il}-4-fluoro-fenil)-2,2-dimetil-propionamida



Se disolvió N-(4-fluoro-2-piperidin-4-il-fenil)-2,2-dimetil-propionamida (380 mg) en  $\text{CHCl}_3$  (20 ml) y se trató con trietilamina (0,260 mg). Entonces se agregó una solución de 1-((E)-3-cloro-propenil)-4-cloro-benceno (255 mg). Después de agitar durante 16 horas a t a la mezcla se filtró y se concentró in vacuo. El residuo se sometió a cromatografía sobre gel de sílice (hexano etil acetato:triethylamina 74:24:2) para obtener el producto del enunciado (380 mg) P f 174-176°C, tiempo de retención HPLC 2,37 min, MS (ES+) 4,29 ( $\text{M}+\text{H}^+$ ).

#### Ejemplo 16

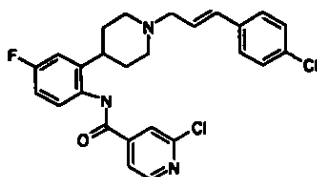
Este ejemplo ilustra la preparación de 2-{1-[(E)-3-(4-cloro-fenil)-alil]-piperidin-4-il}-4-fluoro-fenilamina



Una solución de N-(2-{1-[(E)-3-(4-cloro-fenil)-alil]-piperidin-4-il}-4-fluoro-fenil)-2,2-dimetil-propionamida (315 mg) en HCl 6N (25 ml) y AcOH conc. (25 ml) se calentó a temperatura de reflujo durante 20 horas. Entonces, la solución se tornó básica ( $\text{pH} = 12$ ) con la adición de NaOH sólido, y se extrajo tres veces con  $\text{CH}_2\text{Cl}_2$ . Las capas orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de sodio y se concentraron in vacuo. El residuo se sometió a cromatografía sobre gel de sílice (hexano:etil acetato:triethylamina 79:19:2) para obtener el producto del enunciado (201 mg) P.f 93-94°C, tiempo de retención HPLC 2,18 min, MS (ES+) 345 ( $\text{M}+\text{H}^+$ ).

#### Ejemplo 17

Este ejemplo ilustra la preparación de 2-cloro-N-(2-{1-[(E)-3-(4-cloro-fenil)-alil]-piperidin-4-il}-4-fluoro-fenil)-isonicotinamida



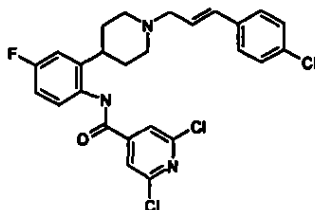
A una solución de 2-{1-[(E)-3-(4-cloro-fenil)-alil]-piperidin-4-il}-4-fluoro-fenilamina (40 mg) y trietilamina (0,025 ml) en  $\text{CHCl}_3$  (10 ml) se le agregó cloruro de 2-cloro-isonicotinoilo (1,2

equivalentes, como solución 1,0 M en  $\text{CH}_2\text{Cl}_2$ ) en un periodo de 10 minutos. La solución resultante se agitó a t.a. por 24 horas, se vertió en solución acuosa saturada de  $\text{NaHCO}_3$  y la mezcla se extrajo tres veces con  $\text{CH}_2\text{Cl}_2$ . Las capas orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de sodio y se concentraron in vacuo. El residuo se sometió a cromatografía sobre gel de sílice (etil acetato:metanol 9:1) para obtener el producto del enunciado (43 mg). Sólido blanco, tiempo de retención HPLC 2,36 min, MS (ES+) 486, 484 ( $\text{M}+\text{H}^+$ )

De acuerdo con este método se prepararon los siguientes compuestos comenzando a partir de 2-{1-[(E)-3-(4-cloro-fenil)-alil]-piperidin-4-il}-4-fluoro-fenilamina

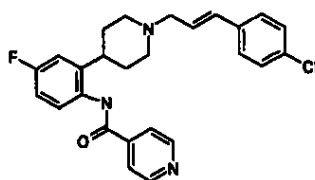
- 2,6-dicloro-N-(2-{1-[(E)-3-(4-cloro-fenil)-alil]-piperidin-4-il}-4-fluoro-fenil)-isonicotinamida

Sólido blanco; tiempo de retención HPLC 2,67 min; MS (ES+) 520, 518 ( $\text{M}+\text{H}^+$ ).



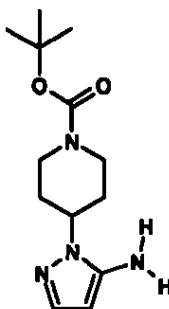
- N-(2-{1-[(E)-3-(4-cloro-fenil)-alil]-piperidin-4-il}-4-fluoro-fenil)-isonicotinamida

Sólido blanco; tiempo de retención HPLC 2,07 min, MS (ES+) 450 ( $\text{M}+\text{H}^+$ ).



### Ejemplo 18

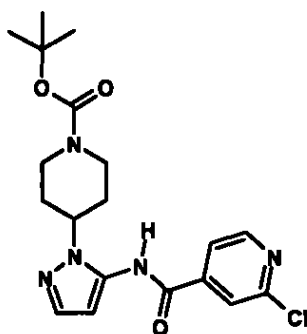
Este ejemplo ilustra la preparación de tert-butil éster de ácido 4-(5-amino-pirazol-1-il)-piperidin-1-carboxílico



Una solución de 2-cianoetil hidrazina (5,1 g) en etanol absoluto (20 ml) se agregó por goteo a una solución de N-BOC-piperidona (12 g) en etanol absoluto a temperatura ambiente. La solución resultante se agitó a temperatura ambiente durante 1 hora, entonces el solvente se eliminó in vacuo. El aceite resultante se agregó entonces a una solución de butóxido de sodio (preparado a partir de 2,8 g de sodio y 60 ml de n-butanol) y la mezcla de reacción se llevó a reflujo durante 3 horas, se enfrió a temperatura ambiente, se lavó con cloruro de amonio acuoso saturado, entonces con agua, y el solvente se eliminó in vacuo. La precipitación a partir del hexano proporcionó el compuesto del enunciado (11,5 g) en forma de un polvo amarillo. P f. 145-147°C;  $^1\text{H}$  RMN (400 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) 1,5 (s, 9H), 1,9 (m, 2H), 2,1 (m, 2H), 2,9 (m, 2H), 3,5 (m, 2H), 4,0 (m, 1H), 4,2 (m, 2H), 5,5 (s, 1H), 7,3 (s, 1H)

### Ejemplo 19

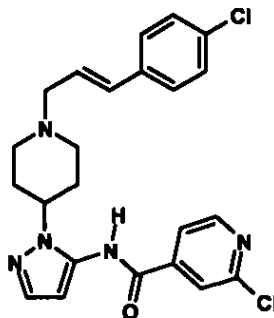
Este ejemplo ilustra la preparación de tert-butil éster de ácido 4-{5-[(2-cloro-piridin-4-carbonil)-amino]-pirazol-1-il}-piperidin-1-carboxílico



Se agregó trietilamina (2,8 ml) a una solución agitada del compuesto obtenido en el Ejemplo 18 (2,66 g) en diclorometano (100 ml); la solución se enfrió a 0°C y se agregó cloruro de 2-cloroisonicotinoilo (preparado a partir de 2,05 g de ácido 2-cloroisonicotínico y 1,46 ml de cloruro de oxalilo en 50 ml de diclorometano). La mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante 12 horas, se vertió en agua, se extrajo dos veces con diclorometano, las capas orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de sodio y se concentraron in vacuo. El residuo se precipitó a partir de etil acetato/hexano para obtener el compuesto del enunciado en forma de un polvo amarillo pálido (3,4 g). P.f. 209-210 °C,  $^1\text{H}$  RMN (400 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) 1,5 (s, 9H), 1,9 (m, 2H), 2,1 (m, 2H), 2,9 (m, 2H), 3,5 (m, 2H), 4,0 (m, 1H), 4,2 (m, 2H), 6,1 (s, 1H), 7,5 (s, 1H), 7,6 (m, 1H), 7,7 (s, 1H), 8,2 (sm, 1H), 8,5 (d, J = 6 Hz, 1H)

**Ejemplo 20**

Este ejemplo ilustra la preparación de 2-cloro-N-(2-{1-[3-(4-cloro-fenil)-alil]-piperidin-4-il}-2H-pirazol-3-il)-isonicotinamida

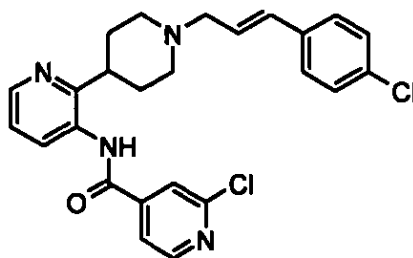


Una solución del compuesto obtenido en el Ejemplo 19 (2,7 g) en diclorometano (150 ml) se trató con ácido trifluoroacético (3,8 ml) durante 6 horas a temperatura ambiente y el solvente se eliminó in vacuo. El residuo se disolvió en acetonitrilo (100 ml), se agregó N,N-diisopropiletilamina (9 ml) y cloruro de 4-clorocinamilo (1,9 g). La solución resultante se agitó durante 24 horas a temperatura ambiente, el solvente se eliminó in vacuo y el residuo se sometió a cromatografía sobre gel de sílice (etil acetato metanol 95:5) para obtener un producto identificado como 2-{1-[3-(4-cloro-fenil)-alil]-piperidin-4-il}-2H-pirazol-3-ilamina. Este producto se volvió a acilar usando 1,05 g de cloruro de 2-cloroisonicotinoilo, 0,7 ml de trietilamina en 50 ml de diclorometano de acuerdo con el método descrito en el Paso B. La cromatografía sobre gel de sílice del residuo (etil acetato metanol 95:5) dio cuenta finalmente del producto del enunciado (370 mg) P.f. 69-70°C <sup>1</sup>H RMN (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>) 1,9-2,4 (m, 6H), 3,0 (d, J = 11,6 Hz, 2H), 3,1 (d, J = 6,4 Hz, 2H), 3,9 (m, 1H), 6,2 (m, 2H), 6,5 (d, J = 16,0 Hz, 1H), 7,3 (m, 4H), 7,5 (s, 1H), 7,6 (s, 1H), 7,7 (s amp, 1H), 8,6 (d, J = 4,8 Hz, 1H). Tiempo de retención HPLC 2,32 min, MS (ES<sup>+</sup>) 456/458 (M+H<sup>+</sup>).

La invención se ilustra mejor con ayuda de los siguientes ejemplos aplicando reacciones de acoplamiento cruzado

**Ejemplo 21**

Este ejemplo ilustra la preparación de 2-cloro-N-{1'-[(E)-3-(4-cloro-fenil)-alil]-1',2',3',4',5',6'-hexahidro-[2,4']bipiridinil-3-il}-isonicotinamida.



Paso A se disolvió 1-(t-butoxicarbonil)-4-tributilestanil-1,2,3,6-tetrahidropiridina (2,12 g, preparada en 2 pasos a partir de 1-(t-butoxicarbonil)-piperidin-4-ona de acuerdo con WO 0123381) en tolueno (45 ml) en una redoma enjuagada con rocío de nitrógeno y seca. Se agregó 2-cloro-3-nitropiridina (712 mg) y tetrakis(trifenilfosfin) paladio (130 mg) y la solución se calentó a 110°C durante 16 horas. La mezcla de reacción se enfrió a temperatura ambiente, el solvente se eliminó in vacuo y el residuo se particionó entre etil acetato (100 ml) y NaOH 2N (100 ml). Después de agitar durante 30 min a temperatura ambiente, la capa orgánica se separó, se lavó con NaOH 2N, luego con agua, se secó sobre sulfato de sodio y se concentró in vacuo. El residuo se sometió a cromatografía sobre gel de sílice (etil acetato ciclohexano 3/7) para obtener tert-butilo de ácido 3-nitro-3',6'-dihidro-2'H-[2,4']bipiridinil-1'-carboxílico (1,1 g) en forma de cristales amarillo claro. P f 104-105°C, <sup>1</sup>H RMN (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>) 1,4 (s, 9H), 2,5 (m, 2H), 3,6 (m, 2H), 4,0 (m, 2H), 5,9 (m, 1H), 7,3 (dd, J = 4,8, 8,4 Hz, 1H), 8,0 (d, J = 8,4 Hz, 1H), 8,7 (d, J = 4,8 Hz, 1H), MS (ES+) 206 (MH+ -BOC), 248 (MH+ -isopreno).

Paso B se agregó monohidrato de hidrazina (0,4 ml) a una suspensión de níquel Raney (50% suspensión en agua, 200 mg) y el producto obtenido en el Paso A (240 mg) en etanol (10 ml). Después de agitar durante 4 horas, la mezcla de reacción se filtró sobre Hyflo y el solvente se eliminó in vacuo. El residuo se disolvió en etil acetato, se secó sobre sulfato de sodio, se filtró y se concentró in vacuo para obtener tert-butil éster de ácido 3-amino-3',6'-dihidro-2'H-[2,4']bipiridinil-1'-carboxílico (200 mg) en forma de cristales blancos. P f 104-105 °C; <sup>1</sup>H RMN (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>) 1,4 (s, 9H), 2,5 (m, 2H), 3,6 (m, 2H), 3,7 (s amp, 2H), 4,0 (m, 2H), 5,9 (m, 1H), 6,9 (m, 2H), 8,0 (m, 1H), MS (ES+) 176 (MH+ -BOC), 220 (MH+ -isopreno), 276 (MH+).

