

COMPUESTOS BICÍCLICOS Y SU USO COMO AGENTES DE CONTROL DE PLAGAS

CAMPO DE LA INVENCION:

La presente invención descrita en el presente documento se refiere a compuestos bicíclicos nuevos, en particular la presente invención se refiere a los compuestos de fórmula (I), las composiciones que contienen estos compuestos y su uso como agentes de control de plagas. Además, la presente invención también se refiere a la preparación de estos compuestos bicíclicos nuevos y a productos intermedios útiles de estos.

ANTECEDENTES:

Se sabe, a partir de la técnica anterior, por ejemplo, de WO2018011111, WO2016071499, WO2015038503, WO2016087363, WO2016087368, WO2016087421 y WO2016087422 que determinados compuestos bicíclicos sustituidos muestran propiedades de control de plagas.

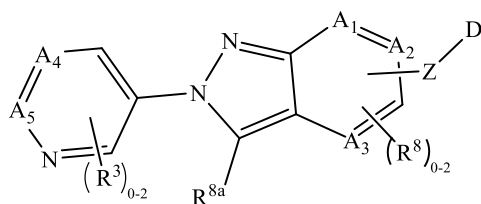
Los compuestos activos informados en la técnica anterior mencionados arriba tienen desventajas en determinados aspectos. Por ejemplo, muestran un espectro estrecho de la actividad plaguicida únicamente, no tienen eficacia de control de plagas satisfactoria en tasas de aplicación más bajas o no muestran la acción rápida deseada o una actividad duradera.

Por lo tanto, hay una necesidad constante de nuevos agentes de control de plagas con una actividad plaguicida mejorada, un espectro más amplio de eficacia, actividad más duradera, aumento de compatibilidad vegetal, mejor seguridad ambiental y mejores propiedades de formulación y también un menor riesgo de creación de resistencia.

SUMARIO:

La presente invención se refiere a compuestos bicíclicos nuevos que se ha descubierto que tienen efectos beneficiosos por encima de compuestos similares informados en la bibliografía, ya sea en términos de una mejor actividad de control de plagas, propiedades biológicas o ambientales más favorables, espectro más amplio de aplicación o compatibilidad vegetal mejorada.

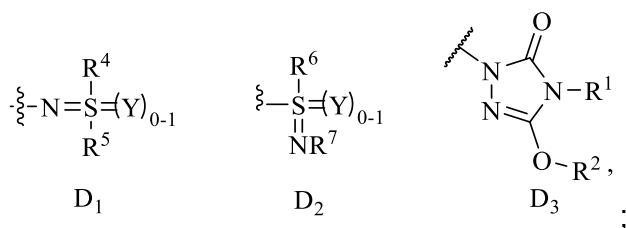
Los compuestos bicíclicos nuevos de la presente invención también pueden usarse en combinación con otros compuestos biológicamente activos, y así mejora la eficacia particularmente contra insectos que son difíciles de controlar. Por consiguiente, la presente invención proporciona compuestos bicíclicos nuevos de fórmula (I),



donde

Z se selecciona de un enlace directo o $-\text{C}(=\text{O})-$;

D se selecciona del grupo que consiste en D₁, D₂ y D₃



Y representa O o NR⁷;

A₁, A₂ y A₃ son independientemente C o N;

A₄ y A₅ son independientemente C o N, dado que A₄ y A₅ no pueden ser simultáneamente N;

R¹ se selecciona del grupo que consiste en alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, cicloalquil C₃-C₈-alquilo C₁-C₆, fenilo, bencilo, feniletilo y heterociclilo C₂-C₆;

R² se selecciona del grupo que consiste en alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, haloalquilo C₁-C₆ y cicloalquil C₃-C₈-alquilo C₁-C₆;

R³ se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆ y haloalquilo C₁-C₆;

R⁴ se selecciona del grupo que consiste en alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, cicloalquilo C₃-C₈-alquilo C₁-C₆ y -NR^cR^d;

R^c se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆ y cicloalquilo C₃-C₈;

R^d se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, cicloalquilo C₃-C₆-alquilo-C₁-C₄-;

o

Los sustituyentes R^c y R^d, junto con el átomo al que están unidos o junto con otros átomos seleccionados del grupo que consiste en C, N, O, C(=O), C(=S) y S(O)₀₋₂, pueden formar un anillo de 3 a 6 miembros, que puede sustituirse opcionalmente con uno o más sustituyentes seleccionados del grupo que consisten en halógeno, CN y alquilo C₁-C₆;

R⁵ se selecciona del grupo que consiste en alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, cicloalquilo C₃-C₈-alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, fenilo, bencilo y heterociclilo C₂-C₆;

o

Los sustituyentes R⁴ y R⁵, junto con el átomo al que están unidos o junto con otros átomos seleccionados del grupo que consiste en C, N, O, C(=O), C(=S) y S(O)₀₋₂, pueden formar un anillo de 3 a 6 miembros, que puede sustituirse opcionalmente con uno o más sustituyentes seleccionados del grupo que consisten en halógeno, CN y alquilo C₁-C₆;

R⁶ se selecciona del grupo que consiste en alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, cicloalquilo C₃-C₈-alquilo C₁-C₆, fenilo, bencilo, heterociclilo C₂-C₆ y -NR^cR^d;

R⁷ se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, ciano, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, alcoxi C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, cicloalquil C₃-C₈-alquilo C₁-C₆, fenilo, bencilo, heterociclilo C₂-C₆, heterociclil C₂-C₆-alquilo C₁-C₆, -COR⁵, -CONR^cR^d, SCF₃ y -SO₂R⁵;

R⁸ y R^{8a} se seleccionan independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo C₁-C₄ y haloalquilo C₁-C₄;

donde cada grupo alifático de R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ y R⁷ puede sustituirse opcionalmente con uno o más grupos de R^a; y los grupos cíclicos de R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ y R⁷ pueden sustituirse opcionalmente con uno más grupos de R^b, donde,

R^a se selecciona del grupo que consiste en halógeno, ciano, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, alcoxi C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, fenilo y heterociclilo C₂-C₆;

R^b se selecciona del grupo que consiste en halógeno, ciano, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, alquiltio C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆ y haloalcoxi C₁-C₆;

o sales, estereoisómeros, tautómeros, polimorfos, complejos metálicos o N-óxidos de estos.

En otra realización, la presente invención proporciona una composición que comprende el compuesto de fórmula (I), sus sales, complejos metálicos, estereoisómeros, polimorfos o N-óxidos de estos y al menos otro componente seleccionado del grupo que consiste en tensioactivos y auxiliares.

En aun otra realización, la presente invención proporciona una composición, donde dicha composición puede comprender, además, al menos otro compuesto biológico activo compatible seleccionado de fungicidas, insecticidas, nematocidas, acaricidas, bioplaguicidas, herbicidas, reguladores de crecimiento vegetal, bioestimulantes, antibióticos, fertilizantes o nutrientes.

En aun otra realización, la presente invención proporciona un método para la preparación de compuestos de fórmula (I).

Ahora se describirá la presente invención en detalles.

DESCRIPCIÓN DETALLADA DE LA INVENCION:

DEFINICIONES:

Las definiciones proporcionadas en el presente documento para las terminologías utilizadas en la presente divulgación tienen únicamente fines ilustrativos y no limitan en modo alguno el alcance de la presente invención divulgada en la presente divulgación.

Tal como se usan en el presente documento, los términos “comprende”, “que comprende”, “incluido”, “que incluye”, “tiene”, “que tienen”, “contiene”, “que contiene”, “caracterizado por” o cualquier otra variación de estos, están destinadas a cubrir una inclusión no exclusiva, sujeta a cualquier limitación indicada explícitamente. Por ejemplo, una composición, mezcla, proceso o método que comprende una lista de elementos no está necesariamente limitado solo a esos elementos, sino que puede incluir otros elementos no enumerados expresamente o inherentes a dicha composición, mezcla, proceso o método.

La frase de transición “consiste en” excluye cualquier elemento, paso o ingrediente no especificado. Si aparece en la reivindicación, esta se cerrará a la inclusión de materiales distintos de los enumerados, excepto las impurezas normalmente asociadas a estos. Cuando la frase “que consiste en” aparece en una cláusula del cuerpo de una reivindicación, en lugar de inmediatamente después del preámbulo, solo limita el elemento establecido en esa cláusula; los demás elementos no se excluyen de la reivindicación en su conjunto.

La frase de transición “que consiste esencialmente en” se utiliza para definir una composición o un método que incluye materiales, pasos, características, componentes o elementos, además de los descritos literalmente, siempre que estos materiales, pasos, características, componentes o elementos adicionales no afecten en lo material a las características básicas y novedosas de la invención reivindicada. El término “que consiste esencialmente en” ocupa un término medio entre “que comprende” y “que consiste en”.

Además, a menos que se indique expresamente lo contrario, “o” se refiere a un “o” inclusivo o a un “o” exclusivo. Por ejemplo, una condición A “o” B se satisface con una cualquiera de las siguientes: A es verdadera (o está presente) y B es

falsa (o no está presente), A es falsa (o no está presente) y B es verdadera (o está presente), y ambas, A y B, son verdaderas (o están presentes).

Además, los artículos indefinidos “un” y “una” que preceden a un elemento o componente de la presente invención están pensados para no restringir el número de instancias (es decir, apariciones) del elemento o componente. Por lo tanto, “un” o “una” debe entenderse que incluye uno o al menos uno y la forma verbal singular del elemento o componente también incluye el plural a menos que el número esté obviamente destinado a ser singular.

Según se refiere en esta divulgación, el término “plaga de invertebrados” o “invertebrados” incluye artrópodos, gastrópodos y nemátodos de importancia económica como plagas. El término “artrópodo” incluye insectos, ácaros, arañas, escorpiones, ciempiés, milpiés, bichos de bola y sinfilos. El término “gastrópodo” incluye caracoles, babosas y otros estilomatóforos. El término “nemátodo” se refiere a un organismo vivo de Phylum Nematoda. El término “helmintos” incluye ascáride, dirofilariasis, nemátodos fitófagosos (Nematoda), trematodos (Tematoda), acantocéfalos y tenias (Cestoda).