Paso C el producto obtenido en el Paso B (815 mg) se redujo con hidrogenación de transferencia usando Pd/C al 10% (200 mg) y formiato de amonio (935 mg) en etanol (40 ml) a 60°C durante 45 min. Después de la filtración sobre Hyflo, el solvente se eliminó in vacuo. El residuo se particionó entre etil acetato y agua, la capa orgánica se separó, se lavó con agua, se

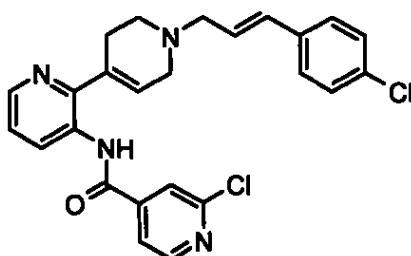
secó sobre sulfato de sodio y se concentró in vacuo para dar tert-butil éster de ácido 3-amino-3',4',5',6'-dihidro-2'H-[2,4']bipiridinil-1'-carboxílico (785 mg) en forma de aceite.  $^1\text{H}$  RMN (400 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) 1,4 (s, 9H), 1,6 (m, 4H), 2,7 (m, 3H), 3,5 (s amp, 2H), 4,0 (m, 2H), 6,9 (m, 2H), 8,0 (m, 1H), MS (ES+) 178 (MH+ -BOC), 222 (MH+ -isopreno), 278 (MH+)

5 Paso D se agregó bicarbonato de sodio (714 mg) a una solución agitada del compuesto obtenido en el Paso C (785 mg) en diclorometano (30 ml), la solución entonces se trató con cloruro de 2-cloro-isonicotinoilo (500 mg) y la mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante 1 hora, se vertió en agua, se extrajo dos veces con diclorometano, las capas orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de sodio y se concentraron in vacuo para obtener tert-butil  
10 éster de ácido 3-[(2-cloro-piridin-4-carbonil)-amino]-3',4',5',6'-tetrahidro-2'H-[2,4']bipiridinil-1'-carboxílico (1,2 g)

Paso E: una solución del compuesto obtenido en el Paso D (834 mg) en diclorometano (40 ml) se trató con ácido trifluoroacético (4 ml) durante 5 horas a temperatura ambiente. La mezcla de reacción se concentró in vacuo y entonces se secó en alto vacío durante 1 hora. El  
15 residuo se disolvió en acetonitrilo (40 ml), se agregó diisopropiletilamina (1,8 ml) y cloruro de 4-clorocinamilo (380 mg). La solución se agitó 20 horas a temperatura ambiente, el solvente se eliminó in vacuo y el residuo se sometió a cromatografía sobre gel de sílice (etil acetato:metanol 95:5) para obtener el producto del enunciado (409 mg) en forma de un sólido amarillo. P. f. 78-80°C;  $^1\text{H}$  RMN (400 MHz,  $\text{CDCl}_3$ ) 1,9 (m, 2H), 2,2 (m, 4H), 2,8 (m, 1H), 3,2 (d, J = 9 Hz, 2H), 3,3 (m, 2H), 6,2 (dt, J = 18, 9 Hz, 1H), 6,5 (d, J = 18 Hz, 1H), 7,1-7,3 (m, 5H), 7,6 (d, J = 4,4 Hz, 1H), 7,7 (s, 1H), 7,9 (m, 1H, NH), 8,0 (d, J = 7,6 Hz, 1H), 8,6 (d, J = 3,6 Hz, 1H), 8,7 (d, J = 5,5 Hz, 1H); tiempo de retención HPLC 1,53 min, MS (ES+) 467/469 (M+H<sup>+</sup>)

### Ejemplo 22

Este ejemplo ilustra la preparación de 2-cloro-N-{1'-[(E)-3-(4-cloro-fenil)-alil]-1',2',3',6'-hexahidro-[2,4']bipiridinil-3-il}-isonicotinamida.  
25



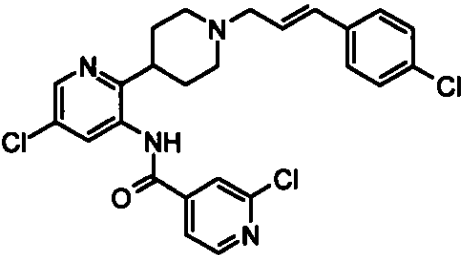
Se trató tert-butil éster de ácido 3-amino-3',6'-dihidro-2'H-[2,4']bipiridinil-1'-carboxílico (Ejemplo 1, Paso B, 205 mg) como se describió en el Ejemplo 1, pasos D y E para obtener el producto del enunciado (182 mg) en forma de un sólido amarillo P f. 75-77°C, <sup>1</sup>H RMN (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>) 1,8 (m, 2H), 2,7 (m, 2H), 2,8 (m, 2H), 3,2 (m, 2H), 3,3 (m, 2H), 6,0 (s, 1H), 6,2 (dt, J = 18, 9 Hz, 1H), 6,5 (d, J = 18 Hz, 1H), 7,1-7,3 (m, 6H), 7,6 (m, 1H), 7,7 (s, 1H), 7,7 (s, 1H), 8,3 (d, J = 3,6 Hz, 1H), 8,5 (d, J = 5,5 Hz, 1H), 8,8 (m, 1H, NH); tiempo de retención HPLC 1,51 min; MS (ES+) 465/467 (M+H<sup>+</sup>).

Los siguientes compuestos se prepararon de acuerdo con procedimientos análogos a los descriptos en el Ejemplo 22:

| Nombre de compuesto                                                                                      | Estructura | P.f (°C) | MH <sup>+</sup> | Tiempo de retención (min) |
|----------------------------------------------------------------------------------------------------------|------------|----------|-----------------|---------------------------|
| 2-cloro-N-{1'-[(E)-3-(4-cloro-fenil)-alil]-1',2',3',6'-hexahidro-[2,4']bipiridinil-3-il}-isonicotinamida |            |          | 499/501/503     | 1,64                      |

Ejemplo 23

Este ejemplo ilustra la preparación de 2-cloro-N-{5-cloro-1'-[(E)-3-(4-cloro-fenil)-alil]-1',2',3',4',5',6'-hexahidro-[2,4']bipiridinil-3-il}-isonicotinamida.

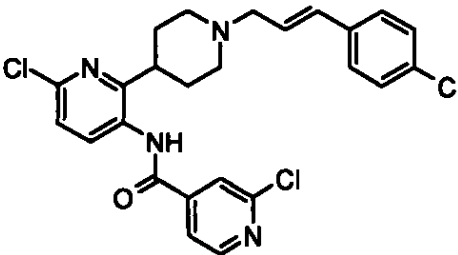
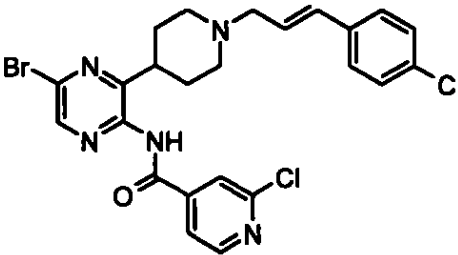


Se agregó por goteo una mezcla de trimetilclorosilano y 1,2-dibromoetano (7:5 v/v, 0,125 ml) (manteniendo la T°C por debajo de 50°C) a una suspensión de polvo de zinc (422 mg) en dimetilacetamida (3 ml). La mezcla se agitó 20 min a temperatura ambiente, entonces se agregó por goteo una solución de 1-(t-butoxicarbonil)-4-iodo-piperidina (1,62 g, preparada en 2 pasos a partir de 1-(t-butoxicarbonil)-piperidin-4-ona de acuerdo con J. Org Chem 2004, 5120) en dimetilacetamida (3 ml) durante 5 min (ligeramente exotérmica) La mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante 30 min, entonces se introdujo por cánula a una mezcla de 2,5-dicloro-3-aminopiridina (603 mg), yoduro de cobre(I) (42 mg) y PdCl<sub>2</sub>(dppf) (91 mg) en dimetilacetamida (5 ml) La mezcla resultante se agitó a 80°C durante 3 horas, se enfrió a temperatura ambiente, se vertió en agua, se extrajo con etil acetato, se secó sobre sulfato de sodio y se concentró in vacuo El residuo se sometió a cromatografía sobre gel de sílice (etil acetato:ciclohexano 3 7) para obtener tert-butil éster de ácido 3-amino-5-cloro-3',6'-dihidro-2'H-[2,4']bipiridinil-1'-carboxílico (535 mg) en forma de un sólido amarillo <sup>1</sup>H RMN (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>) 1,4 (s, 9H), 1,8 (m, 4H), 2,6 (m, 1H), 2,8 (m, 2H), 3,7 (s amp, 2H), 4,2 (m, 2H), 6,9 (s, 1H), 7,9 (s, 1H).

El producto así obtenido (448 mg) se trató como se describió en el Ejemplo 1, Pasos D y E para obtener el producto del enunciado (455 mg) en forma de un sólido blanco P.f. 63-67°C; <sup>1</sup>H RMN (400 MHz, CDCl<sub>3</sub>) 1,9 (m, 2H), 2,2 (m, 4H), 2,7 (m, 1H), 3,2 (m, 2H), 3,3 (m, 2H), 6,2 (dt, J = 18, 9 Hz, 1H), 6,5 (d, J = 18 Hz, 1H), 7,1-7,3 (m, 4H), 7,7 (d, J = 5,2 Hz, 1H), 7,8 (s, 1H), 7,9 (m, 1H, NH), 8,3 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,4 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,6 (d, J = 4,8 Hz, 1H), 8,7 (d, J = 5,5 Hz, 1H); tiempo de retención HPLC 1 53 min, MS (ES+) 501/503/505 (M+H<sup>+</sup>).

Los siguientes compuestos se prepararon de acuerdo con procedimientos análogos a los descriptos en el Ejemplo 23:

| Nombre de compuesto | Estructura | P.f (°C) | MH <sup>+</sup> | Tiempo de |
|---------------------|------------|----------|-----------------|-----------|
|---------------------|------------|----------|-----------------|-----------|

|                                                                                                                        |                                                                                     |       |             | retención (min) |
|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-------------------------------------------------------------------------------------|-------|-------------|-----------------|
| 2-cloro-N-{4-cloro-1'-[(E)-3-(4-cloro-fenil)-alil]-1',2',3',4',5',6'-hexahidro-[2,4']bipiridinil-3-il}-isonicotinamida |    | 80-85 | 499/501/503 | 1,55            |
| N-(5-bromo-3-{1-[(E)-3-(4-cloro-fenil)-alil]-piperidin-4-il}-pirazin-2-il)-2-cloro-isonicotinamida                     |  |       | 548/550     | 1,33            |

Los siguientes compuestos (Tablas EJ23.1 – EJ23.11) se prepararon aplicando reacciones de acoplamiento cruzado Suzuki como se describe en los Esquemas 8-13 Se aplicaron condiciones de reacción descriptas en la literatura [P R Eastwood, THL 41, 3705 (2000) por ejemplo] o como las descriptas anteriormente.

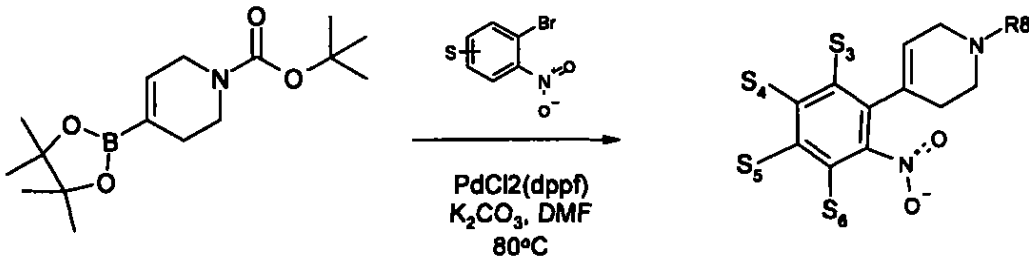


Tabla EJ23.1

| Compuesto<br>No | R <sup>8</sup> | S <sub>3</sub>  | S <sub>4</sub> | S <sub>5</sub>     | S <sub>6</sub>  | P f<br>(°C) | MH <sup>+</sup><br>- BOC | Tiempo<br>de<br>retención<br>(min) |
|-----------------|----------------|-----------------|----------------|--------------------|-----------------|-------------|--------------------------|------------------------------------|
| EJ23-1-2        | BOC            | H               | H              | F                  | H               |             | 323/322                  | 2,22                               |
| EJ23-1-3        | BOC            | H               | H              | CF <sub>3</sub>    | H               |             | 373/372                  | 2,30                               |
| EJ23-1-4        | BOC            | H               | H              | OCH <sub>3</sub>   | H               |             | 235/234                  | 2,23                               |
| EJ23-1-5        | BOC            | CH <sub>3</sub> | H              | H                  | H               |             | 219/220                  | 2,19                               |
| EJ23-1-6        | BOC            | H               | H              | H                  | CH <sub>3</sub> | 100-<br>102 | 219/220                  | 2,22                               |
| EJ23-1-7        | BOC            | H               | H              | COOCH <sub>3</sub> | H               |             | 263/264                  | 2,08                               |

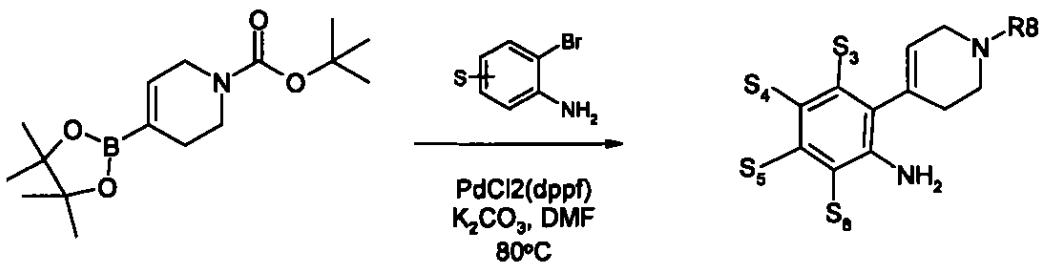


Tabla EJ23 2

| Compuesto<br>No | R <sup>8</sup> | S <sub>3</sub> | S <sub>4</sub>   | S <sub>5</sub> | S <sub>6</sub> | P f.<br>(°C) | MH <sup>+</sup><br>-BOC | Tiempo de<br>retención<br>(min) |
|-----------------|----------------|----------------|------------------|----------------|----------------|--------------|-------------------------|---------------------------------|
| EJ23-2-1        | BOC            | H              | H                | H              | F              | 100-<br>102  | 193/194                 | 2,15                            |
| EJ23-2-2        | BOC            | H              | F                | H              | F              |              | 211/210                 | 2,12                            |
| EJ23-2-3        | BOC            | H              | i-Pr             | H              | H              |              | 217/216                 | 2,11                            |
| EJ23-2-4        | BOC            | H              | F                | F              | F              |              | 229/230                 | 2,21                            |
| EJ23-2-5        | BOC            | H              | OCF <sub>3</sub> | H              | H              |              | 259/260                 | 2,22                            |
| EJ23-2-6        | BOC            | H              | F                | H              | H              |              | 193/194                 | 2,02                            |

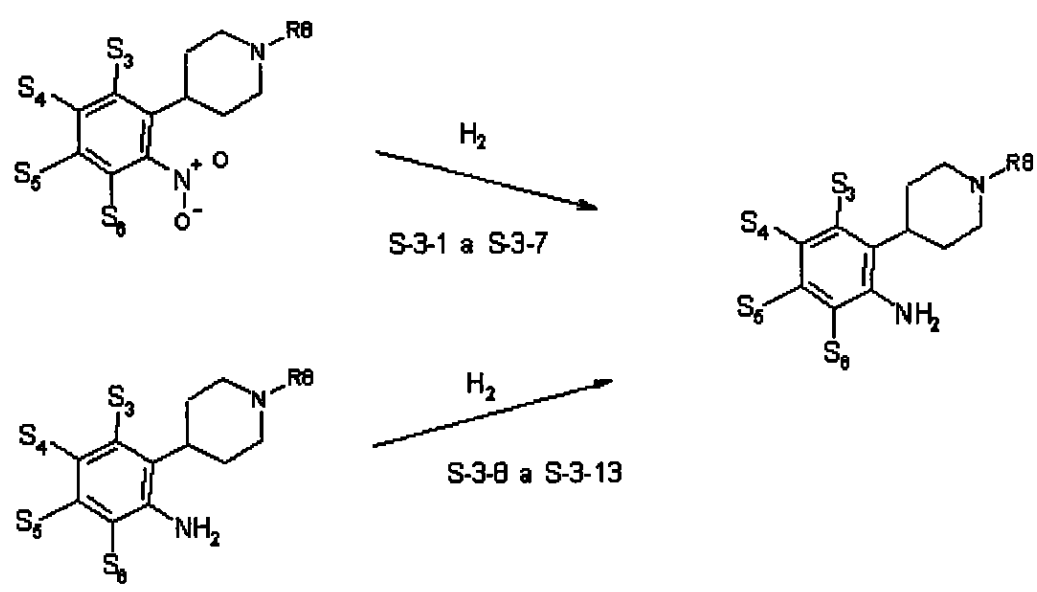
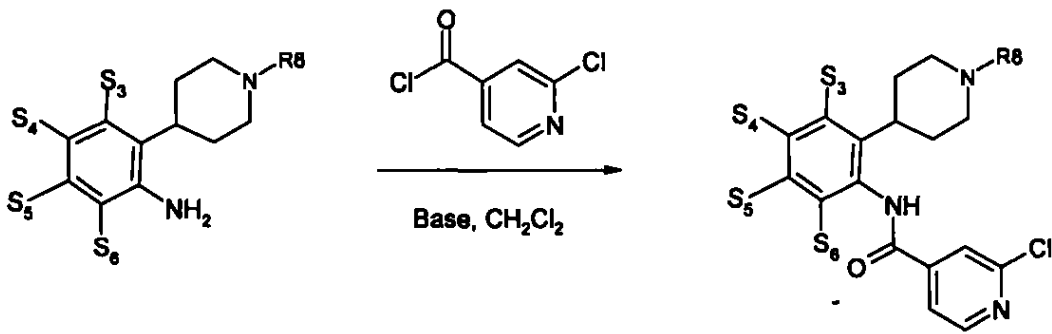


Tabla EJ23 3

| Compuesto<br>No. | R <sup>8</sup> | S <sub>3</sub>  | S <sub>4</sub>   | S <sub>5</sub>     | S <sub>8</sub>  | P f.<br>(°C) | MH <sup>+</sup><br>-BOC | Tiempo<br>de<br>retención<br>(min) |
|------------------|----------------|-----------------|------------------|--------------------|-----------------|--------------|-------------------------|------------------------------------|
| EJ23-3-1         | BOC            | H               | H                | CH <sub>3</sub>    | H               |              | 191/192                 | 1,90                               |
| EJ23-3-2         | BOC            | H               | H                | F                  | H               |              | 195/196                 | 2,05                               |
| EJ23-3-3         | BOC            | H               | H                | CF <sub>3</sub>    | H               |              | 245/246                 | 2,22                               |
| EJ23-3-4         | BOC            | H               | H                | OCH <sub>3</sub>   | H               |              | 207/208                 | 1,92                               |
| EJ23-3-5         | BOC            | CH <sub>3</sub> | H                | H                  | H               |              | 191/192                 | 1,87                               |
| EJ23-3-6         | BOC            | H               | H                | H                  | CH <sub>3</sub> |              | 191/192                 | 2,06                               |
| EJ23-3-7         | BOC            | H               | H                | COOCH <sub>3</sub> | H               |              | 235/236                 | 2,00                               |
| EJ23-3-8         | BOC            | H               | H                | H                  | F               | 123-<br>126  | 195/196                 | 2,12                               |
| EJ23-3-9         | BOC            | H               | F                | H                  | F               |              | 213/214                 | 2,10                               |
| EJ23-3-10        | BOC            | H               | i-Pr             | H                  | H               |              | 219/220                 | 2,00                               |
| EJ23-3-11        | BOC            | H               | F                | F                  | F               |              | 231/232                 | 2,16                               |
| EJ23-3-12        | BOC            | H               | OCF <sub>3</sub> | H                  | H               |              | 261/262                 | 2,18                               |
| EJ23-3-13        | BOC            | H               | F                | H                  | H               |              | 195/196                 | 1,87                               |



| Compuesto<br>No | R <sup>8</sup> | S <sub>3</sub>  | S <sub>4</sub>   | S <sub>5</sub>     | S <sub>6</sub>  | P f<br>(°C) | MH <sup>+</sup><br>-BOC | Tiempo<br>de<br>retención<br>(min) |
|-----------------|----------------|-----------------|------------------|--------------------|-----------------|-------------|-------------------------|------------------------------------|
| EJ23-4-1        | BOC            | H               | H                | CH <sub>3</sub>    | H               | amorfo      | 330/332/333             | 2,14                               |
| EJ23-4-2        | BOC            | H               | H                | F                  | H               | amorfo      | 334/336/337             | 2,11                               |
| EJ23-4-3        | BOC            | H               | H                | CF <sub>3</sub>    | H               | amorfo      | 384/386/387             | 2,22                               |
| EJ23-4-4        | BOC            | H               | H                | OCH <sub>3</sub>   | H               | amorfo      | 346/348/349             | 2,07                               |
| EJ23-4-5        | BOC            | CH <sub>3</sub> | H                | H                  | H               | amorfo      | 330/332/333             | 2,04                               |
| EJ23-4-6        | BOC            | H               | H                | H                  | CH <sub>3</sub> |             | 330/332/333             | 2,06                               |
| EJ23-4-7        | BOC            | H               | H                | COOCH <sub>3</sub> | H               | amorfo      | 374/376/377             | 2,05                               |
| EJ23-4-8        | BOC            | H               | H                | H                  | F               | amorfo      | 334/336/337             | 2,02                               |
| EJ23-4-9        | BOC            | H               | F                | H                  | F               | amorfo      | 352/354/355             | 2,08                               |
| EJ23-4-10       | BOC            | H               | i-Pr             | H                  | H               | amorfo      | 358/360/361             | 2,25                               |
| EJ23-4-11       | BOC            | H               | F                | F                  | F               | amorfo      | 370/372/372             | 2,25                               |
| EJ23-4-12       | BOC            | H               | OCF <sub>3</sub> | H                  | H               | 227-<br>230 | 400/402/403             | 2,22                               |

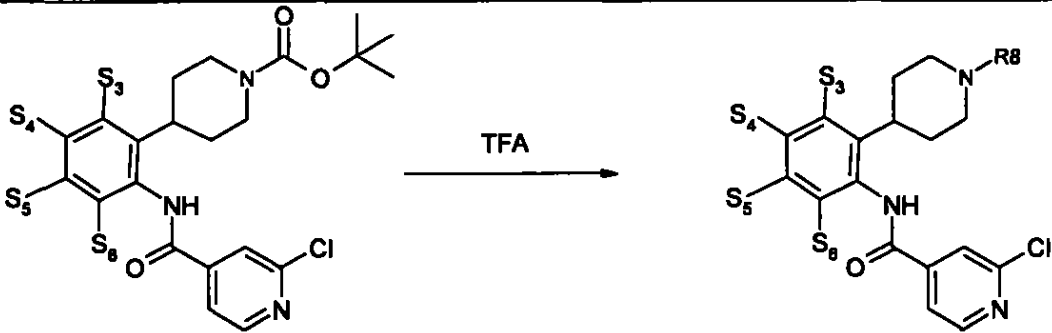
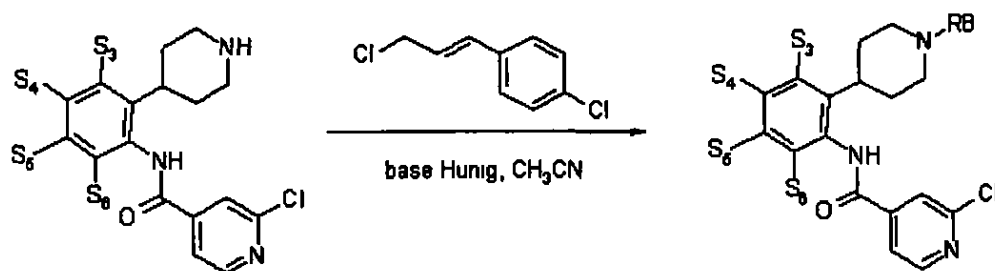


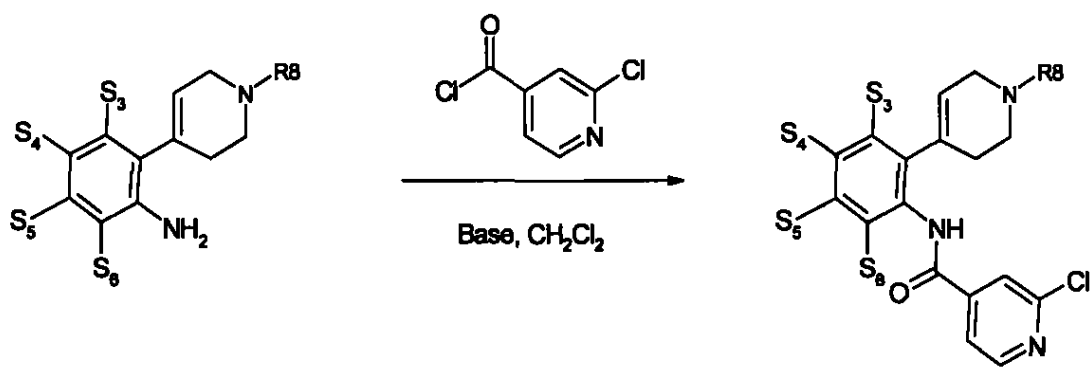
Tabla EJ23.5

| Compuesto<br>No | R <sup>8</sup> | S <sub>3</sub>  | S <sub>4</sub>   | S <sub>5</sub>     | S <sub>6</sub>  | P f<br>(°C) | MH <sup>+</sup> | Tiempo<br>de<br>retención<br>(min) |
|-----------------|----------------|-----------------|------------------|--------------------|-----------------|-------------|-----------------|------------------------------------|
| EJ23-5-1        | H              | H               | H                | CH <sub>3</sub>    | H               | amorfo      | 330/332/333     | 1,17                               |
| EJ23-5-2        | H              | H               | H                | F                  | H               | amorfo      | 334/336/337     | 1,18                               |
| EJ23-5-3        | H              | H               | H                | CF <sub>3</sub>    | H               | amorfo      | 384/386/387     | 1,35                               |
| EJ23-5-4        | H              | H               | H                | OCH <sub>3</sub>   | H               | amorfo      | 346/348/349     | 1,17                               |
| EJ23-5-5        | H              | CH <sub>3</sub> | H                | H                  | H               | amorfo      | 330/332/333     | 1,12                               |
| EJ23-5-6        | H              | H               | H                | H                  | CH <sub>3</sub> | amorfo      | 330/332/333     | 1,15                               |
| EJ23-5-7        | H              | H               | H                | COOCH <sub>3</sub> | H               | amorfo      | 374/376/377     | 1,13                               |
| EJ23-5-8        | H              | H               | H                | H                  | F               | amorfo      | 334/336/337     | 1,14                               |
| EJ23-5-9        | H              | H               | F                | H                  | F               | amorfo      | 352/354/355     | 1,22                               |
| EJ23-5-10       | H              | H               | i-Pr             | H                  | H               | amorfo      | 358/360/361     | 1,37                               |
| EJ23-5-11       | H              | H               | F                | F                  | F               | amorfo      | 370/372/372     | 1,28                               |
| EJ23-5-12       | H              | H               | OCF <sub>3</sub> | H                  | H               | amorfo      | 400/402/403     | 1,30                               |