En el contexto de la presente divulgación, por “control de plagas de invertebrados” se entiende la inhibición de la aparición de plagas de invertebrados (incluida la mortalidad, la reducción de alimentos y/o la interrupción de apareamiento) y las expresiones relacionadas se definen de forma análoga.

El término “agronómico” se refiere a la producción de cultivos de campo tales como para alimentos, piensos y fibras e incluye el cultivo de maíz, soja y otras leguminosas, arroz, cereales (p. ej., trigo, avena, cebada, centeno, arroz, maíz), hortalizas de hoja (p. ej., lechuga, col y otros cultivos de vegetales), hortalizas de fruto (p. ej., tomates, pimientos, berenjenas, crucíferas y cucurbitáceas), papas, batatas, uvas, algodón, frutas de árbol (p. ej., frutas pomáceas, de hueso y cítricos), frutas pequeñas (frutos del bosque, cerezas) y otros cultivos especializados (p. ej., colza, girasol, aceitunas).

El término “no agronómico” se refiere aplicaciones de cultivos distintos de los de campo, tales como cultivos hortícolas (p. ej., plantas de invernadero, vivero u ornamentales que no se cultivan en un campo), estructuras residenciales, agrícolas, comerciales e industriales, césped (p. ej., granjas de césped, pastos, campos de golf, pasto, campos deportivos, etc.), productos de madera, productos almacenados, gestión agroforestal y de la vegetación, salud pública (es decir, humana) y salud animal (p. ej., animales domesticados tales como mascotas, ganado y aves de corral, animales no domesticados tal como la fauna silvestre)

Las aplicaciones no agronómicas incluyen la protección de un animal frente a una plaga parásita de invertebrados mediante la administración de una cantidad parásita eficaz (es decir, biológicamente eficaz) de un compuesto de la presente invención, normalmente en forma de una composición formulada para uso veterinario, al animal que se desea proteger. Como se menciona en la presente divulgación y en las reivindicaciones, los términos “parásito” y “de forma parásita” se refiere a los efectos observables en las plagas de parásitos invertebrados para proporcionar protección de un animal contra la plaga. Los efectos parásitos se refieren típicamente a la disminución de la aparición o actividad de la plaga de parásitos invertebrados objetivo. Dichos efectos en la plaga incluyen muerte, crecimiento retardado, disminución de la movilidad o disminución de la capacidad para permanecer en el animal hospedador, reducción del alimento o la inhibición de la reproducción. Estos efectos sobre las plagas de parásitos invertebrados proporcionan control (incluida prevención, reducción o eliminación) de la infestación o infección parásita del animal.

Los compuestos de la presente divulgación pueden estar presentes en forma pura o como mezclas de diferentes formas isoméricas posibles tales como estereoisómeros o isómeros constitucionales. Los varios estereoisómeros incluyen enantiómeros, diastereómeros, isómeros quirales, atropisómeros, conformadores, rotámeros, tautómeros, isómeros ópticos, polimorfos e isómeros geométricos. Cualquiera de las mezclas deseadas de estos isómeros entran

dentro del alcance de las reivindicaciones de la presente divulgación. Un experto en la materia apreciará que un estereoisómero puede ser más activo y/o puede mostrar efectos beneficiosos cuando se enriquece en relación con otros isómeros o cuando se separa de otros isómeros. Adicionalmente, el experto en la materia conoce procesos o métodos o tecnología para separar, enriquecer y/o preparar de forma selectiva dichos isómeros.

A continuación, se ilustrará el significado de varios términos utilizados en la descripción.

El término “alquilo”, utilizado solo o en palabras compuestas tales como “alquiltio” o “haloalquilo” o -N(alquilo) o alquilcarbonilalquilo o alquilsulfonilamino incluye alquilo C₁ a C₁₂ de cadena lineal o ramificada, preferentemente alquilo C₁ a C₈, más preferentemente alquilo C₁ a C₆. Los ejemplos representativos de alquilo incluyen metilo, etilo, propilo, 1-metiletilo, butilo, 1-metilpropilo, 2-metilpropilo, 1,1-dimetiletilo, pentilo, 1-metilbutilo, 2-metilbutilo, 3-metilbutilo, 2,2-dimetilpropilo, 1-etilpropilo, hexilo, 1,1-dimetilpropilo, 1,2-dimetilpropilo, 1,2,2-trimetilpropilo, 1-etil-1-metilpropilo y l-etil-2-metilpropilo o los diferentes isómeros. Si el alquilo está en el extremo de un sustituyente compuesto, como, por ejemplo, en el alquilcicloalquilo, la parte del sustituyente compuesto al principio, por ejemplo, el cicloalquilo, puede estar mono o polisustituido idéntica o diferentemente e independientemente por alquilo. Lo mismo se aplica a los sustituyentes compuestos en los que otros radicales, por ejemplo, alquenilo, alquinilo, hidroxilo, halógeno, carbonilo, carboniloxi y similares, están en el extremo.

El término “alquenilo”, utilizado solo o en palabras compuestas incluye alquenos de cadena recta o ramificada de C₂ a C₁₂, preferentemente alquenos C₂ a C₈, más preferentemente alquenos C₂ a C₆. Los ejemplos representativos de alquenos incluyen etenilo, 1-propenilo, 2-propenilo, 1-metiletlenilo, 1-butenilo, 2-butenilo, 3-butenilo, 1-metilo-1-propenilo, 2-metilo-l-propenilo, l-metilo-2-propenilo, 2-metilo-2-propenilo, 1-pentenilo, 2-pentenilo, 3-pentenilo, 4-pentenilo, 1-metilo-1-butenilo, 2-metilo-1-butenilo, 3-metilo-1-butenilo, l-metilo-2-

butenilo, 2-metilo-2-butenilo, 3-metilo-2-butenilo, l-metilo-3-butenilo, 2-metilo-3-butenilo, 3-metilo-3-butenilo, 1,1-dimetilo-2-propenilo, 1,2-dimetilo-1-propenilo, 1,2-dimetilo-2-propenilo, 1-etilo-1-propenilo, l-etilo-2-propenilo, 1-hexenilo, 2-hexenilo, 3-hexenilo, 4-hexenilo, 5-hexenilo, 1-metilo-1-pentenilo, 2-metilo-1-pentenil, 1,2-trimetilo-2-propenilo, 1-etilo-l-metilo-2-propenilo, l-etilo-2-metilo-l-propenilo y l-etilo-2-metilo-2-propenilo y los diferentes isómeros. “Alquenilo” también incluye polienos tales como el 1,2-propadienilo y el 2,4-hexadienilo. Esta definición también se aplica al alquenilo como parte de un sustituyente compuesto, por ejemplo, haloalquenilo y similares, a menos que se defina específicamente en otra parte.

Los ejemplos no limitantes de alquinos incluyen etinilo, 1-propinilo, 2-propinilo, 1-butinilo, 2-butinilo, 3-butinilo, 1-metil-2-propinilo, 1-pentinilo, 2-pentinilo, 3-pentinilo, 4-pentinilo, l-metil-2-butinilo, l-metil-3-butinilo, 2-metil-3-butinilo, 3-metil-l-butinilo, 1,1-dimetil-2-propinilo, 1-etil-2-propinilo, 1-hexinilo, 2-hexinilo, 3-hexinilo, 4-hexinilo, 5-hexinilo, 1-metil-2-pentinilo, l-metil-3-pentinilo, 1-metil-4-pentinilo, 2-metil-3-pentinilo, 2-metil-4-pentinilo, 3-metil-l-pentinilo, 3-metil-4-pentinilo, 4-metil-l-pentinilo, 4-metil-2-pentinilo, 1,1-dimetil-2-butinilo, l,l-dimetil-3-butinilo, l,2-dimetil-3-butinilo, 2,2-dimetil-3-butinilo, 3,3-dimetil-l-butinilo, l-etil-2-butinilo, l-etil-3-butinilo, 2-etil-3-butinilo y 1-etil-l-metil-2-propinilo y los diferentes isómeros. Esta definición también se aplica al alquinilo como parte de un sustituyente compuesto, por ejemplo, haloalquinilo, etc., a menos que se defina específicamente en otra parte. El término “alquinilo” también puede incluir porciones que, comprendidas por múltiples enlaces triples, tal como el 2,5-hexadiinilo.

El término “cicloalquilo” significa alquilo cerrado para formar un anillo. Los ejemplos no limitantes incluyen ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo y cicloheptilo. Esta definición también se aplica al cicloalquilo como parte de un sustituyente compuesto, por ejemplo, cicloalquilo, etc., a menos que se defina específicamente en otra parte.

Los términos “cicloalcoxi”, “cicloalquiloxi” y similares se definen de forma análoga. Los ejemplos no limitantes de cicloalcoxi incluyen ciclopropiloxi, ciclopentiloxi y ciclohexiloxi. Esta definición también se aplica al cicloalcoxi como parte de un sustituyente compuesto, por ejemplo, cicloalcoxi alquilo, etc., a menos que se defina específicamente en otra parte.

El término “halógeno”, solo o en palabras compuestas tales como “haloalquilo”, incluye flúor, cloro, bromo o yodo. Además, cuando se utiliza en palabras compuestas como “haloalquilo”, dicho alquilo puede estar parcial o totalmente sustituido con átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes. Los ejemplos no limitantes de “haloalquilo” incluyen clorometilo, bromometilo, diclorometilo, triclorometilo, fluorometilo, difluorometilo, trifluorometilo, clorofluorometilo, diclorofluorometilo, clorodifluorometilo, 1-cloroetilo, 1-bromoetilo, 1-fluoroetilo, 2-fluoroetilo, 2,2-difluoroetilo, 2,2,2-trifluoroetilo, 2-cloro-2-fluoroetilo, 2-cloro-2,2-difluoroetilo, 2,2-dicloro-2-fluoroetilo, 2,2,2-tricloroetilo, pentafluoroetilo, 1,1-dicloro-2,2,2-trifluoroetilo y 1,1,1-trifluoroprop-2-ilo. Esta definición también se aplica al haloalquilo como parte de un sustituyente compuesto, por ejemplo, haloalquilaminoalquilo, etc., a menos que se defina específicamente en otra parte.

Los términos “haloalqueno”, “haloalquino” se definen de forma análoga, salvo que, en lugar de grupos alquilo, están presentes grupos alqueno y alquino como parte del sustituyente.

El término “haloalcoxi” se refiere a grupos alcoxi de cadena recta o ramificada donde algunos o todos los átomos de hidrógeno de estos grupos pueden sustituirse por átomos de halógeno, tal como se ha especificado anteriormente. Los ejemplos no limitantes de haloalcoxi incluyen clorometoxi, bromometoxi, diclorometoxi, triclorometoxi, fluorometoxi, difluorometoxi, trifluorometoxi, clorofluorometoxi, diclorofluorometoxi, clorodifluorometoxi, 1-cloroetoxi, 1-bromoetoxi, 1-fluoroetoxi, 2-fluoroetoxi, 2,2-difluoroetoxi, 2,2,2-trifluoroetoxi, 2-cloro-2-fluoroetoxi, 2-cloro-2,2-difluoroetoxi, 2,2-dicloro-2-fluoroetoxi, 2,2,2-tricloroetoxi, pentafluoroetoxi y 1,1,1-trifluoroprop-2-oxi. Esta definición también se

aplica al haloalcoxi como parte de un sustituyente compuesto, por ejemplo, haloalcoxialquilo, etc., a menos que se defina específicamente en otra parte.

El término “haloalquiltio” se refiere a grupos alquiltio de cadena recta o ramificada donde algunos o todos los átomos de hidrógeno de estos grupos pueden sustituirse por átomos de halógeno, tal como se ha especificado anteriormente. Los ejemplos no limitantes de haloalquiltio incluyen clorometiltio, bromometiltio, diclorometiltio, triclorometiltio, fluorometiltio, difluorometiltio, trifluorometiltio, clorofluorometiltio, diclorofluorometiltio, chlorodifluorometiltio, 1-cloroetiltio, 1-bromoetiltio, 1-fluoroetiltio, 2-fluoroetiltio, 2,2-difluoroetiltio, 2,2,2-trifluoroetiltio, 2-cloro-2-fluoroetiltio, 2-cloro-2,2-difluoroetiltio, 2,2-dicloro-2-fluoroetiltio, 2,2,2-tricloroetiltio, pentafluoroetiltio y I,I,I-trifluoroprop-2-iltio. Esta definición también se aplica al haloalquiltio como parte de un sustituyente compuesto, por ejemplo, haloalquiltioalquilo, etc., a menos que se defina específicamente en otra parte.

El término “hidroxi” significa -OH , amino significa -NRR , donde R puede ser H o cualquier sustituyente posible tal como alquilo. Carbonilo significa -C(O)- , carboniloxi significa -OC(O)- , sulfinilo significa SO , sulfonilo significa S(O)_2 .

El término “alcoxi” usado solo o en palabras compuestas incluye alcoxi C_1 a C_{12} , preferentemente alcoxi C_1 a C_8 , más preferentemente alcoxi C_1 a C_6 . Ejemplos de alcoxi incluyen metoxi, etoxi, propoxi, 1-metiletoxi, butoxi, 1-metilpropoxi, 2-metilpropoxi, 1,1-dimetiletoxi, pentoxi, 1-metilbutoxi, 2-metilbutoxi, 3-metilbutoxi, 2,2-dimetilpropoxi, 1-etilpropoxi, hexoxi, 1,1-dimetilpropoxi, 1,2-dimetilpropoxi, 1-metilpentoxi, 2-metilpentoxi, 3-metilpentoxi, 4-metilpentoxi, 1,1-dimetilbutoxi, 1,2-dimetilbutoxi, 1,3-dimetilbutoxi, 2,2-dimetilbutoxi, 2,3-dimetilbutoxi, 3,3-dimetilbutoxi, 1-etilbutoxi, 2-etilbutoxi, 1,1,2-trimetilpropoxi, 1,2,2-trimetilpropoxi, 1-etil-1-metilpropoxi y 1-etil-2-metilpropoxi y los diferentes isómeros. Esta definición también se aplica al alcoxi como parte de un sustituyente compuesto, por ejemplo, haloalcoxi, alquinilalcoxi, etc., a menos que se defina específicamente en otra parte.

El término “alcoxialquil” denota sustitución de alcoxi en alquilo. Algunos ejemplos no limitantes de “alcoxialquilo” incluyen CH_3OCH_2 , $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2$ y $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2$.

El término “alquiltio” incluye fracciones de alquiltio ramificadas o de cadena recta tales como metiltio, etiltio, propiltio, 1-metiletiltio, butiltio, 1-metilpropiltio, 2-metilpropiltio, 1,1-dimetiletiltio, pentiltio, 1-metilbutiltio, 2-metilbutiltio, 3-metilbutiltio, 2,2-dimetilpropiltio, 1-etilpropiltio, hexiltio, 1,1-dimetilpropiltio, 1,2-dimetilpropiltio, 1-metilpentiltio, 2-metilpentiltio, 3-metilpentiltio, 4-metilpentiltio, 1,1-dimetilbutiltio, 1,2-dimetilbutiltio, 1,3-dimetilbutiltio, 2,2-dimetilbutiltio, 2,3-dimetilbutiltio, 3,3-dimetilbutiltio, 1-etilbutiltio, 2-etilbutiltio, 1,1,2-trimetilpropiltio, 1,2,2-trimetilpropiltio, 1-etil-1-metilpropiltio y 1-etil-2-metilpropiltio y sus diferentes isómeros.

El halocicloalquilo, halocicloalquenilo, alquilocicloalquilo, cicloalquilalquilo, cicloalcoxialquilo, alquilsulfonilalquilo, alquilsulfonilalquilo, haloalquilcarbonilo, cicloalquilcarbonilo, haloalcoxilalquilo y similares, se definen de forma análoga a los ejemplos anteriores.

“Alquilamino”, “dialquilamino” y similares se definen de forma análoga a los ejemplos anteriores.

El término “carbociclo” incluye un “sistema de anillos carbocíclicos aromáticos” y un “sistema de anillos carbocíclicos no aromáticos” o compuestos de anillos policíclicos o bicíclicos (espiro, fusionados, en puente, no fusionados) en los que el anillo puede ser aromático o no aromático (donde aromático indica que se cumple la regla de Hueckel y no aromático indica que no se cumple la regla de Hueckel).

El término “hetero” en conexión con anillos refiere a un anillo en el que al menos un átomo de anillo no es carbono y que puede contener de 1 a 4 heteroátomos independientemente seleccionados del grupo que consiste en nitrógeno, oxígeno y azufre, siempre que cada anillo contenga no más de 4 nitrógenos, no más de 2 oxígenos y no más de 2 azufres.

El término “heterociclilo o heterocíclico” incluye “sistema de anillos heterociclo o heteroarilo aromático” y “sistema de anillos heterociclo no aromático” o compuestos de anillos policíclicos o bicíclicos (espiro, fusionados, en puente, no fusionados) donde el anillo puede ser aromático o no aromático, en los que el anillo heterociclo contiene al menos un heteroátomo seleccionado entre N, O, S(O)₀₋₂₀ o el miembro C del anillo del heterociclo puede estar sustituido por un heteroátomo y opcionalmente por C(=O), C(=S), C(=CR^{*}R^{*}) y C=NR^{*}, * indica números enteros.

El término “heterociclo no aromático” o “heterocíclico no aromático” significa a de tres a quince miembros, preferentemente tres a diez miembros, heterociclo saturado o parcialmente insaturado que contiene de uno a cuatro heteroátomos del grupo de oxígeno, nitrógeno y azufre: heterociclos mono, bi- o tricíclicos que contienen, además de miembros de anillo de carbono, uno a tres átomos de nitrógeno y/o un átomo de oxígeno o azufre o uno o dos átomos de oxígeno y/o azufre; si el anillo contiene más de un átomo de oxígeno, no están directamente adyacentes; por ejemplo (pero sin limitación) oxetanilo, oxiranilo, aziridinilo, tietanilo, tetrahidrofurano, tetrahidrotienilo, pirrolidinilo, isoxazolidinilo, isotiazolidinilo, pirazolidinilo, oxazolidinilo, tiazolidinilo, imidazolidinilo, 1,2,4-oxadiazolidinilo, 1,2,4-tiadiazolidinilo, 1,2,4-triazolidin-1-ilo, 1,2,4-triazolidin-3-ilo, 1,2,3-triazolidinilo, 1,3,4-oxadiazolidinilo, 1,3,4-tiadiazolidinilo, 1,3,4-triazolidinilo, dihidrofurilo, dihidrotienilo, pirrolinilo, isoxazolinilo, isotiazolinilo, dihidropirazolilo, dihidrooxazolilo, dihidrotiazolilo, piperidinilo, pirazinilo, morfolinilo, tiomorphlinilo, 1,3-dioxan-5-ilo, tetrahidropiranilo, tetrahidrotienilo, hexahidropiridazinilo, hexahidropirimidinilo, piperazinilo y cicloserinas. Esta definición también se aplica al heterociclilo como parte de un sustituyente compuesto, por ejemplo heterociclilalquilo, etc., a menos que se defina específicamente en otra parte.