**Tabla EJ23 6**

| Compuesto<br>No | R <sup>8</sup> | S <sub>3</sub> | S <sub>4</sub> | S <sub>5</sub>  | S <sub>6</sub> | P f<br>(°C) | MH <sup>+</sup> | Tiempo<br>de<br>retención<br>(min) |
|-----------------|----------------|----------------|----------------|-----------------|----------------|-------------|-----------------|------------------------------------|
| EJ23-6-1        | 4-cloro-       | H              | H              | CH <sub>3</sub> | H              | 203-        | 480/482/483     | 1,51                               |

|           |                  |                 |                  |                    |                 |         |             |      |
|-----------|------------------|-----------------|------------------|--------------------|-----------------|---------|-------------|------|
|           | cinamilo         |                 |                  |                    |                 | 206     |             |      |
| EJ23-6-2  | 4-cloro-cinamilo | H               | H                | F                  | H               |         | 484/486/487 | 1,49 |
| EJ23-6-3  | 4-cloro-cinamilo | H               | H                | CF <sub>3</sub>    | H               |         | 534/536/537 | 1,59 |
| EJ23-6-4  | 4-cloro-cinamilo | H               | H                | OCH <sub>3</sub>   | H               |         | 496/498/499 | 1,47 |
| EJ23-6-5  | 4-cloro-cinamilo | CH <sub>3</sub> | H                | H                  | H               | amorfo  | 480/482/483 | 1,49 |
| EJ23-6-6  | 4-cloro-cinamilo | H               | H                | H                  | CH <sub>3</sub> | 90-93   | 480/482/483 | 1,54 |
| EJ23-6-7  | 4-cloro-cinamilo | H               | H                | COOCH <sub>3</sub> | H               | 92-95   | 524/526/527 | 1,52 |
| EJ23-6-8  | 4-cloro-cinamilo | H               | H                | H                  | F               |         | 484/486/487 | 1,44 |
| EJ23-6-9  | 4-cloro-cinamilo | H               | F                | H                  | F               | 221-223 | 502/504/505 | 1,49 |
| EJ23-6-10 | 4-cloro-cinamilo | H               | i-Pr             | H                  | H               | amorfo  | 508/510/511 | 1,61 |
| EJ23-6-11 | 4-cloro-cinamilo | H               | F                | F                  | F               | amorfo  | 520/522/523 | 1,53 |
| EJ23-6-12 | 4-cloro-cinamilo | H               | OCF <sub>3</sub> | H                  | H               |         | 550/552/553 | 1,61 |
| EJ23-6-13 | 4-cloro-cinamilo | H               | F                | H                  | H               | 165-167 | 484/486/487 | 1,49 |



Tabl

a EJ23.7

| Compuesto No | $R^8$ | $S_3$ | $S_4$   | $S_5$ | $S_6$ | P.f ( $^{\circ}C$ ) | $MH^+$ -BOC | Tiempo de retención (min) |
|--------------|-------|-------|---------|-------|-------|---------------------|-------------|---------------------------|
| EJ23-7-1     | BOC   | H     | F       | H     | F     | amorfo              | 350/352/353 | 2,07                      |
| EJ23-7-2     | BOC   | H     | i-Pr    | H     | H     | 167-169             | 356/358/359 | 2,27                      |
| EJ23-7-3     | BOC   | H     | F       | F     | F     | 169-171             | 368/370/371 | 2,13                      |
| EJ23-7-4     | BOC   | H     | $OCF_3$ | H     | H     | amorfo              | 398/400/401 | 2,23                      |
| EJ23-7-5     | BOC   | H     | F       | H     | H     | amorfo              | 332/334/335 | 2,12                      |

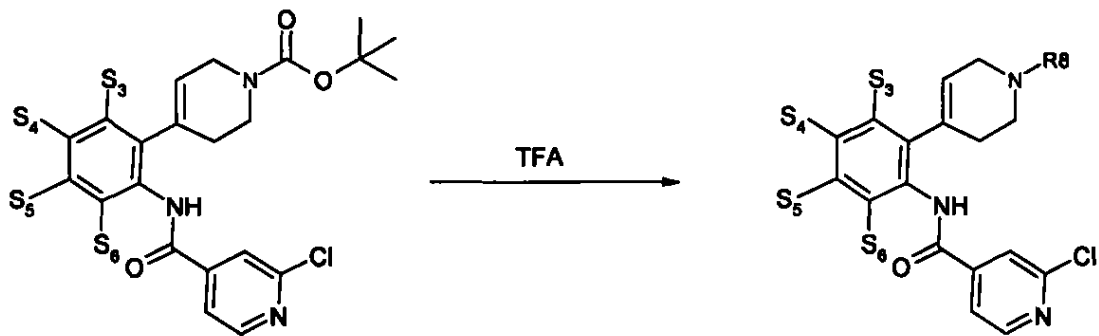


Tabla EJ23.8

| Compuesto<br>No. | R <sup>8</sup> | S <sub>3</sub> | S <sub>4</sub>   | S <sub>5</sub> | S <sub>6</sub> | P f<br>(°C) | MH <sup>+</sup> | Tiempo de<br>retención<br>(min) |
|------------------|----------------|----------------|------------------|----------------|----------------|-------------|-----------------|---------------------------------|
| EJ23-8-1         | H              | H              | F                | H              | F              |             |                 |                                 |
| EJ23-8-2         | H              | H              | i-Pr             | H              | H              | amorfo      | 356/358/359     | 1,33                            |
| EJ23-8-3         | H              | H              | F                | F              | F              |             |                 |                                 |
| EJ23-8-4         | H              | H              | OCF <sub>3</sub> | H              | H              | amorfo      | 398/400/401     | 1,37                            |
| EJ23-8-5         | H              | H              | F                | H              | H              | amorfo      | 332/334/335     | 1,09                            |

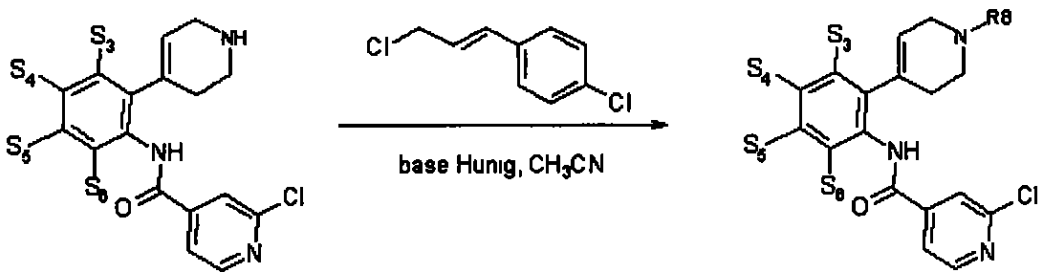


Tabla EJ23.9

| Compuesto<br>No | R <sup>8</sup>       | S <sub>3</sub> | S <sub>4</sub>   | S <sub>5</sub> | S <sub>6</sub> | P.f<br>(°C) | MH <sup>+</sup> | Tiempo<br>de<br>retención<br>(min) |
|-----------------|----------------------|----------------|------------------|----------------|----------------|-------------|-----------------|------------------------------------|
| EJ23-9-1        | 4-cloro-<br>cinamilo | H              | F                | H              | F              |             |                 |                                    |
| EJ23-9-2        | 4-cloro-<br>cinamilo | H              | i-Pr             | H              | H              | amorfo      | 506/508/509     | 1,67                               |
| EJ23-9-3        | 4-<br>clorocinamilo  | H              | F                | F              | F              |             |                 |                                    |
| EJ23-9-4        | 4-cloro-<br>cinamilo | H              | OCF <sub>3</sub> | H              | H              |             | 548/550/551     | 1,66                               |
| EJ23-9-5        | 4-cloro-             | H              | F                | H              | H              | amorfo      | 482/484/485     | 1,47                               |

|  |          |  |  |  |  |  |  |  |
|--|----------|--|--|--|--|--|--|--|
|  | cinamilo |  |  |  |  |  |  |  |
|--|----------|--|--|--|--|--|--|--|

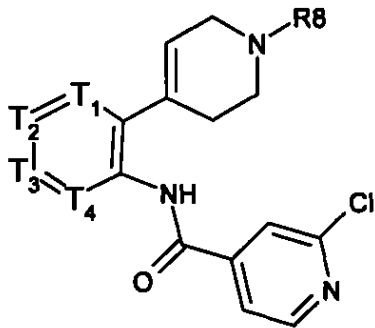


Tabla EJ23 10

| Compuesto No | R <sup>a</sup>   | T <sub>1</sub> | T <sub>2</sub>    | T <sub>3</sub> | T <sub>4</sub> | P f (°C) | MH <sup>+</sup> | Tiempo de retención (min) |
|--------------|------------------|----------------|-------------------|----------------|----------------|----------|-----------------|---------------------------|
| EJ23-10-1    | 4-cloro-cinamilo | N              | C-Me              | CH             | CH             |          | 420/422         | 1,27                      |
| EJ23-10-2    | 4-bromo-cinamilo | N              | C-Me              | CH             | CH             |          | 525/526         | 1,29                      |
| EJ23-10-3    | 4-cloro-cinamilo | N              | C-Br              | CH             | N              |          | 546/548         | 1,37                      |
| EJ23-10-4    | 4-cloro-cinamilo | CH             | N                 | C-Cl           | N              |          | 502/504         | 1,30                      |
| EJ23-10-5    | 4-cloro-cinamilo | C-Cl           | N                 | CH             | CH             |          | 501/503         | 1,54                      |
| EJ23-10-6    | 4-cloro-cinamilo | C-Cl           | N                 | C-Cl           | CH             |          | 535/537         | 1,63                      |
| EJ23-10-7    | 4-cloro-cinamilo | CH             | C-CF <sub>3</sub> | CH             | N              |          | 533/535         | 1,39                      |
| EJ23-10-8    | 4-cloro-         | N              | C-Cl              | CH             | CH             |          | 501/503         | 1,34                      |

|            |                  |   |      |    |    |  |         |      |
|------------|------------------|---|------|----|----|--|---------|------|
|            | cinamilo         |   |      |    |    |  |         |      |
| EJ23-10-9  | 4-bromo-cinamilo | N | C-Cl | CH | CH |  | 545/547 | 1,36 |
| EJ23-10-10 | 4-cloro-cinamilo | S | CH   | CH | -  |  | 470/472 | 1,38 |
| EJ23-10-11 | 4-cloro-cinamilo | S | C-Cl | CH | -  |  | 506/508 | 1,43 |

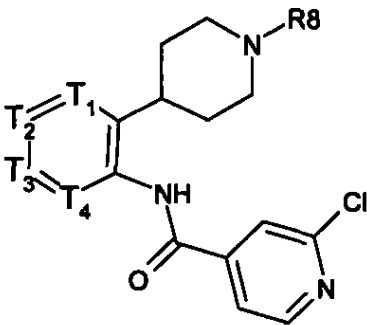


Tabla EJ23 11

| Compuesto No | R <sup>8</sup>   | T <sub>1</sub> | T <sub>2</sub>  | T <sub>3</sub> | T <sub>4</sub> | P f (°C) | MH <sup>+</sup> | Tiempo de retención (min) |
|--------------|------------------|----------------|-----------------|----------------|----------------|----------|-----------------|---------------------------|
| EJ23-11-1    | 4-cloro-cinamilo | N              | C-Me            | CH             | CH             |          | 481/483         | 1,33                      |
| EJ23-11-2    | 4-bromo-cinamilo | N              | C-Me            | CH             | CH             |          | 527/529/530     | 1,33                      |
| EJ23-11-3    | 4-cloro-cinamilo | CH             | CF <sub>3</sub> | CH             | N              |          | 535/537         | 1,35                      |
| EJ23-11-4    | 4-bromo-cinamilo | CH             | CF <sub>3</sub> | CH             | N              |          | 581/582,5       | 1,36                      |

5

Ejemplo 24

Este ejemplo ilustra las propiedades pesticidas/insecticidas de los compuestos de Fórmula (I) Las contrapruebas se realizaron de la siguiente manera

**Spodoptera littoralis (rosquilla negra egipcia)**

Se colocaron discos de hoja de algodón sobre agar en una placa para microtítulo de 24 pocillos y se rociaron con soluciones de prueba en una proporción de aplicación de 200 ppm. Después de secarse, los discos foliares se infestaron con 5 larvas L<sub>1</sub>. Tres días después del tratamiento (DAT) se analizó la mortalidad, el efecto repelente, el comportamiento alimentario y la regulación del crecimiento en las muestras. Los siguientes compuestos dieron por lo menos 80% de control de *Spodoptera littoralis*: laaa-3 e laaa-49.