El término “heteroarilo” o “heterocíclico aromático” significa sistemas de anillo monocíclico completamente insaturados de 5 o 6 miembros que contienen de uno a cuatro heteroátomos del grupo de oxígeno, nitrógeno y azufre; si el anillo contiene más de un átomo de oxígeno, no se encuentran directamente

adyacentes; heteroarilo de 5 miembros que contiene de uno a cuatro átomos de nitrógeno o uno a tres átomos de nitrógeno y un átomo de azufre u oxígeno: grupos de 5 miembros que, además de los átomos de carbono, pueden contener de uno a cuatro átomos de nitrógeno o uno a tres átomos de nitrógeno y un átomo de azufre u oxígeno como miembros de anillo, por ejemplo (pero sin limitación) furilo, tienilo, pirrolilo, isoxazolilo, isotiazolilo, pirazolilo, oxazolilo, tiazolilo, imidazolilo, 1,2,4-oxadiazolilo, 1,2,4-tiadiazolilo, 1,2,4-triazolilo, 1,3,4-oxadiazolilo, 1,3,4-tiadiazolilo, 1,3,4-triazolilo, tetrazolilo; heteroarilo de 5 miembros enlazados a nitrógeno que contiene de uno a cuatro átomos de nitrógeno o heteroarilo de 5 miembros enlazados con nitrógeno benzofusionado que contiene de uno a tres átomos de nitrógeno: grupos heteroarilo de 5 miembros que, además de átomos de carbono, pueden contener de uno a cuatro átomos de nitrógeno o de uno a tres átomos de nitrógeno como miembros del anillo y en los que dos miembros del anillo de carbono adyacentes o un miembro del anillo de nitrógeno y uno del anillo de carbono adyacentes pueden estar formados por un grupo buta-1,3-dieno-1,4-diilo en el que uno o dos átomos de carbono pueden sustituirse por átomos de nitrógeno, donde estos anillos están unidos al esqueleto a través de uno de los miembros del anillo de nitrógeno, por ejemplo (pero sin limitación) son 1-pirrolilo, 1-pirazolilo, 1,2,4-triazol-1-ilo, 1-imidazolilo, 1,2,3-triazol-1-ilo y 1,3,4-triazol-1-ilo.

Heteroarilo de 6 miembros que contiene de uno a cuatro átomos de nitrógeno: grupos de heteroarilo de 6 miembros que, además de átomos de carbono, pueden contener, respectivamente, uno a tres y uno a cuatro átomos de nitrógeno como miembros de anillo, por ejemplo (a mero título enunciativo) piridinilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, 1,3,5-triazin-2-ilo, 1,2,4-triazin-3-ilo y 1,2,4,5-tetrazin-3-ilo; heteroarilo benzofusionado de 5 miembros que contiene de uno a tres átomos de nitrógeno o un átomo de nitrógeno y un átomo de oxígeno o azufre: por ejemplo (a mero título enunciativo) indolilo, benzimidazolilo, indazolilo, benzofuranilo, benzotiofenilo, benzotiazolilo y benzoxazolilo; heteroarilo benzofusionado de 6 miembros que contiene uno a tres átomos de

nitrógeno: por ejemplo (a mero título enunciativo) quinolinilo, isoquinolinilo, quinoxalinilo, ftalazinilo, quinazolinilo y cinnolinilo.

El término “heterociclos parcial/completamente saturados o insaturados” incluyen heterociclos parcial/completamente saturados o heterociclos parcial/completamente insaturados.

Esta definición también se aplica al heteroarilo como parte de un sustituyente compuesto, por ejemplo heteroarilalquilo, etc., a menos que se defina específicamente en otra parte.

Ejemplos no limitativos de “alquilcarbonilo” incluyen $C(O)CH_3$, $C(=O)CH_2CH_2CH_3$ y $C(=O)CH(CH_3)_2$. Ejemplos no limitativos de “alcoxicarbonilo” incluyen $CH_3OC(=O)$, $CH_3CH_2OC(=O)$, $CH_3CH_2CH_2OC(=O)$, $(CH_3)_2CHOC(=O)$ y los diferentes isómeros butoxi -o pentoxicarbonilo.

El término “amida” significa $A-R'C=ONR''-B$, donde R' y R'' indican sustituyentes y A y B indican cualquier grupo.

El término “tioamida” significa $A-R'C=SNR''-B$, donde R' y R'' indican sustituyentes y A y B indican cualquier grupo.

El número total de átomos de carbono de un grupo sustituyente se indica mediante el prefijo “ C_i-C_j ”, donde i y j son números del 1 al 18. Por ejemplo, C_1-C_3 alquilsulfonilo designa del metilsulfonilo al propilsulfonilo; alcoxialquilo C_2 designa CH_3OCH_2 ; alcoxialquilo C_3 designa, por ejemplo, $CH_3CH(OCH_3)$, $CH_3OCH_2CH_2$ o $CH_3CH_2OCH_2$; y alcoxialquilo C_4 designa los diversos isómeros de un grupo alquilo sustituido con un grupo alcoxi que contiene en total cuatro átomos de carbono, ejemplos que incluyen $CH_3CH_2CH_2OCH_2$ y $CH_3CH_2OCH_2CH_2$. En las exposiciones anteriores, cuando un compuesto de fórmula (I) comprende uno o más anillos heterocíclicos, todos los sustituyentes se unen a estos anillos a través de cualquier carbono o nitrógeno disponible reemplazando un hidrógeno en dicho carbono o nitrógeno.

Cuando un compuesto está sustituido con un sustituyente que lleva un subíndice que indica que el número de dichos sustituyentes puede exceder de 1, dichos sustituyentes (cuando exceden de 1) se seleccionan independientemente del

grupo de sustituyentes definidos. Además, cuando el subíndice m en $(R)_m$ indica un número entero que oscila entre, por ejemplo, 0 y 4, entonces el número de sustituyentes se puede seleccionar entre los números enteros entre 0 y 4 inclusive.

Cuando un grupo contiene un sustituyente que puede ser hidrógeno, entonces, cuando este sustituyente se toma como hidrógeno, se reconoce que dicho grupo no está sustituido.

El término “opcionalmente sustituido” se utiliza de manera intercambiable, en el presente documento, con la frase “sustituido o insustituido” o con el término “(in)sustituido”. A menos que se indique lo contrario, un grupo sustituido opcionalmente tienen un sustituyente en cada posición sustituible de cada grupo y cada sustitución es independiente de la otra. Un grupo opcionalmente sustituido también puede no tener sustituyentes. Por lo tanto, la frase “opcionalmente sustituido con uno o más de sustituyentes” significa que la cantidad de sustituyentes puede variar de cero al número de las posiciones disponibles para la sustitución.

El término (in)sustituido se refiere a dichos grupos que son independientemente sustituidos con los sustituyentes seleccionados del grupo que consiste en halógeno, ciano, alquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_8 , alcoxi C_1-C_6 , $NH(\text{alquil})$, $N(\text{alquil})_2$ y $-S(O)_{0-2}\text{alquilo } C_1-C_6$. El término “grupo alifático” usado ya sea solo o en palabras compuestas incluye sustituyentes de cadena lineal o sustituyentes ramificados, p. ej., alquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , haloalquenilo C_2-C_6 , alquiltio C_1-C_6 , haloalquiltio C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 o haloalcoxi C_1-C_6 ;

El término “grupos cíclicos” usados solos o en palabras compuestas incluye sustituciones o grupos cíclicos saturados o insaturados completa/parcialmente, p. ej., cicloalquilo, fenilo, heterociclilo C_2-C_6 , etc.

Las realizaciones en el presente documento y las diversas características y detalles ventajosos de estas, se explican de referencia a las realizaciones no limitantes de la descripción. Se omiten las descripciones de componentes y

técnicas de procesamiento bien conocidos para no oscurecer innecesariamente las realizaciones en el presente documento. Los ejemplos utilizados en el presente documento están destinados simplemente a facilitar la comprensión de las formas en que se pueden practicar las realizaciones del presente documento y para permitir a los expertos en la materia practicar las realizaciones del presente documento. En consecuencia, los ejemplos no se deben interpretar como una limitación del alcance de las realizaciones en el presente documento. La descripción de las realizaciones específicas revelará tan completamente la naturaleza general de las realizaciones en el presente documento que otros pueden, mediante la aplicación de los conocimientos actuales, modificar y/o adaptar fácilmente para diversas aplicaciones dichas realizaciones específicas sin apartarse del concepto genérico y, por lo tanto, dichas adaptaciones y modificaciones deben y están destinadas a ser comprendidas dentro del significado y margen de equivalentes de las realizaciones divulgadas. Se debe entender que la fraseología o terminología empleada en el presente documento tiene por objeto la descripción y no la limitación. Por lo tanto, aunque las realizaciones descritas en el presente documento se han descrito en términos de realizaciones preferidas, los expertos en la materia reconocerán que las realizaciones descritas en el presente documento se pueden practicar con modificaciones dentro del espíritu y del alcance de las realizaciones aquí descritas.

Cualquier discusión de documentos, actos, materiales, dispositivos, artículos y similares que se haya incluido en esta memoria tiene como único propósito proporcionar un contexto para la divulgación. No debe considerarse como una admisión de que alguno o todos estos asuntos formen parte de la base de la técnica anterior o fueran de conocimiento general en el campo relevante para la divulgación tal como existía en cualquier lugar antes de la fecha de prioridad de esta solicitud.

Aunque los valores numéricos mencionados en la descripción y en la descripción/reivindicaciones puedan formar una parte crucial de la presente

invención, cualquier desviación de dichos valores numéricos seguirá estando dentro del alcance de la presente invención si dicha desviación sigue el mismo principio científico que el de la presente invención divulgado en esta. El compuesto inventivo de la presente invención puede, si es apropiado, estar presente como mezclas de diferentes formas isómeras posibles, en especial de estereoisómeros, por ejemplo E y Z, treo y eritro, y también isómeros ópticos, pero si es apropiado también de tautómeros. Se divulgan y reivindican los isómeros E y Z, y también los isómeros treo y eritro, y los isómeros ópticos, cualquier mezcla deseada de estos isómeros y las posibles formas tautoméricas. El término “plaga” a los efectos de la presente divulgación incluye, entre otros, hongos, estramenópilos (oomicetos), bacterias, nemátodos, ácaros, garrapatas, insectos y roedores.

Por “planta” se entienden todas las plantas y poblaciones de plantas, tales como las plantas silvestres deseadas y no deseadas o las plantas de cultivo (incluidas las plantas de cultivo naturales). Las plantas de cultivo pueden ser plantas que pueden obtenerse mediante métodos convencionales de mejora y optimización o mediante métodos biotecnológicos y diseñadas genéticamente o combinaciones de estos métodos, incluidas las plantas transgénicas e incluidos los cultivares de plantas protegibles y no protegibles por derechos de obtentor. En la presente divulgación, el término “planta” incluye un organismo vivo del tipo ejemplificado por árboles, arbustos, hierbas, gramíneas, helechos y musgos, que normalmente crece en un sitio, absorbe agua y sustancias necesarias a través de sus raíces y sintetiza nutrientes en sus hojas mediante fotosíntesis.

Ejemplos de “planta” a los efectos de la presente invención incluyen cultivos agrícolas como el trigo, el centeno, la cebada, el triticale, la avena o el arroz; remolacha, por ejemplo, remolacha azucarera o remolacha forrajera; frutas y árboles frutales, como pomáceas, frutas de hueso o frutos de baya, por ejemplo manzanas, peras, ciruelas, melones, almendras, cerezas, fresas, frambuesas, moras o grosellas; leguminosas, como lentejas, arvejas, alfalfa o soja; plantas oleaginosas, como colza, mostaza, olivo, girasol, coco, cacao en grano, ricino,

palma, maní o soja; cucurbitáceas, como calabazas, pepinos o melones; plantas de fibra, como algodón, lino, cáñamo o yute; cítricos y árboles de cítricos, como naranjas, limones, pomelos o mandarinas; cualquier planta hortícola, hortalizas, como espinacas, lechugas, espárragos, coles, zanahorias, cebollas, tomates, papas, cucurbitáceas o pimentón; plantas lauráceas, como paltas, canela o alcanfor; cucurbitáceas; plantas oleaginosas; plantas energéticas y de materias primas, como cereales, maíz, soja, otras leguminosas, colza, caña de azúcar o palma; tabaco; frutos de cáscara; café; té; cacao; bananas; pimientos; vides (uvas de mesa y vides de uva de jumo de uva); lúpulo; césped; hoja dulce (también llamada Stevia); plantas de caucho natural o plantas ornamentales y forestales, como flores, arbustos, árboles de hoja ancha o árboles de hoja perenne, p. ej., coníferas; y sobre g. coníferas; y en el material de reproducción vegetal, como las semillas, y el material de cultivo de estas plantas.

Preferentemente, las plantas a efectos de la presente invención incluye, pero no se limita a, cereales, maíz, arroz, soja y otras leguminosas, frutas y árboles frutales, uvas, nueces y árboles de frutos secos, cítricos y árboles de cítricos, cualquier planta hortícola, cucurbitáceas, oleaginosas, tabaco, café, té, cacao, remolacha azucarera, caña de azúcar, algodón, papa, tomate, cebolla, pimienta y hortalizas, plantas ornamentales, cualquier planta de floricultura y otras plantas para uso humano y animal.

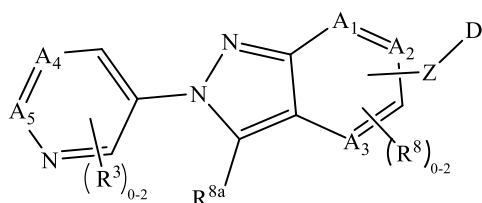
Por “partes de plantas” se entienden todas las partes y órganos de las plantas por encima y por debajo del suelo. Con el propósito de la presente divulgación, el término partes de las plantas incluyen, a mero título enunciativo, esquejes, hojas, ramitas, tubérculos, flores, semillas, ramas, raíces, incluidas las raíces pivotantes, raíces laterales, pelos radiculares, vértice de la raíz, sombrerete de la raíz, rizomas, esquejes, brotes, frutos, cuerpos fructíferos, corteza, tallo, yemas, yemas axilares, meristemas, nudos y entrenudos.

El término “locus de este” incluye el suelo, los alrededores de la planta o partes de la planta y el equipo o las herramientas utilizadas antes, durante o después de la siembra/plantación de una planta o parte de una planta.

La aplicación de los compuestos de la presente divulgación o del compuesto de la presente divulgación en una composición que comprende opcionalmente otros compuestos compatibles a una planta o a un material vegetal o locus de este incluye la aplicación mediante una técnica conocida por un experto en la materia, que incluye, entre otros a pulverizar, recubrir, sumergir, fumigar, impregnar, inyectar y espolvorear.

El término “aplicado” significa adherido a una planta o parte de una planta, ya sea física o químicamente, incluida la impregnación.

La presente invención se refiere a un compuesto de fórmula (I),

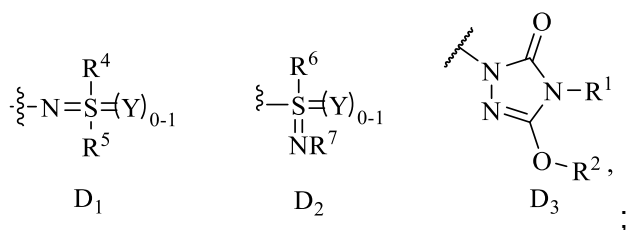


Fórmula (I)

donde

Z se selecciona de un enlace directo o $-C(=O)-$;

D se selecciona del grupo que consiste en D₁, D₂ y D₃



Y representa O o NR⁷;

A₁, A₂ y A₃ son independientemente C o N;

A₄ y A₅ son independientemente C o N, dado que A₄ y A₅ no pueden ser simultáneamente N;

R¹ se selecciona del grupo que consiste en alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, cicloalquil C₃-C₈-alquilo C₁-C₆, fenilo, bencilo, feniletilo y heterociclilo C₂-C₆;

R² se selecciona del grupo que consiste en alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, haloalquilo C₁-C₆ y cicloalquil C₃-C₈-alquilo C₁-C₆;

R³ se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆-, alcoxi C₁-C₆- y haloalquilo C₁-C₆;

R⁴ se selecciona del grupo que consiste en alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalqueno C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, cicloalquilo C₃-C₈-alquilo C₁-C₆ y -NR^cR^d;

R^c se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆ y cicloalquilo C₃-C₈;

R^d se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalqueno C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, cicloalquilo C₃-C₆-alquilo-C₁-C₄-;

o

Los sustituyentes R^c y R^d, junto con el átomo al que están unidos o junto con otros átomos seleccionados del grupo que consiste en C, N, O, C(=O), C(=S) y S(O)₀₋₂, pueden formar un anillo de 3 a 6 miembros, que puede sustituirse opcionalmente con uno o más sustituyentes seleccionados del grupo que consisten en halógeno, CN y alquilo C₁-C₆;

R⁵ se selecciona del grupo que consiste en alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, cicloalquilo C₃-C₈-alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, haloalqueno C₂-C₆, fenilo, bencilo y heterociclilo C₂-C₆;

o

Los sustituyentes R⁴ y R⁵, junto con el átomo al que están unidos o junto con otros átomos seleccionados del grupo que consiste en C, N, O, C(=O), C(=S) y S(O)₀₋₂, pueden formar un anillo de 3 a 6 miembros, que puede sustituirse opcionalmente con uno o más sustituyentes seleccionados del grupo que consisten en halógeno, CN y alquilo C₁-C₆;

R⁶ se selecciona del grupo que consiste en alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalqueno C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, cicloalquilo C₃-C₈-alquilo C₁-C₆, fenilo, bencilo, heterociclilo C₂-C₆ y -NR^cR^d;

R⁷ se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, ciano, alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalqueno C₂-C₆, alcoxi C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, cicloalquil C₃-C₈-alquilo C₁-C₆, fenilo, bencilo, heterociclilo C₂-C₆, heterociclil C₂-C₆-alquilo C₁-C₆, -COR⁵, -CONR^cR^d, SCF₃ y -SO₂R⁵;

R⁸ y R^{8a} se seleccionan independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo C₁-C₄ y haloalquilo C₁-C₄;

donde cada grupo alifático de R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ y R⁷ puede sustituirse opcionalmente con uno o más grupos de R^a; y los grupos cíclicos de R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ y R⁷ pueden sustituirse opcionalmente con uno más grupos de R^b, donde,

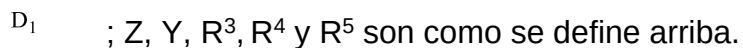
R^a se selecciona del grupo que consiste en halógeno, ciano, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, alcoxi C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, fenilo y heterociclilo C₂-C₆;

R^b se selecciona del grupo que consiste en halógeno, ciano, alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalqueno C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, alquiltio C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆ y haloalcoxi C₁-C₆;

o sales, estereoisómeros, tautómeros, polimorfos, complejos metálicos o N-óxidos de estos.

Las siguientes realizaciones proporcionan definiciones, incluidas definiciones preferidas, para sustituyentes con referencia a los compuestos de fórmula (I) según la invención. Para uno cualquiera de estos sustituyentes, cualquiera de las definiciones proporcionadas a continuación pueden combinarse con cualquier definición de cualquier otro sustituyente proporcionado a continuación o en otra parte de este documento.

En una realización, la presente invención proporciona compuestos de fórmula (I), donde D es D₁,


$$\begin{array}{c} \text{R}^6 \\ | \\ \xi - \text{S} = (\text{Y})_{0-1} \\ || \\ \text{NR}^7 \end{array}$$

D₂ ; Z es un enlace directo, Y, R³, R⁶ y R⁷ son como se define arriba.