**Heliothis virescens (gusano cogollero)**

Se colocaron huevos (de 0 a 24 h de vida) en placas para microtítulo de 24 pocillos con dieta artificial y se trataron con soluciones de prueba en una proporción de aplicación de 200 ppm con pipeta. Después de un periodo de incubación de 4 días, se analizó la mortalidad de los huevos, la mortalidad de las larvas y la regulación del crecimiento de las muestras. Los siguientes compuestos dieron por lo menos 80% de control de *Heliothis virescens*: la-49, la-50, la-53, laaa-3, laaa-26, laaa-49, laaa-52, laab-26 e laac-26.

**Plutella xylostella (polilla de crucíferas)**

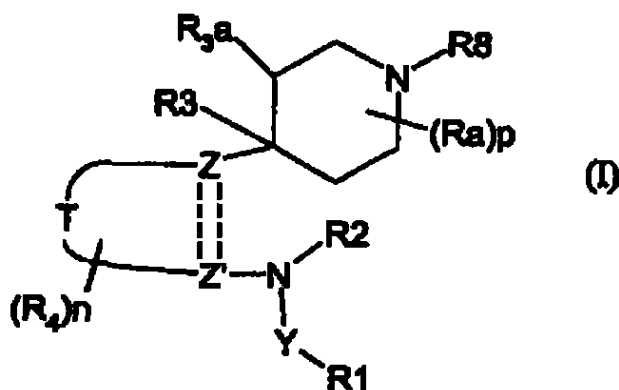
Se trató una placa para microtítulo de 24 pocillos (MTP) con dieta artificial con soluciones de prueba en una proporción de aplicación de 18,2 ppm con pipeta. Después de secarse, las MTP se infestaron con larvas (L<sub>2</sub>) (10-15 por pocillo). Después de un periodo de incubación de 5 días, se evaluó la mortalidad de las larvas y la regulación del crecimiento y antialimentación en las muestras. Los siguientes compuestos dieron por lo menos 80% de control de *Plutella xylostella*: la-49, la-53, laaa-3, laaa-26, laaa-49 e laac-26.

**Aedes aegypti (mosquito de la fiebre amarilla):**

Se colocaron 10-15 larvas de *Aedes* (L<sub>2</sub>) junto con una mezcla de nutrición en placas para microtítulo de 96 pocillos. En los pocillos se incorporaron mediante pipeta soluciones de prueba en una proporción de aplicación de 2 ppm. Dos días después, se analizó la mortalidad y la inhibición del crecimiento de los insectos. Los siguientes compuestos dieron por lo menos 80% de control de *Aedes aegypti*: la-53, laaa-3, laaa-26, laaa-49, laaa-52, laab-26, laac-26 e laai-26.

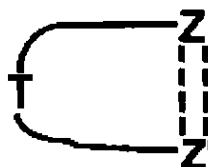
**REIVINDICACIONES**

1 Un método para combatir y controlar insectos, ácaros, nematodos o moluscos que comprende aplicar a una plaga, al locus de una plaga, o a una planta propensos a padecer el ataque de una plaga una cantidad efectiva como insecticida, acaricida, nematicida o molusquicida de un compuesto de Fórmula I



donde Y es un enlace simple, C=O, C=S o S(O)<sub>m</sub> donde m es 0, 1 o 2;

el anillo



es un anillo aromático de seis miembros o es un anillo heteroaromático de cinco o seis miembros;

Z y Z' están unidos por un enlace simple o doble y son  $\begin{smallmatrix} | \\ =C- \end{smallmatrix}$  o  $\begin{smallmatrix} | \\ -N- \end{smallmatrix}$  siempre y cuando ambos no sean N,

R<sup>1</sup> es hidrógeno, alquilo opcionalmente sustituido, alcóxicarbonilo opcionalmente sustituido, alquilcarbonilo opcionalmente sustituido, aminocarbonilo, alquilaminocarbonilo opcionalmente sustituido, dialquilaminocarbonilo opcionalmente sustituido, anilo opcionalmente sustituido, heteroarilo opcionalmente sustituido, alcóxi opcionalmente sustituido, anloxi opcionalmente sustituido, heteroanloxi opcionalmente sustituido, heterociclioxi opcionalmente sustituido, ciano, alquenilo opcionalmente sustituido, alquinilo opcionalmente sustituido, cicloalquilo opcionalmente sustituido, cicloalquenilo opcionalmente sustituido, formilo, heterocicliilo opcionalmente sustituido, alquiltio opcionalmente sustituido, NO o NR<sup>13</sup>R<sup>14</sup> donde

$R^{13}$  y  $R^{14}$  son independientemente hidrógeno,  $COR^{15}$ , alquilo opcionalmente sustituido, arilo opcionalmente sustituido, heteroarilo opcionalmente sustituido, heterociclilo opcionalmente sustituido o  $R^{13}$  y  $R^{14}$  junto con el átomo de N al cual están unidos forman un grupo  $-N=C(R^{16})-NR^{17}R^{18}$  o  $R^{13}$  y  $R^{14}$  junto con el átomo de N al cual están unidos forman un anillo heterocíclico de cinco, seis o siete miembros que puede contener uno o dos heteroátomos adicionales seleccionados entre O, N o S y que puede estar opcionalmente sustituido con uno o dos grupos alquilo  $C_{1-6}$ ,  $R^{15}$  es H, alquilo opcionalmente sustituido, alcoxi opcionalmente sustituido, arilo opcionalmente sustituido, ariloxi opcionalmente sustituido, heteroarilo opcionalmente sustituido, heteroariloxi opcionalmente sustituido o  $NR^{19}R^{20}$ ;  $R^{16}$ ,  $R^{17}$  y  $R^{18}$  son cada uno independientemente H o alquilo inferior,  $R^{19}$  y  $R^{20}$  son independientemente alquilo opcionalmente sustituido, arilo opcionalmente sustituido o heteroarilo opcionalmente sustituido,

$R^2$  es H, hidroxil, alcoxi opcionalmente sustituido o alquilo opcionalmente sustituido, o  $R^1$  y  $R^2$  junto con los grupos Y y N forman un anillo heterocíclico de cinco o seis miembros que pueden contener opcionalmente un heteroátomo adicional seleccionado entre O, N o S y que puede estar opcionalmente sustituido con alquilo  $C_{1-4}$ , haloalquilo  $C_{1-4}$  o halógeno,

$R^3$  es H, OH, halógeno o alquilo opcionalmente sustituido,

$R^{3a}$  es H o  $R^3$  y  $R^{3a}$  juntos forman un enlace;

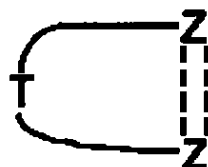
cada  $R^4$  es independientemente halógeno, nitro, ciano, alquilo  $C_{1-8}$  opcionalmente sustituido, alquenilo  $C_{2-8}$  opcionalmente sustituido, alquinilo  $C_{2-8}$  opcionalmente sustituido, alcóxicarbonilo opcionalmente sustituido, alquilcarbonilo opcionalmente sustituido, alquilaminocarbonilo opcionalmente sustituido, dialquilaminocarbonilo opcionalmente sustituido, cicloalquilo  $C_{3-7}$  opcionalmente sustituido, arilo opcionalmente sustituido, heteroarilo opcionalmente sustituido, heterociclilo opcionalmente sustituido, alcoxi opcionalmente sustituido, ariloxi opcionalmente sustituido, heteroariloxi opcionalmente sustituido, alquiltio opcionalmente sustituido o  $R^{21}R^{22}N$  donde  $R^{21}$  y  $R^{22}$  son, independientemente, hidrógeno, alquilo  $C_{1-8}$ , cicloalquilo  $C_{3-7}$ , alquenilo  $C_{3-8}$ , alquinilo  $C_{3-8}$ , cicloalquil( $C_{3-7}$ )alquilo( $C_{1-4}$ ), haloalquilo  $C_{2-8}$ , alcoxi( $C_{1-8}$ )alquilo( $C_{1-8}$ ), alcoxi( $C_{1-8}$ )carbonilo o  $R^{21}$  y  $R^{22}$  junto con el átomo de N al cual están unidos forman un anillo heterocíclico de cinco, seis o siete miembros que puede contener uno o dos heteroátomos adicionales seleccionados entre O, N o S y que puede estar opcionalmente sustituido con uno o dos grupos alquilo  $C_{1-8}$ , o dos grupos adyacentes  $R^4$  junto

con los átomos de carbono a los cuales están unidos forman un anillo heterocíclico o carbocíclico de cuatro, cinco, seis o siete miembros que puede estar opcionalmente sustituido con halógeno; n es 0, 1, 2, 3 o 4;

$R^a$  es alquilo opcionalmente sustituido, alquenilo opcionalmente sustituido, alquinilo opcionalmente sustituido, cicloalquilo opcionalmente sustituido, arilo opcionalmente sustituido, alcoxi opcionalmente sustituido, ariloxi opcionalmente sustituido, alcoxycarbonilo opcionalmente sustituido, alquilcarbonilo opcionalmente sustituido o alquenilcarbonilo opcionalmente sustituido;

cada  $R_a$  es independientemente halógeno, hidroxilo, ciano, alquilo  $C_{1-6}$  opcionalmente sustituido, alquenilo  $C_{2-6}$  opcionalmente sustituido, alquinilo  $C_{2-6}$  opcionalmente sustituido, alcoxycarbonilo opcionalmente sustituido, alquilcarbonilo opcionalmente sustituido, alquilaminocarbonilo opcionalmente sustituido, dialquilaminocarbonilo opcionalmente sustituido, cicloalquilo  $C_{3-7}$  opcionalmente sustituido, arilo opcionalmente sustituido, heteroarilo opcionalmente sustituido, heterociclilo opcionalmente sustituido, alcoxi opcionalmente sustituido, ariloxi opcionalmente sustituido, heteroariloxi opcionalmente sustituido, alquiltio opcionalmente sustituido, ariltio opcionalmente sustituido o  $R^{23}R^{24}N$  donde  $R^{23}$  y  $R^{24}$  son, independientemente, hidrógeno, alquilo  $C_{1-6}$ , cicloalquilo  $C_{3-7}$ , alquenilo  $C_{3-6}$ , alquinilo  $C_{3-6}$ , cicloalquil( $C_{3-7}$ )alquilo( $C_{1-4}$ ), haloalquilo  $C_{2-6}$ , alcoxi( $C_{1-6}$ )alquilo( $C_{1-6}$ ), alcoxi( $C_{1-6}$ )carbonilo o  $R^{23}$  y  $R^{24}$  junto con el átomo de N al cual están unidos forman un anillo heterocíclico de cinco, seis o siete miembros que puede contener uno o dos heteroátomos adicionales seleccionados entre O, N o S y que puede estar opcionalmente sustituido con uno o dos grupos alquilo  $C_{1-6}$ , o dos grupos  $R_a$  ligados al mismo átomo de carbono son  $=O$ ,  $=S$ ,  $=NR^b$ ,  $=CR^cR^d$  donde  $R^b$ ,  $R^c$  y  $R^d$  son independientemente H o alquilo opcionalmente sustituido, p es 0, 1, 2, 3 o 4 o sales o N-óxidos de los mismos

2 Un método de acuerdo con la reivindicación 1 donde el anillo



es un anillo aromático de seis miembros o es un anillo heteroaromático de cinco o seis miembros donde los miembros anulares son cada uno independientemente CH, S, N, NR<sup>4</sup>, O, o CR<sup>4</sup> siempre y cuando por lo menos un miembro anular no sea CH ni CR<sup>4</sup> y que no haya más de un átomo de O o S presente en el anillo

5                    3            Un método de acuerdo con la reivindicación 1 o la reivindicación 2 donde Y es un enlace simple, C=O o C=S