O=C1N(R1)C(OR2)N(N1)R3

; Z , R^1 , R^2 y R^3 son como se define arriba.

donde, $A_1, A_2, A_3, A_4, A_5, Z, D, R^3, R^8$ y R^{8a} son como se define arriba.

Fórmula (Ib)

donde, A₃ es C; A₁, A₂, A₄, A₅, Z, D, R³, R⁸ y R^{8a} son como se define arriba.

En una realización, los grupos R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ y R⁷ del compuesto de fórmula (I) se describen de la siguiente manera:

R¹ se selecciona de alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, cicloalquilo C₃-C₈-alquilo C₁-C₆, bencilo, fenilo y heterociclilo C₃-C₆; preferentemente alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, fenilo, bencilo y heterociclos aromáticos o no aromáticos de 4 a 6 miembros.

R² se selecciona de alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₈-alquilo C₁-C₆; preferentemente alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆-alquilo C₁-C₆, más preferentemente alquilo C₁-C₆; mayor preferentemente metilo o etilo.

R³ se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆-, alcoxi C₁-C₆-y haloalquilo C₁-C₆; preferentemente hidrógeno, halógeno y ciano; alquilo C₁-C₃-, haloalquilo C₁-C₃- y alcoxi C₁-C₃-; más preferentemente hidrógeno, flúor, cloro, metilo, etilo, metoxi y CF₃.

R⁴ se selecciona del grupo que consiste en alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, cicloalquilo C₃-C₈-alquilo C₁-C₆ y -NR^cR^d; preferentemente alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆-alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, -NR^cR^d y haloalquilo C₁-C₆; más preferentemente alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆ y haloalquilo C₁-C₆;

R^c se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₈; más preferentemente hidrógeno o alquilo C₁-C₆;

R^d se selecciona del grupo que consiste en alquilo C₁-C₆, C₁-C₆- cicloalquilo C₃-C₈-alquilo C₁-C₆, fenilo y heterociclilo C₂-C₆; preferentemente alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆ y cicloalquilo C₃-C₈; o

Los sustituyentes R^c y R^d, junto con el átomo al que están unidos o junto con otros átomos seleccionados del grupo que consiste en C, N, O, C(=O), C(=S) y S(O)₀₋₂, pueden formar un anillo de 3 a 6 miembros, que puede sustituirse

opcionalmente con uno o más sustituyentes seleccionados del grupo que consisten en halógeno, CN o alquilo C₁-C₆;

R⁵ se selecciona del grupo que consiste en alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, cicloalquilo C₃-C₈-alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, fenilo, bencilo y heterociclilo C₂-C₆;

Opcionalmente, los sustituyentes R⁴ y R⁵, junto con el átomo al que están unidos o junto con otros átomos seleccionados del grupo que consiste en C, N, O, C(=O), C(=S) y S(O)₀₋₂, pueden formar un anillo de 4 a 6 miembros, que puede sustituirse opcionalmente con uno o más sustituyentes seleccionados del grupo que consisten en halógeno, CN y alquilo C₁-C₆;

R⁶ se selecciona del grupo que consiste en alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, cicloalquilo C₃-C₈-alquilo C₁-C₆ y heterociclilo C₂-C₆; preferentemente alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₈ y heterociclilo C₂-C₆.

R⁷ se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, ciano, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, alcoxi C₁-C₆-, cicloalquilo C₃-C₈, cicloalquilo C₃-C₈-alquilo C₁-C₆, heterociclilo C₂-C₆ y -COR⁵; preferentemente hidrógeno, ciano, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-, cicloalquilo C₃-C₈ heterociclilo C₂-C₆ y -COR⁵.

R⁸ y R^{8a} son independientemente seleccionados del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, fenilo y heterociclilo C₂-C₆; preferentemente hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo C₁-C₆ y haloalquilo C₁-C₆.

donde cada grupo alifático de R¹, R², R⁴, R⁵, R⁶ y R⁷ pueden ser opcionalmente sustituidos con uno o más de grupos de R^a y grupos cíclicos de R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁶ y R⁷ pueden ser opcionalmente sustituidos con uno o más de grupos de R^b,

R^a se selecciona del grupo que consiste en halógeno, ciano, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, alcoxi C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, fenilo y heterociclilo C₂-C₆;

R^b se selecciona del grupo que consiste en halógeno, ciano, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalquenilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, alquiltio C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆ y haloalcoxi C₁-C₆.

Además, las realizaciones de esta divulgación descritas en el presente documento puede combinarse de cualquier manera, y las descripciones de las variables en las realizaciones pertenecen no solamente a los compuestos de fórmula (I) sino también a los compuestos iniciales y a los compuestos intermedios útiles para la preparación de los compuestos de fórmula (I).

En este sentido, las realizaciones que pueden combinarse según la presente invención se ilustran en lo siguiente:

En una realización, la presente invención también proporciona compuestos de fórmula (I), donde,

D es D₁;

Z es un enlace directo o -C(=O)-; preferentemente Z es un enlace directo;

R³ se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆ y alcoxi C₁-C₆;

R⁴ se selecciona del grupo que consiste en alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, cicloalquil C₃-C₈-alquilo C₁-C₆ y -NR^cR^d;

donde R^c se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno o alquilo C₁-C₆;

R^d se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno o alquilo C₁-C₆;

R⁵ se selecciona del grupo que consiste en alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, cicloalquil C₃-C₈-alquilo C₁-C₆, fenilo, bencilo y heterociclilo C₂-C₆;

o

Los sustituyentes R⁴ y R⁵, junto con el átomo al que están unidos o junto con otros átomos seleccionados del grupo que consiste en C, N, O, C(=O), C(=S) y S(O)₀₋₂, pueden formar un anillo de 4 a 6 miembros, que puede sustituirse opcionalmente con uno o más sustituyentes seleccionados del grupo que consisten en halógeno, CN y alquilo C₁-C₆.

donde cada grupo alifático de R^4 y R^5 puede sustituirse opcionalmente con uno o más grupos de R^a ; y los grupos cíclicos de R^4 y R^5 pueden sustituirse opcionalmente con uno más grupos de R^b ,

R^a se selecciona del grupo que consiste en halógeno, ciano, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_8 , alcoxi C_1-C_6 , alquiltio C_1-C_6 , fenilo y heterociclilo C_2-C_6 ;

R^b se selecciona del grupo que consiste en halógeno, ciano, alquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , haloalquenilo C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_8 , alquiltio C_1-C_6 , haloalquiltio C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 y haloalcoxi C_1-C_6 ;

R^8 y R^{8a} se seleccionan independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo C_1-C_4 y haloalquilo C_1-C_4 ;

A_1, A_2, A_3, A_4, A_5 se definen como se indica arriba;

o sales, estereoisómeros, tautómeros, polimorfos, complejos metálicos o N-óxidos de estos.

En otra realización, la presente invención también proporciona compuestos de fórmula (I), donde,

D es D_2 ;

Z es un enlace directo;

R^3 se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 y alcoxi C_1-C_6 ;

sR^6 se selecciona del grupo que consiste en alquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , haloalquenilo C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_8 , cicloalquilo C_3-C_8 -alquilo C_1-C_6 , $-NR^cR^d$, fenilo, bencilo y C_2-C_6 heterociclilo; preferentemente R^6 se selecciona del grupo que consiste en alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_8 , cicloalquilo C_3-C_8 -alquilo C_1-C_6 y $-NR^cR^d$;

donde R^c se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno o alquilo C_1-C_6 ;

R^d se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno o alquilo C_1-C_6 ;

R^7 es independientemente seleccionado del grupo que consiste en hidrógeno, ciano, alquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 ,

haloalqueno C₂-C₆, alcoxi C₁-C₆-, cicloalquilo C₃-C₈, cicloalquilo C₃-C₈-alquilo C₁-C₆, fenilo, bencilo, heterociclilo C₂-C₆, heterociclilo C₂-C₆ alquilo C₁-C₆ y -COR⁵; preferentemente R⁷ se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, cicloalquilo C₃-C₈-alquilo C₁-C₆, -COR⁵, fenilo, bencilo, heterociclilo C₂-C₆ y ciano;

donde R⁵ se selecciona del grupo que consiste en alquilo C₁-C₆ y cicloalquilo C₃-C₈;

donde cada grupo alifático de R⁵, R⁶ y R⁷ puede sustituirse opcionalmente con uno o más grupos de R^a; y los grupos cíclicos de R⁵, R⁶ y R⁷ pueden sustituirse opcionalmente con uno más grupos de R^b, donde,

R^a se selecciona del grupo que consiste en halógeno, ciano, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, alcoxi C₁-C₆, alquiltio C₁-C₆, fenilo y heterociclilo C₂-C₆;

R^b se selecciona del grupo que consiste en halógeno, ciano, alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, haloalquilo C₁-C₆, haloalqueno C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, alquiltio C₁-C₆, haloalquiltio C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆ y haloalcoxi C₁-C₆;

A₁, A₂, A₃, A₄ y A₅ son como se define arriba;

o sales, estereoisómeros, tautómeros, polimorfos, complejos metálicos o N-óxidos de estos.

En aun otra realización, la presente invención también proporciona compuestos de fórmula (I), donde,

D es D₃;

Z es un enlace directo;

R₂ es alquilo C₁-C₆;

R³ se selecciona del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆ y alcoxi C₁-C₆;

R₁ se selecciona de alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalquilo C₃-C₆-alquilo C₁-C₆, fenilo, bencilo, feniletilo y heterociclilo de 4 a 6 miembros;

cada grupo alifático de R^1 , puede sustituirse opcionalmente con uno o más de grupos de R^a y grupos cíclicos de R^1 y puede sustituirse opcionalmente con uno o más de grupos de R^b , donde,

R^a se selecciona del grupo que consiste en halógeno, ciano, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_8 , alcoxi C_1-C_6 , alquiltio C_1-C_6 , fenilo y heterociclilo C_2-C_6 ;

R^b se selecciona del grupo que consiste en halógeno, ciano, alquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , haloalquenilo C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_8 , alquiltio C_1-C_6 , haloalquiltio C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 y haloalcoxi C_1-C_6 ;

R^8 y R^{8a} se seleccionan independientemente del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo C_1-C_4 y haloalquilo C_1-C_4 ;

o sales, estereoisómeros, tautómeros, polimorfos, complejos metálicos o N-óxidos de estos.