10                    4            Un método de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones precedentes donde R<sup>1</sup> es hidrógeno, alquilo C<sub>1-6</sub>, cianoalquilo C<sub>1-6</sub>, haloalquilo C<sub>1-6</sub>, cicloalquil(C<sub>3-7</sub>)alquilo(C<sub>1-4</sub>), alcoxi(C<sub>1-6</sub>)alquilo(C<sub>1-6</sub>), heteroarilalquilo C<sub>1-6</sub> (donde el grupo heteroarilo puede estar  
15                    opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, alquilo C<sub>1-6</sub>, haloalquilo C<sub>1-6</sub>, alcoxi C<sub>1-6</sub>, haloalcoxi C<sub>1-6</sub>, alquil(C<sub>1-6</sub>)sulfonilo, alquil(C<sub>1-6</sub>)sulfinilo, alquiltio C<sub>1-6</sub>, alcoxi(C<sub>1-6</sub>)carbonilo, alquil(C<sub>1-6</sub>)carbonilamino, arilcarbonilo, o dos posiciones adyacentes en el sistema heteroarilo pueden estar ciclizadas para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de cinco, seis o siete  
20                    miembros, él mismo opcionalmente sustituido con halógeno), arilalquilo C<sub>1-6</sub> (donde el grupo arilo puede estar opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, alquilo C<sub>1-6</sub>, haloalquilo C<sub>1-6</sub>, alcoxi C<sub>1-6</sub>, haloalcoxi C<sub>1-6</sub>, alquil(C<sub>1-6</sub>)sulfonilo, alquil(C<sub>1-6</sub>)sulfinilo, alquiltio C<sub>1-6</sub>, alcoxi(C<sub>1-6</sub>)carbonilo, alquil(C<sub>1-6</sub>)carbonilamino, arilcarbonilo, o dos posiciones adyacentes en el sistema arilo pueden estar ciclizadas para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de cinco, seis o siete miembros, él mismo opcionalmente sustituido con halógeno), alquil(C<sub>1-6</sub>)carbonilaminoalquilo(C<sub>1-6</sub>), anilo (que puede estar opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, alquilo C<sub>1-6</sub>, haloalquilo C<sub>1-6</sub>, alcoxi C<sub>1-6</sub>, haloalcoxi C<sub>1-6</sub>, alquil(C<sub>1-6</sub>)sulfonilo, alquil(C<sub>1-6</sub>)sulfinilo, alquiltio C<sub>1-6</sub>, alcoxi(C<sub>1-6</sub>)carbonilo, alquil(C<sub>1-6</sub>)carbonilamino, arilcarbonilo, o dos posiciones adyacentes en el sistema arilo pueden estar ciclizadas para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de cinco, seis o siete miembros, él mismo opcionalmente sustituido con halógeno), heteroarilo (que puede estar opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, alquilo C<sub>1-6</sub>, haloalquilo C<sub>1-6</sub>, alcoxi C<sub>1-6</sub>, haloalcoxi C<sub>1-6</sub>, alquil(C<sub>1-6</sub>)sulfonilo, alquil(C<sub>1-6</sub>)sulfinilo, alquiltio C<sub>1-6</sub>, alcoxi(C<sub>1-6</sub>)carbonilo, alquil(C<sub>1-6</sub>)carbonilamino, arilcarbonilo, o dos posiciones adyacentes en el sistema heteroarilo pueden estar ciclizadas para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de cinco, seis o siete miembros, él mismo opcionalmente sustituido con halógeno), alcoxi C<sub>1-6</sub>, haloalcoxi C<sub>1-6</sub>, fenoxi (donde el grupo fenilo está opcionalmente

sustituido con halógeno, alquilo C<sub>1-4</sub>, alcoxi C<sub>1-4</sub>, haloalquilo C<sub>1-4</sub>, haloalcoxi C<sub>1-4</sub>, CN, NO<sub>2</sub>, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino), heteroariloxi (opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, alquilo C<sub>1-6</sub>, haloalquilo C<sub>1-6</sub>, alcoxi C<sub>1-6</sub> o haloalcoxi C<sub>1-6</sub>), heterocicliloxi (opcionalmente sustituido con halo, alquilo C<sub>1-6</sub>, haloalquilo C<sub>1-6</sub>, alcoxi C<sub>1-6</sub> o haloalcoxi C<sub>1-6</sub>), ciano, alquenilo C<sub>2-6</sub>, alquinilo C<sub>2-6</sub>, cicloalquilo C<sub>3-6</sub>, cicloalquenilo C<sub>5-7</sub>, heterociclilo (opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, alquilo C<sub>1-6</sub>, haloalquilo C<sub>1-6</sub>, alcoxi C<sub>1-6</sub> o haloalcoxi C<sub>1-6</sub>), alquiltio C<sub>1-6</sub>, haloalquiltio C<sub>1-6</sub> o NR<sup>13</sup>R<sup>14</sup> donde R<sup>13</sup> y R<sup>14</sup> son independientemente hidrógeno, alquilo C<sub>1-6</sub>, haloalquilo C<sub>1-6</sub>, alcoxi(C<sub>1-6</sub>)alquilo(C<sub>1-6</sub>), fenilo (que puede estar opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo C<sub>1-4</sub>, alcoxi C<sub>1-4</sub>, haloalquilo C<sub>1-4</sub>, haloalcoxi C<sub>1-4</sub>, CN, NO<sub>2</sub>, arilo, heteroarilo, amino, dialquilamino o alcoxi(C<sub>1-4</sub>)carbonilo), fenilalquilo C<sub>1-6</sub> (donde el grupo fenilo puede estar opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo C<sub>1-4</sub>, alcoxi C<sub>1-4</sub>, haloalquilo C<sub>1-4</sub>, haloalcoxi C<sub>1-4</sub>, CN, NO<sub>2</sub>, arilo, heteroarilo, amino, dialquilamino, alquil(C<sub>1-6</sub>)sulfonilo, alcoxi(C<sub>1-6</sub>)carbonilo, o dos posiciones adyacentes en el anillo fenilo pueden estar ciclizadas para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de cinco, seis o siete miembros, él mismo opcionalmente sustituido con halógeno), heteroanlalquilo C<sub>1-6</sub> (donde el grupo heteroarilo puede estar opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, alquilo C<sub>1-6</sub>, haloalquilo C<sub>1-6</sub>, alcoxi C<sub>1-6</sub>, haloalcoxi C<sub>1-6</sub>, alquil(C<sub>1-6</sub>)sulfonilo, alquil(C<sub>1-6</sub>)sulfinilo, alquiltio C<sub>1-6</sub>, alcoxi(C<sub>1-6</sub>)carbonilo, alquil(C<sub>1-6</sub>)carbonilamino, arilcarbonilo, o dos posiciones adyacentes en el sistema heteroarilo pueden estar ciclizadas para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de cinco, seis o siete miembros, él mismo opcionalmente sustituido con halógeno) o heteroarilo (que puede estar opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, alquilo C<sub>1-6</sub>, haloalquilo C<sub>1-6</sub>, alcoxi C<sub>1-6</sub> o haloalcoxi C<sub>1-6</sub>, alcoxi(C<sub>1-4</sub>)carbonilalquil(C<sub>1-6</sub>)carbonilamino, feniloxycarbonilamino (donde el grupo fenilo está opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo C<sub>1-4</sub>, alcoxi C<sub>1-4</sub>, haloalquilo C<sub>1-4</sub>, haloalcoxi C<sub>1-4</sub>, CN, NO<sub>2</sub>, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino), amino, alquil(C<sub>1-6</sub>)amino o fenilamino (donde el grupo fenilo está opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo C<sub>1-4</sub>, alcoxi C<sub>1-4</sub>, haloalquilo C<sub>1-4</sub>, haloalcoxi C<sub>1-4</sub>, CN, NO<sub>2</sub>, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino))

5 Un método de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones precedentes donde R<sup>2</sup> es hidrógeno, hidroxil, alquilo C<sub>1-6</sub> o haloalquilo C<sub>1-6</sub>

6 Un método de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones precedentes donde cada R<sup>4</sup> es independientemente halógeno, ciano, alquilo C<sub>1-6</sub>, haloalquilo C<sub>1-6</sub>,

cianoalquilo C<sub>1-6</sub>, alcoxi(C<sub>1-6</sub>)alquilo(C<sub>1-6</sub>), cicloalquil(C<sub>3-7</sub>)alquilo(C<sub>1-6</sub>), cicloalquenil(C<sub>5-6</sub>)alquilo(C<sub>1-6</sub>), alqueniloxi(C<sub>3-6</sub>)alquilo(C<sub>1-6</sub>), alquiniloxi(C<sub>3-6</sub>)alquilo(C<sub>1-6</sub>), anloxialquilo C<sub>1-6</sub>, carboxialquilo C<sub>1-6</sub>, alquil(C<sub>1-6</sub>)carbonilalquilo(C<sub>1-6</sub>), alquenil(C<sub>2-6</sub>)carbonilalquilo(C<sub>1-6</sub>), alquinil(C<sub>2-6</sub>)carbonilalquilo(C<sub>1-6</sub>), alcoxi(C<sub>1-6</sub>)carbonilalquilo(C<sub>1-6</sub>), alqueniloxi(C<sub>3-6</sub>)carbonilalquilo(C<sub>1-6</sub>), alquiniloxi(C<sub>3-6</sub>)carbonilalquilo(C<sub>1-6</sub>), ariloxycarbonilalquilo C<sub>1-6</sub>, alquiltio(C<sub>1-6</sub>)alquilo(C<sub>1-6</sub>), alquil(C<sub>1-6</sub>)sulfinalquilo(C<sub>1-6</sub>), alquil(C<sub>1-6</sub>)sulfonilalquilo(C<sub>1-6</sub>), aminocarbonilalquilo C<sub>1-6</sub>, alquil(C<sub>1-6</sub>)aminocarbonilalquilo(C<sub>1-6</sub>), dialquil(C<sub>1-6</sub>)aminocarbonilalquilo(C<sub>1-6</sub>), fenilalquilo C<sub>1-4</sub> (donde el grupo fenilo está opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo C<sub>1-4</sub>, alcoxi C<sub>1-4</sub>, haloalquilo C<sub>1-4</sub>, haloalcoxi C<sub>1-4</sub>, CN, NO<sub>2</sub>, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino), heteroarilalquilo C<sub>1-4</sub> (donde el grupo heteroarilo está opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, alquilo C<sub>1-6</sub>, haloalquilo C<sub>1-6</sub>, alcoxi C<sub>1-6</sub> o haloalcoxi C<sub>1-6</sub>), heterociclilalquilo C<sub>1-4</sub> (donde el grupo heterociclilo está opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, alquilo C<sub>1-6</sub>, haloalquilo C<sub>1-6</sub>, alcoxi C<sub>1-6</sub> o haloalcoxi C<sub>1-6</sub>), alquenilo C<sub>2-6</sub>, aminocarbonilalquenilo C<sub>2-6</sub>, alquil(C<sub>1-6</sub>)aminocarbonilalquenilo(C<sub>2-6</sub>), dialquil(C<sub>1-6</sub>)aminocarbonilalquenilo(C<sub>2-6</sub>), fenilalquenilo C<sub>2-4</sub>, (donde el grupo fenilo está opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo C<sub>1-4</sub>, alcoxi C<sub>1-4</sub>, haloalquilo C<sub>1-4</sub>, haloalcoxi C<sub>1-4</sub>, CN, NO<sub>2</sub>, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino), alquinilo C<sub>2-6</sub>, trimetilsililalquinilo C<sub>2-6</sub>, aminocarbonilalquinilo C<sub>2-6</sub>, alquil(C<sub>1-6</sub>)aminocarbonilalquinilo(C<sub>2-6</sub>), dialquil(C<sub>1-6</sub>)aminocarbonilalquinilo(C<sub>2-6</sub>), alcoxi(C<sub>1-6</sub>)carbonilo, cicloalquilo C<sub>3-7</sub>, halocicloalquilo C<sub>3-7</sub>, cianocicloalquilo C<sub>3-7</sub>, alquil(C<sub>1-3</sub>)cicloalquilo(C<sub>3-7</sub>), alquil(C<sub>1-3</sub>)halocicloalquilo(C<sub>3-7</sub>), fenilo (opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo C<sub>1-4</sub>, alcoxi C<sub>1-4</sub>, haloalquilo C<sub>1-4</sub>, haloalcoxi C<sub>1-4</sub>, CN, NO<sub>2</sub>, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino), heteroarilo (opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, alquilo C<sub>1-6</sub>, haloalquilo C<sub>1-6</sub>, alcoxi C<sub>1-6</sub> o haloalcoxi C<sub>1-6</sub>), heterociclilo (donde el grupo heterociclilo está opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, alquilo C<sub>1-6</sub>, haloalquilo C<sub>1-6</sub>, alcoxi C<sub>1-6</sub> o haloalcoxi C<sub>1-6</sub>), o dos grupos adyacentes R<sup>4</sup> junto con los átomos de carbono a los cuales están unidos forman un anillo carbocíclico o heterocíclico de cuatro, cinco, seis o siete miembros que puede estar opcionalmente sustituido con halógeno, alcoxi C<sub>1-6</sub>, haloalcoxi C<sub>1-6</sub>, fenoxi (opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, alquilo C<sub>1-6</sub>, haloalquilo C<sub>1-6</sub>, alcoxi C<sub>1-6</sub> o haloalcoxi C<sub>1-6</sub>), heteroarloxí (opcionalmente sustituido con halo, nitro, ciano, alquilo C<sub>1-6</sub>, haloalquilo C<sub>1-6</sub>, alcoxi C<sub>1-6</sub> o haloalcoxi C<sub>1-6</sub>), alquiltio C<sub>1-6</sub> o R<sup>19</sup>R<sup>20</sup>N donde R<sup>19</sup> y R<sup>20</sup> son, independientemente, hidrógeno, alquilo C<sub>1-6</sub>, cicloalquilo C<sub>3-7</sub>, alquenilo C<sub>3-6</sub>, alquinilo

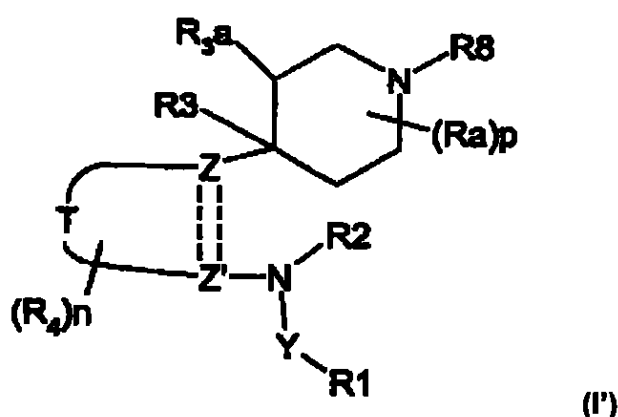
C<sub>3-6</sub>, haloalquilo C<sub>2-6</sub>, alcoxi(C<sub>1-6</sub>)carbonilo o R<sup>19</sup> y R<sup>20</sup> junto con el átomo de N al cual están unidos forman un anillo heterocíclico de cinco, seis o siete miembros que puede contener uno o dos heteroátomos adicionales seleccionados entre O, N o S y que puede estar opcionalmente sustituido con uno o dos grupos alquilo C<sub>1-6</sub>; n es 0, 1, 2 o 3

5                    7            Un método de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones precedentes donde R<sup>8</sup> es alquilo C<sub>1-10</sub>, haloalquilo C<sub>1-10</sub>, anilalquilo C<sub>1-6</sub> (donde el grupo arilo está opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo C<sub>1-4</sub>, alcoxi C<sub>1-4</sub>, haloalquilo C<sub>1-4</sub>, haloalcoxi C<sub>1-4</sub>, CN, NO<sub>2</sub>, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino), heteroarilalquilo C<sub>1-6</sub> (donde el grupo heteroarilo está opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo C<sub>1-4</sub>, alcoxi C<sub>1-4</sub>, haloalquilo C<sub>1-4</sub>, haloalcoxi C<sub>1-4</sub>, CN, NO<sub>2</sub>, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino), arilcarbonilalquilo C<sub>1-6</sub> (donde el grupo arilo puede estar opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo C<sub>1-4</sub>, alcoxi C<sub>1-4</sub>, haloalquilo C<sub>1-4</sub>, haloalcoxi C<sub>1-4</sub>, CN, NO<sub>2</sub>, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino y el grupo alquilo puede estar opcionalmente sustituido con arilo), alquenilo C<sub>2-6</sub>, haloalquenilo C<sub>2-6</sub>, arilalquenilo C<sub>2-6</sub> (donde el grupo arilo está opcionalmente sustituido halógeno, alquilo C<sub>1-4</sub>, alcoxi C<sub>1-4</sub>, haloalquilo C<sub>1-4</sub>, haloalcoxi C<sub>1-4</sub>, CN, NO<sub>2</sub>, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino, alcoxi(C<sub>1-6</sub>)carbonilo, o dos sustituyentes adyacentes pueden ciclizarse para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de cinco, seis o siete miembros), heteroarilalquenilo C<sub>2-6</sub> (donde el grupo heteroarilo está opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo C<sub>1-4</sub>, alcoxi C<sub>1-4</sub>, haloalquilo C<sub>1-4</sub>, haloalcoxi C<sub>1-4</sub>, CN, NO<sub>2</sub>, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino, alcoxi(C<sub>1-6</sub>)carbonilo, o dos sustituyentes adyacentes pueden ciclizarse para formar un anillo carbocíclico o heterocíclico de cinco, seis o siete miembros), alquínilo C<sub>2-6</sub>, fenilalquínilo C<sub>2-6</sub> (donde el grupo fenilo está opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo C<sub>1-4</sub>, alcoxi C<sub>1-4</sub>, haloalquilo C<sub>1-4</sub>, haloalcoxi C<sub>1-4</sub>, CN, NO<sub>2</sub>, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino), cicloalquilo C<sub>3-7</sub>, alcoxi(C<sub>1-6</sub>)carbonilo, alquil(C<sub>1-6</sub>)carbonilo, haloalquil(C<sub>1-6</sub>)carbonilo o arilalquénil(C<sub>2-6</sub>)carbonilo (donde el grupo arilo puede estar opcionalmente sustituido con halógeno, alquilo C<sub>1-4</sub>, alcoxi C<sub>1-4</sub>, haloalquilo C<sub>1-4</sub>, haloalcoxi C<sub>1-4</sub>, CN, NO<sub>2</sub>, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino), o - C(R<sup>51</sup>)(R<sup>52</sup>)-[CR<sup>53</sup>=CR<sup>54</sup>]<sub>z</sub>-R<sup>55</sup> donde z es 1 o 2, R<sup>51</sup> y R<sup>52</sup> son cada uno independientemente H, halo o alquilo C<sub>1-2</sub>, R<sup>53</sup> y R<sup>54</sup> son cada uno independientemente H, halógeno, alquilo C<sub>1-4</sub> o haloalquilo C<sub>1-4</sub> y R<sup>55</sup> es arilo opcionalmente sustituido o heteroarilo opcionalmente sustituido.

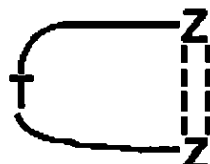
8 Un método de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones precedentes donde Ra es independientemente halo, ciano, alquilo C<sub>1-3</sub>, hidroxí o dos grupos Ra junto con el átomo de carbono al cual están unidos forman =O, =S, =NRb, =CRcRd donde Rb, Rc y Rd son independientemente H o alquilo opcionalmente sustituido, y p es 0, 1 o 2

5 9. Un método de acuerdo con cualquiera de las reivindicaciones precedentes donde R<sup>3</sup> es hidrógeno, hidroxí, halógeno, alquilo C<sub>1-8</sub> o haloalquilo C<sub>1-8</sub> y R<sup>3a</sup> es hidrógeno o R<sup>3</sup> y R<sup>3a</sup> juntos forman un doble enlace.

10 Un compuesto de Fórmula I'

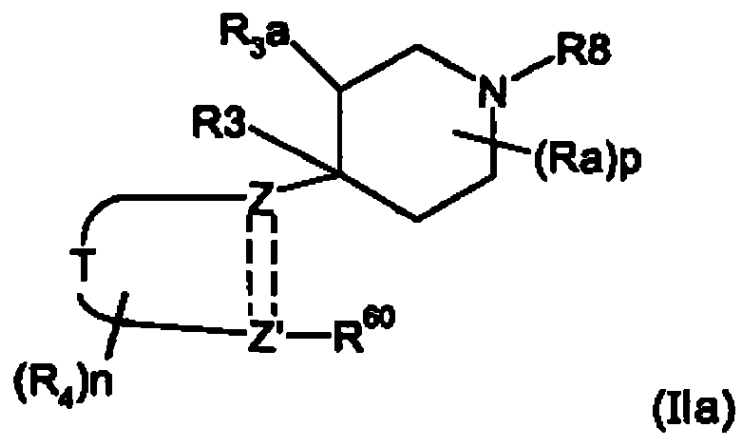


donde el anillo

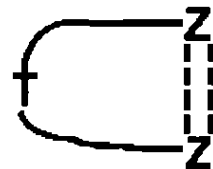


y R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>3a</sup>, R<sup>4</sup>, Ra, Y, n y p son como se definió para la Fórmula I en la reivindicación 1 y R<sup>8</sup> es -C(R<sup>51</sup>)(R<sup>52</sup>)-[CR<sup>53</sup>=CR<sup>54</sup>]<sub>z</sub>-R<sup>55</sup> donde z es 1 o 2, R<sup>51</sup> y R<sup>52</sup> son cada uno independientemente H o alquilo C<sub>1-2</sub>, R<sup>53</sup> y R<sup>54</sup> son cada uno independientemente H, halógeno, alquilo C<sub>1-4</sub> o haloalquilo C<sub>1-4</sub> y R<sup>55</sup> es fenilo sustituido con halógeno, alquilo C<sub>1-4</sub>, alcoxi C<sub>1-4</sub>, haloalquilo C<sub>1-4</sub>, haloalcoxi C<sub>1-4</sub>, CN, NO<sub>2</sub>, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino o heteroanillo sustituido con halógeno, alquilo C<sub>1-4</sub>, alcoxi C<sub>1-4</sub>, haloalquilo C<sub>1-4</sub>, haloalcoxi C<sub>1-4</sub>, CN, NO<sub>2</sub>, arilo, heteroarilo, amino o dialquilamino o sales o N-óxidos de los mismos

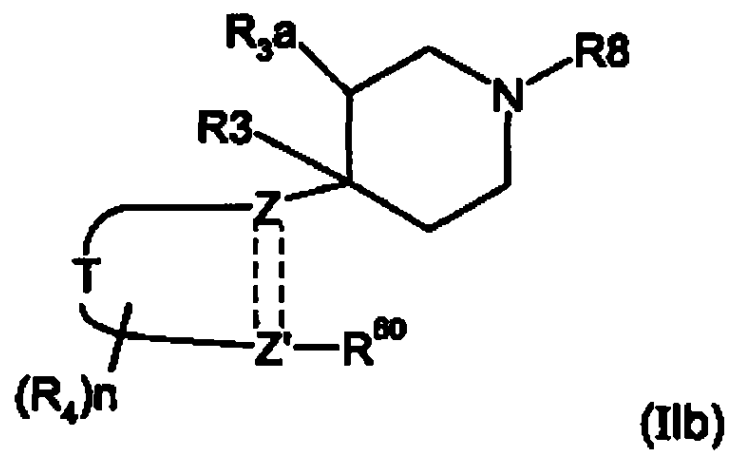
11 Un compuesto de Fórmula (IIa)



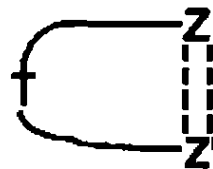
donde el anillo



- 5 y  $R^3$ ,  $R^{3a}$ ,  $R^4$ ,  $R^8$ ,  $Ra$ ,  $n$  y  $p$  son como se definió para la Fórmula I' en la reivindicación 10  
 y  $R^{60}$  es  $NH_2$ ,  $NO_2$  o halógeno, o  
 un compuesto de Fórmula (IIb)



donde el anillo

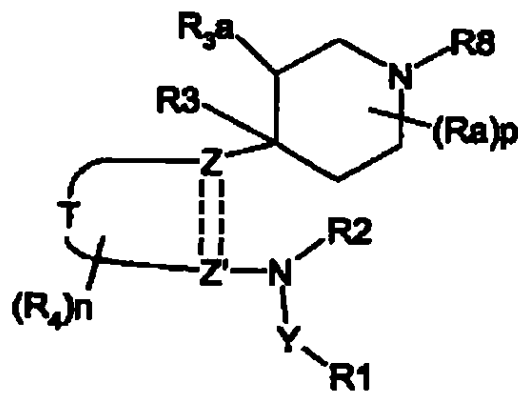


y  $R^4$ ,  $R^{60}$  y  $n$  son como se definió para la Fórmula IIa,  $R^3$  y  $R^{3a}$  son ambos H o juntos forman un enlace y  $R^8$  es metilo, bencilo o  $\text{COO-alquiloC}_{1-6}$  siempre y cuando el compuesto no sea tert-butilo 4-(2-aminofenil)piperidin-1-carboxilato o 2,4-diamino-5-(1-bencil-4-piperidinil)-pirimidina.

- 5                    12        Una composición insecticida, acaricida y nematocida que comprende una cantidad efectiva como insecticida, acaricida o nematocida de un compuesto de Fórmula I como se definió en la reivindicación 1

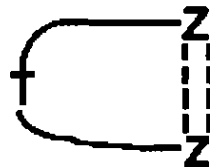
**RESUMEN**

El uso de un compuesto de Fórmula I



(I)

Y es un enlace simple, C=O, C=S o S(O)<sub>m</sub> donde m es 0, 1 o 2; el anillo



es un anillo aromático de seis miembros o es un anillo heteroaromático de cinco o seis miembros,

Z y Z' son =C- o -N- siempre y cuando ambos no sean N, R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>3a</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>8</sup> y Ra son grupos orgánicos específicos y n y p son independientemente 0, 1, 2, 3 o 4; o sales o N-óxidos de los mismos o composiciones que los contienen para controlar insectos, ácaros, nematodos o moluscos También se proporcionan compuestos novedosos

Rehro folios 196, 197 y 198 Farjetas



| Expediente No |                            | No de Folio |
|---------------|----------------------------|-------------|
| Item          | No de unidades             |             |
| 1             | CD                         | ✓           |
| 2             | DVD                        |             |
| 3             | REVISTA                    |             |
| 4             | LIBRO                      |             |
| 5             | PERIODICO                  |             |
| 6             | DISQUETES X                | ✓           |
| 7             | SOBRE DE MANILA            |             |
| 8             | SOBRE BLANCO TAMAÑO CARTA  |             |
| 9             | SOBRE BLANCO TAMAÑO OFICIO |             |
| 10            | OTROS.                     |             |

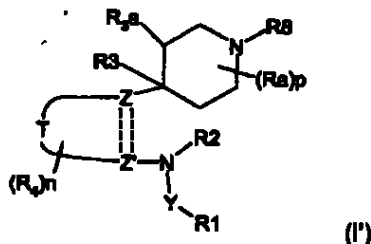
Observaciones:  
CONTIENE EL EXTRACTO PARA LA PUBLICACION Y LA SOLICITUD DE PATENTE PET