En una realización, la presente invención proporciona compuestos de fórmula (I), donde, heterociclilo C_2-C_6 del grupo de R^1 es preferentemente seleccionado de parcial/completamente saturado o insaturado furilo, tienilo, pirrolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, tiadiazolilo, pirazolilo, oxazolilo, imidazolilo, oxadiazolilo, triazolilo, piridinilo, piridazinilo, pirimidinilo o pirazinilo.

En una realización, la presente invención proporciona compuestos de fórmula (I), donde, heterociclilo C_2-C_6 del grupo de R^5 es preferentemente seleccionado de parcial/completamente saturado o insaturado furilo, tienilo, pirrolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, tiadiazolilo, pirazolilo, oxazolilo, imidazolilo, oxadiazolilo, triazolilo, piridinilo, piridazinilo, pirimidinilo o pirazinilo.

En una realización, la presente invención proporciona compuestos de fórmula (I), donde, C_2-C_6 heterociclilo del R^6 grupo es preferentemente seleccionado de oxetanilo, furilo, tienilo, pirrolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, tiadiazolilo, pirazolilo, oxazolilo, imidazolilo, oxadiazolilo, triazolilo, piridinilo, piridazinilo, pirimidinilo o pirazinilo parcial/completamente saturado o insaturado.

En una realización, la presente invención proporciona compuestos de fórmula (I), donde, heterociclilo C₂-C₆ del grupo de R⁷ es preferentemente seleccionado de parcial/completamente saturado o insaturado furilo, tienilo, pirrolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, tiadiazolilo, pirazolilo, oxazolilo, imidazolilo, oxadiazolilo, triazolilo, piridinilo, piridazinilo, pirimidinilo o pirazinilo.

En una realización, la presente invención proporciona compuestos de fórmula (I), donde A₁, A₂, A₃, A₄ y A₅ son independientemente C.

En otra realización, la presente invención proporciona compuestos de fórmula (I), donde A₁, A₂, A₃ y A₅ son independientemente C y A₄ es N.

En aun otra realización, la presente invención proporciona compuestos de fórmula (I), donde A₁, A₂, A₃ y A₄ son independientemente C y A₅ es N.

En aun otra realización, la presente invención proporciona compuestos de fórmula (I), donde A₁, A₂, A₄ y A₅ son independientemente C y A₃ es N.

En aun otra realización, la presente invención proporciona compuestos de fórmula (I), donde A₂, A₃, A₄ y A₅ son independientemente C y A₁ es N.

En aun otra realización, la presente invención proporciona compuestos de fórmula (I), donde A₁, A₃, A₄ y A₅ son independientemente C y A₂ es N.

En otra realización, la presente invención proporciona compuestos de fórmula (I), donde A₁ y A₃ son independientemente N, A₂, A₄ y A₅ es independientemente C.

En aun otra realización, la presente invención proporciona compuestos de fórmula (I), donde A₂ y A₃ son independientemente N, A₁, A₄ y A₅ es independientemente C.

En aun otra realización, la presente invención proporciona compuestos de fórmula (I), donde A₂ y A₄ son independientemente N, A₁, A₃ y A₅ es independientemente C.

En aun otra realización, la presente invención proporciona compuestos de fórmula (I), donde A₁, A₃ y A₄ son independientemente N y A₂ y A₅ son independientemente C.

En aun otra realización, la presente invención proporciona compuestos de fórmula (I), donde A_2 , A_3 y A_4 son independientemente N y A_1 y A_5 son independientemente C.

En una realización preferida, la presente invención proporciona compuestos de fórmula (I), donde A_1 , A_2 , A_3 , A_4 y A_5 son independientemente C.

En otra realización preferida, la presente invención proporciona compuestos de fórmula (I), donde A_1 , A_2 , A_3 y A_5 son independientemente C y A_4 es N.

En aun otra realización preferida, la presente invención proporciona compuestos de fórmula (I), donde A_1 , A_2 , A_4 y A_5 son independientemente C y A_3 es N.

En aun otra realización preferida, la presente invención proporciona compuestos de fórmula (I), donde A_1 , A_2 y A_5 son independientemente C; A_3 y A_4 son independientemente N.

En aun otra realización preferida, la presente invención proporciona compuestos de fórmula (I), donde A_2 , A_3 , A_4 y A_5 son independientemente C y A_1 es N.

En aun otra realización preferida, la presente invención proporciona compuestos de fórmula (I), donde A_2 , A_3 y A_5 son independientemente C; A_1 y A_4 son independientemente N.

En una realización, la presente invención proporciona compuestos de fórmula (I), donde D es D_1 y Z es un enlace directo.

En otra realización, la presente invención proporciona compuestos de fórmula (I), donde D es D_1 y Z es $-C(=O)-$.

En una realización, la presente invención proporciona compuestos de fórmula (I), donde D es D_2 y Z es un enlace directo.

En una realización, la presente invención proporciona compuestos de fórmula (I), donde D es D_3 y Z es un enlace directo.

En una realización, la presente invención proporciona compuestos de fórmula (I), donde D es D_1 o D_2 y Y es O.

En otra realización, la presente invención proporciona compuestos de fórmula (I), donde D es D_1 o D_2 y Y es NR^7 .

En una realización preferida, la presente invención proporciona compuestos de fórmula (I), donde D es D₁ o D₂ y Y es O.

En una realización, la presente invención proporciona compuestos de fórmula (I), donde R₁ es alquilo C₁-C₆.

En otra realización, la presente invención proporciona compuestos de fórmula (I), donde R₁ es alquilo C₁-C₆ sustituido por fenilo opcionalmente sustituido; donde dicha sustitución opcionalmente se selecciona de halógeno, CN, metilo o metoxi.

En una realización, la presente invención proporciona compuestos de fórmula (I), donde R² es alquilo C₁-C₆.

En una realización preferida, la presente invención proporciona compuestos de fórmula (I), donde R² es metilo o etilo.

En una realización, la presente invención proporciona compuestos de fórmula (I), donde R³ es alquilo C₁-C₆.

En otra realización, la presente invención proporciona compuestos de fórmula (I), donde R³ es haloalquilo C₁-C₆.

En aun otra realización, la presente invención proporciona compuestos de fórmula (I), donde R³ es halógeno.

En aun otra realización, la presente invención proporciona compuestos de fórmula (I), donde R³ es alcoxi C₁-C₆.

En una realización preferida, la presente invención proporciona compuestos de fórmula (I), donde R³ es CF₃.

En otra realización preferida, la presente invención proporciona compuestos de fórmula (I), donde R³ es fluoro o cloro.

En una realización preferida, la presente invención proporciona compuestos de fórmula (I), donde R⁴ es alquilo C₁-C₆.

En una realización preferida, la presente invención proporciona compuestos de fórmula (I), donde R⁴ es alquilo C₁-C₆ opcionalmente sustituido con R^a donde R^a se selecciona de F, CN, metilo, etilo, (n, iso) propilo, metoxi, CF₃, ciclopropilo, heterociclilo C₂-C₆;

En una realización preferida, la presente invención proporciona compuestos de fórmula (I), donde R^5 es alquilo C_1-C_6 .

En una realización preferida, la presente invención proporciona compuestos de fórmula (I), donde R^5 es alquilo C_1-C_6 opcionalmente sustituido con R^a donde R^a se selecciona de F, CN, metilo, etilo, (n, iso) propilo, metoxi, CF_3 , ciclopropilo, heterociclilo C_2-C_6 ;

En una realización preferida, la presente invención proporciona compuestos de fórmula (I), donde R^6 es alquilo C_1-C_6 .

En una realización preferida, la presente invención proporciona compuestos de fórmula (I), donde R^6 es alquilo C_1-C_6 opcionalmente sustituido con R^a donde R^a se selecciona de F, CN, metilo, etilo, (n, iso) propilo, metoxi, CF_3 , ciclopropilo, heterociclilo C_2-C_6 .

En una realización preferida, la presente invención proporciona compuestos de fórmula (I), donde R^7 es alquilo C_1-C_6 , $-COR^5$ y heterociclilo C_2-C_6 .

En una realización R^8 y R^{8a} son independientemente seleccionados del grupo que consiste en hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 ;

En una realización preferida la presente invención proporciona compuestos de fórmula (I), donde R^8 y R^{8a} son independientemente seleccionados del grupo que consiste en hidrógeno, cloro, fluoro, ciano, metilo, etilo, isopropilo y CF_3 ;

En una realización preferida la presente invención proporciona compuestos de fórmula (I), donde cicloalquilo C_3-C_6 se selecciona de ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo o ciclohexilo. Preferentemente, ciclopropilo o ciclobutilo.

En una realización preferida, la presente invención proporciona compuestos de fórmula (I), donde A_1 , A_2 , A_3 , A_4 y A_5 son independientemente C; o A_1 , A_2 , A_3 y A_5 son independientemente C y A_4 es N; o A_1 , A_2 , A_4 y A_5 son independientemente C y A_3 es N; o A_1 , A_2 y A_5 son independientemente C y A_3 y A_4 son independientemente N; o A_2 , A_3 , A_4 y A_5 son independientemente C y A_1 es N; o A_2 , A_3 y A_5 son independientemente C y A_1 y A_4 son independientemente N.

La presente invención también se refiere a un método para preparar compuestos de fórmula (I).