197 200

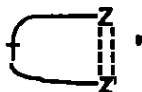
|                                                                                                                                                                                                              |  |                                                                                                                                                                                                                                                                        |  |
|--------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--|------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------------|--|
| <br><b>Industria y Comercio</b><br>SUPERINTENDENCIA                                                                         |  | <b>SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCIO</b><br><b>DIVISION DE NUEVAS CREACIONES</b><br>EXTRACTO PARA PUBLICACIÓN<br>SOLICITUD DE PATENTE DE INVENCION PCT                                                                                                          |  |
| (21) N° de solicitud <b>06 129 099</b><br>(22) Fecha de solicitud <b>26/12/2006</b><br>(30) Prioridad (31) No. Prioridad <b>0414438.2</b> (32) Fecha <b>28/06/2004</b> (33) País <b>GB</b>                   |  | (51) Int Cl:<br>(71) Solicitante(s) <b>SYNGENTA PARTICIPATIONS AG</b><br>(72) Inventor(es) <b>PETER MAIENFISCH, LOUIS-PIERRE MOLLEYRES, JEROME CASSAYRE, FREDRIK CEDER-BAUM, CAMILLA CORSI, THOMAS PITTERNA</b><br>(74) Apoderado <b>DRA. MARGARITA CASTELLANOS A.</b> |  |
| (85) Fecha limite inicio fase nacional:<br>(86) Datos relativos a la presentación de la solicitud PCT<br>Fecha de presentación de la solicitud <b>22/06/2005</b><br>No de solicitud <b>PCT/IB2005/002002</b> |  | (87) Publicación internacional<br>Fecha <b>12/01/2006</b><br>N° publicación. <b>WO 2006/003494</b>                                                                                                                                                                     |  |
| (54) Título <b>COMPUESTOS QUIMICOS</b>                                                                                                                                                                       |  |                                                                                                                                                                                                                                                                        |  |

Reivindicación(es):

Un compuesto de Fórmula I'

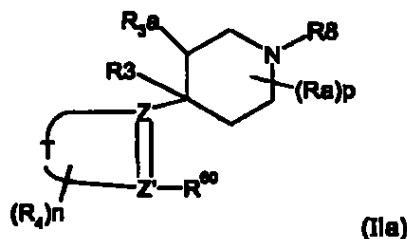


donde el anillo



y R<sup>1</sup>, R<sup>2</sup>, R<sup>3</sup>, R<sup>3a</sup>, R<sup>4</sup>, Ra, Y, n y p son como se definió para la Fórmula I en la reivindicación 1 y R<sup>8</sup> es -C(R<sup>51</sup>)(R<sup>52</sup>)-[CR<sup>53</sup>=CR<sup>54</sup>]-Z-R<sup>55</sup> donde z es 1 o 2, R<sup>51</sup> y R<sup>52</sup> son cada uno independientemente H o alquilo C<sub>1-2</sub>, R<sup>53</sup> y R<sup>54</sup> son cada uno independientemente H, halógeno, alquilo C<sub>1-4</sub> o haloalquilo C<sub>1-4</sub> y R<sup>55</sup> es fenilo sustituido con halógeno, alquilo C<sub>1-4</sub>, alcoxi C<sub>1-4</sub>, haloalquilo C<sub>1-4</sub>, haloalcoxi C<sub>1-4</sub>, CN, NO<sub>2</sub>, anilo, heteroanilo, amino o dialquilamino o heteroanilo sustituido con halógeno, alquilo C<sub>1-4</sub>, alcoxi C<sub>1-4</sub>, haloalquilo C<sub>1-4</sub>, haloalcoxi C<sub>1-4</sub>, CN, NO<sub>2</sub>, anilo, heteroanilo, amino o dialquilamino o sales o N-óxidos de los mismos

Un compuesto de Fórmula (IIa)

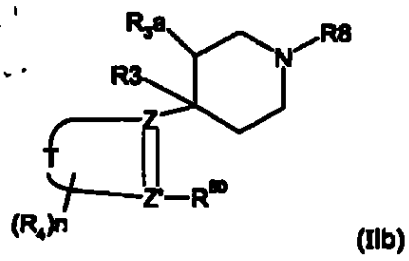


donde el anillo

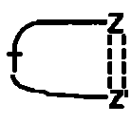


y R<sup>3</sup>, R<sup>3a</sup>, R<sup>4</sup>, R<sup>8</sup>, Ra, n y p son como se definió para la Fórmula I' en la reivindicación 10 y R<sup>60</sup> es NH<sub>2</sub>, NO<sub>2</sub> o halógeno; o un compuesto de Fórmula (IIb)

148 204



donde el anillo



y  $R^4$ ,  $R^{60}$  y  $n$  son como se definió para la Fórmula IIa,  $R^3$  y  $R^{3a}$  son ambos H o juntos forman un enlace y  $R^8$  es metilo, bencilo o  $\text{COO-}$  alquilo $\text{C}_{1-6}$  siempre y cuando el compuesto no sea *tert*-butilo 4-(2-aminofenil)piperidin-1-carboxilato o 2,4-diamino-5-(1-bencil-4-piperidinil)-pirimidina

## PATENT COOPERATION TREATY

199 202

PCT

From the INTERNATIONAL BUREAU

NOTIFICATION CONCERNING  
SUBMISSION OR TRANSMITTAL  
OF PRIORITY DOCUMENT

(PCT Administrative Instructions, Section 411)

To

WATERMAN, John, Richard  
Intellectual Property Department  
Syngenta Limited  
Jealott's Hill International  
Research Centre  
PO Box 3538  
Bracknell, Berks RG42 6YA  
United Kingdom

|                                                                      |                                                                         |
|----------------------------------------------------------------------|-------------------------------------------------------------------------|
| Date of mailing (day/month/year)<br>27 July 2005 (27.07.2005)        |                                                                         |
| Applicant's or agent's file reference<br>PPD70407/WO                 | IMPORTANT NOTIFICATION                                                  |
| International application No.<br>PCT/IB2005/002002                   | International filing date (day/month/year)<br>22 June 2005 (22.06.2005) |
| International publication date (day/month/year)<br>Not yet published | Priority date (day/month/year)<br>28 June 2004 (28.06.2004)             |
| Applicant<br>SYNGENTA PARTICIPATIONS AG et al                        |                                                                         |

1. By means of this Form, which replaces any previously issued notification concerning submission or transmittal of priority documents, the applicant is hereby notified of the date of receipt by the International Bureau of the priority document(s) relating to all earlier application(s) whose priority is claimed. Unless otherwise indicated by the letters "NR", in the right-hand column or by an asterisk appearing next to a date of receipt, the priority document concerned was submitted or transmitted to the International Bureau in compliance with Rule 17.1(a) or (b).
2. (If applicable) The letters "NR" appearing in the right-hand column denote a priority document which, on the date of mailing of this Form, had not yet been received by the International Bureau under Rule 17.1(a) or (b). Where, under Rule 17.1(a), the priority document must be submitted by the applicant to the receiving Office or the International Bureau, but the applicant fails to submit the priority document within the applicable time limit under that Rule, the attention of the applicant is directed to Rule 17.1(c) which provides that no designated Office may disregard the priority claim concerned before giving the applicant an opportunity, upon entry into the national phase, to furnish the priority document within a time limit which is reasonable under the circumstances.
3. (If applicable) An asterisk(\*) appearing next to a date of receipt, in the right-hand column, denotes a priority document submitted or transmitted to the International Bureau but not in compliance with Rule 17.1(a) or (b) (the priority document was received after the time limit prescribed in Rule 17.1(a) or the request to prepare and transmit the priority document was submitted to the receiving Office after the applicable time limit under Rule 17.1(b)). Even though the priority document was not furnished in compliance with Rule 17.1(a) or (b), the International Bureau will nevertheless transmit a copy of the document to the designated Offices, for their consideration. In case such a copy is not accepted by the designated Office as priority document, Rule 17.1(c) provides that no designated Office may disregard the priority claim concerned before giving the applicant an opportunity, upon entry into the national phase, to furnish the priority document within a time limit which is reasonable under the circumstances.

| Priority date             | Priority application No. | Country or regional Office<br>or PCT receiving Office | Date of receipt<br>of priority document |
|---------------------------|--------------------------|-------------------------------------------------------|-----------------------------------------|
| 28 June 2004 (28.06.2004) | 0414438.2                | GB                                                    | 22 June 2005 (22.06.2005)               |

|                                                                                               |                                                           |
|-----------------------------------------------------------------------------------------------|-----------------------------------------------------------|
| The International Bureau of WIPO<br>34, chemin des Colombettes<br>1211 Geneva 20, Switzerland | Authorized officer<br>Nadine GANDY (Fax : 4122 338 70 60) |
| Facsimile No. (41-22) 338.70.80                                                               | Telephone No. (41-22) 338 8679                            |

Delegatura de Propiedad Industrial  
División de Nuevas Creaciones

**REQUISITOS NECESARIOS PARA PRESENTACION Y AGILIZACION  
DEL TRÁMITE**

|                                                                                     | USUARIO | RADICADOR |
|-------------------------------------------------------------------------------------|---------|-----------|
| <b>PATENTE DE INVENCION ( X ) MODELO DE UTILIDAD ( )</b>                            | ( X )   | ( )       |
| - Indicación de que se solicita la concesión de una patente                         | ( X )   | ( )       |
| - Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud | ( X )   | ( )       |
| - Descripción de la invención                                                       | ( X )   | ( )       |
| - Dibujos de ser estos pertinentes                                                  | ( )     | ( )       |
| - Comprobante de pago de las tasas establecidas                                     | ( X )   | ( )       |

**COMPLETA ( ) INCOMPLETA ( X )**

**DISEÑO INDUSTRIAL ( )**

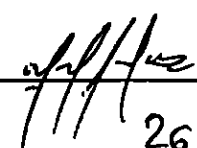
|                                                                                                             |     |     |
|-------------------------------------------------------------------------------------------------------------|-----|-----|
| - Indicación de que se solicita el registro de Diseño Industrial                                            | ( ) | ( ) |
| - Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud                         | ( ) | ( ) |
| - Representación gráfica y fotográfica del Diseño Industrial o muestra del material que incorpora el diseño | ( ) | ( ) |
| - Comprobante de pago de las tasas establecidas                                                             | ( ) | ( ) |

**COMPLETA ( ) INCOMPLETA ( )**

**EZQUEMA DE TRAZADO ( )**

|                                                                                     |     |     |
|-------------------------------------------------------------------------------------|-----|-----|
| - Indicación de que se solicita el registro de Diseño Industrial                    | ( ) | ( ) |
| - Datos de identificación del solicitante o de la persona que presenta la solicitud | ( ) | ( ) |
| - Representación gráfica del Esquema de Trazado                                     | ( ) | ( ) |
| - Comprobante de pago de las tasas establecidas                                     | ( ) | ( ) |

**COMPLETA ( ) INCOMPLETA ( )**

Firma responsable:   
Fecha 26 de Dic 2006

201

**REPUBLICA DE COLOMBIA**  
**SUPERINTENDENCIA DE INDUSTRIA Y COMERCI**

Bogotá,  
2020

Doctor(a)  
CASTELLANOS ABONDANO MARGARITA  
Apoderado(a) y/o Representante de  
SYNGENTA PARTICIPATIONS AG

|            |                            |                   |
|------------|----------------------------|-------------------|
| REFERENCIA | Radicación No.             | 06 129099         |
|            | Solicitud internacional    | PCT/IB2005/002002 |
|            | Fecha inicio fase nacional | 28/01/2007        |
|            | Trámite                    | 11                |
|            | Evento                     | 378               |
|            | Actuación                  | 430               |
|            | Oficio No.                 |                   |

. \* U J U . 1926

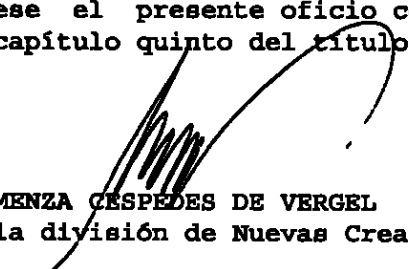
Como resultado del examen de forma, realizado con fundamento en el artículo 38 de la Decisión 486 de la Comisión de la Comunidad Andina, artículo 27 del Tratado de Cooperación en Materia de Patentes (PCT), regla 51 bis del Reglamento y Circular Única de la Superintendencia de Industria y Comercio, se le comunica que:

1. La solicitud no contiene la copia del documento en que consta la cesión del derecho a la patente del inventor al solicitante o a su causante. (Art. 26-k) Decisión 486.

2. El solicitante debe presentar un nuevo título que permita identificar la materia de la cual trata la solicitud, ya que el título relacionado no se encuentra con la precisión necesaria para identificar claramente el objeto de la solicitud de patente. (Regla 4.3 PCT, Art 26-27 D-486, Circular única 5.2.9)

En cumplimiento de lo dispuesto por el artículo 39 de la Decisión 486, se le requiere para que dentro del término de dos meses siguientes a la fecha de notificación del presente oficio, complete los requisitos anteriormente enunciados. En caso de no dar cumplimiento al presente requerimiento, la solicitud se considerará abandonada y perderá su prelación.

Notifíquese el presente oficio conforme a lo dispuesto en el numeral 5.2, literal e), del capítulo quinto del título primero de la Circular Unica No.10 de 2001.

  
ALIX CARMENZA CESPEDES DE VERGEL  
Jefe de la división de Nuevas Creaciones

El anterior requerimiento fue notificado por fijación en lista de fecha 09 FEB. 2007 lerazo