Los compuestos de la presente invención pueden existir como uno o más de estereoisómeros. Los varios estereoisómeros incluyen enantiómeros, diastereómeros, atropisómeros e isómeros geométricos. Un experto en la materia apreciará que un estereoisómero puede ser más activo y/o puede mostrar efectos beneficiosos cuando se enriquece en relación con otros estereoisómeros o cuando se separa de otros estereoisómeros. Además, el experto sabe cómo separar, enriquecer y/o preparar selectivamente dicho estereoisómeros. Los compuestos de la presente invención pueden estar presentes como una mezcla de estereoisómeros, estereoisómeros individuales o como una forma ópticamente activa.

En el caso de que los compuestos de fórmula (I) aparezcan como la parte catiónica de una sal o son capaces de formar dicha parte catiónica de una sal, la parte aniónica respectiva puede ser inorgánica u orgánica. De manera alternativa, en el caso de que los compuestos de fórmula (I) aparezcan como la parte aniónica de una sal o son capaces de formar dicha parte aniónica de una sal, la parte catiónica respectiva puede ser inorgánica u orgánica. Los ejemplos de la parte de anión inorgánico de la sal incluyen, a mero título enunciativo, cloruro, bromuro, yoduro, fluoruro, sulfato, fosfato, nitrato, nitrito, carbonatos de hidrógeno y sulfato de hidrógeno. Los ejemplos de la parte aniónica orgánica de la sal incluyen, a mero título enunciativo, formato, alcanos, carbonatos, acetatos, trifluoroacetato, tricloroacetato, propionato, glicolato, tiocianato, lactato, succinato, malato, citratos, benzoatos, cinnamatos, oxalatos, alquilsulfatos, alquilsulfonatos, arilsulfonatos arildisulfonatos, alquilo fosfonatos, arilo fosfonatos, arilo difosfonatos, *p*-toluenosulfonato y salicilato. Los ejemplos de la parte catiónica inorgánica de la sal incluyen, a mero título enunciativo, alcali y metales alcalinotérreos. Los ejemplos de la parte catiónica orgánica de la sal incluyen, a mero título enunciativo, cationes derivados de piridina, metilamina, imidazol, benzimidazol, histidina, fosfaceno, tetrametilo amonio, tetrabutilamonio, colina y trimetiloamina.

Los iones metálicos en los complejos metálicos de los compuestos de fórmula (I) son especialmente los iones de los elementos del segundo grupo principal, especialmente calcio y magnesio, del tercer y cuarto grupos principales, especialmente aluminio, estaño y plomo, y también del primer al octavo grupo de transición, especialmente cromo, manganeso, hierro, cobalto, níquel, cobre, zinc y otros. Se obtiene una preferencia particular a los iones metálicos de los elementos del cuarto periodo y el primer a octavo grupo de transición. Aquí, los metales pueden estar presentes en varias valencias que pueden asumir.

Otra realización de la presente invención divulga el compuesto de fórmula (I), sales, complejos metálicos, estereoisómeros, diastereoisómeros, enantiómeros, isómeros quirales, atropisómeros, conformadores, rotámeros, tautómeros, isómeros ópticos, polimorfos, isómeros geométricos o N-óxidos de estos y composiciones con el excipiente, transportador inerte o cualquier otro ingrediente esencial tal como tensioactivos, aditivos, diluyentes sólidos y diluyentes líquidos. Los compuestos seleccionados de fórmula (I), (incluidos todos los estereoisómeros, N-óxidos y sales de estos), en general existen en más de una forma y fórmula (I) por lo tanto incluye todas las formas cristalinas y no cristalinas de los compuestos que representan la fórmula (I). Las formas no cristalinas incluyen las realizaciones que son sólidos, tales como ceras y gomas, así como las realizaciones que son líquidos, tales como soluciones o fundiciones. Las formas cristalinas incluyen realizaciones, que representan esencialmente un tipo de cristal único y realizaciones que representan una mezcla de polimorfos (es decir, diferentes tipos de cristalinos). El término "polimorfo" se refiere a una forma cristalina particular de un compuesto químico que puede cristalizar en diferentes formas cristalinas, teniendo estas formas diferentes disposiciones y/o conformaciones de las moléculas en la red cristalina. Aunque los polimorfos pueden tener la misma composición química, también pueden diferir en su composición debido a la presencia o ausencia de agua co-cristalizada u otras moléculas, que pueden estar débil o fuertemente unidas en la red. Los polimorfos pueden diferir en propiedades químicas, físicas y biológicas como la forma del

cristal, la densidad, la dureza, el color, la estabilidad química, el punto de fusión, la higroscopicidad, la suspensibilidad, la velocidad de disolución y la disponibilidad biológica. Un experto en la técnica apreciará que un polimorfo de un compuesto representado por la fórmula (I) puede exhibir efectos beneficiosos (p. ej., idoneidad para la preparación de formulaciones útiles, rendimiento biológico mejorado) en relación con otro polimorfo o una mezcla de polimorfos del mismo compuesto representado por la fórmula (I). La preparación y el aislamiento de un polimorfo particular de un compuesto representado por la fórmula (I) se puede lograr mediante métodos conocidos por los expertos en la técnica incluidos, por ejemplo, cristalización mediante solventes y temperaturas seleccionadas.

La presente invención también se refiere a una composición para controlar o evitar plagas de insectos y ácaros. Dicha composición comprende una cantidad biológicamente eficaz del compuesto de fórmula (I) y al menos otro componente seleccionado del grupo que consiste en tensioactivos y auxiliares.

Otra realización de la presente invención se refiere a un compuesto de fórmula (I) o sus N-óxidos o sales tipos habituales de composiciones agroquímicas, p. ej., soluciones, emulsiones, suspensiones, polvos, pastas, gránulos, prensador, cápsulas y mezclas de estos. Ejemplos de los tipos de composición son suspensiones (por ejemplo, SC, OD, FS), concentrados emulsionables (por ejemplo, EC), emulsiones (por ejemplo, EW, EO, ES, ME), cápsulas (por ejemplo, CS, ZC), pastas, pastillas, polvos humectables o polvos (por ejemplo, WP, SP, WS, DP, DS), prensados (p. ej. BR, TB, DT), gránulos (p. ej. WG, SG, GR, FG, GG, MG), artículos insecticidas (p. ej. LN), así como formulaciones en gel para el tratamiento de materiales de propagación de plantas, como semillas (p. ej. GF). Estos y otros tipos de composiciones se definen en "Catalogue de pesticide formulation types and international coding system", Technical Monograph No. 2, 6th Ed. May 2008, CropLife International.

Las composiciones mencionadas arriba se preparan de un modo conocido, como el descrito por Mollet y Grubemann, "Formulation Technology", Wiley VCH,

Weinheim, 2001; o Knowles, "New Developments in Crop Protection Product Formulation", Agrow Reports DS243, T&F Informa, London, 2005. Ejemplos de auxiliares adecuados para formulaciones y/o composiciones agroquímicas según la invención son solventes, transportadores líquidos, transportadores sólidos o cargas, tensioactivos, dispersantes, emulsionantes, humectantes, adyuvantes, solubilizantes, potenciadores de la penetración, coloides protectores, agentes de adhesión, espesantes, humectantes, repelentes, atrayentes, estimulantes de la alimentación, compatibilizantes, bactericidas, agentes anticongelantes, agentes antiespumantes, colorantes, adherentes y aglutinantes.

Los disolventes y portadores líquidos adecuados en este contexto son, por ejemplo, el agua y los disolventes orgánicos, como las fracciones de aceites minerales de punto de ebullición medio a alto, por ejemplo, queroseno, gasóleo, aceites de origen vegetal o animal; hidrocarburos alifáticos, cíclicos y aromáticos, por ejemplo, tolueno, parafina, tetrahidronaftaleno, naftalenos alquilados; alcoholes, p. ej., etanol, propanol, butanol, alcohol bencílico, ciclohexanol; glicoles; dimetilsulfóxido; cetonas, p. ej., ciclohexanona; ésteres, p. ej., lactatos, carbonatos, ésteres de ácidos grasos, gamma-butirolactona; ácidos grasos; fosfonatos; aminas; amidas, p. ej., *N*-metilpirrolidona, dimetilamidas de ácidos grasos; y mezclas de estos. Los portadores sólidos o cargas adecuados son, por ejemplo, tierras minerales, como silicatos, geles de sílice, talco, caolines, piedra caliza, cal, tiza, arcillas, dolomita, tierra de diatomeas, bentonita, sulfato de calcio, sulfato de magnesio, óxido de magnesio; polisacáridos, como celulosa, almidón; fertilizantes, p. ej. sulfato de amonio, fosfato de amonio, nitrato de amonio, ureas; productos de origen vegetal, p. ej. harina de cereales, harina de corteza de árbol, harina de madera, harina de cáscara de nuez, y mezclas de estos.

Los tensioactivos adecuados son compuestos tensioactivos, por ejemplo, tensioactivos aniónicos, catiónicos, no iónicos y anfóteros, polímeros en bloque, polielectrolitos y mezclas de estos. Dichos tensioactivos pueden utilizarse como

emulsionantes, dispersantes, solubilizantes, humectantes, potenciadores de la penetración, coloides protectores o adyuvantes. En McCutcheon's, Vol.1, se enumeran ejemplos de tensioactivos: "Emulsifiers & Detergents", McCutcheon's Directories, Glen Rock, USA, 2008 (International Ed. or North American Ed.).

Los tensioactivos aniónicos adecuados son, por ejemplo, sales alcalinas, alcalinotérreas o amónicas de sulfonatos, sulfatos, fosfatos, carboxilatos y mezclas de estos. Ejemplos de sulfonatos son los sulfonatos de alquilarilo, los sulfonatos de difenilo, los sulfonatos de alfaolefina, los sulfonatos de lignina, los sulfonatos de ácidos grasos y aceites, los sulfonatos de alquilfenoles etoxilados, sulfonatos de arilfenoles alcoxilados, sulfonatos de naftalenos condensados, sulfonatos de dodecilbencenos y tridecilbencenos, sulfonatos de naftalenos y alquilnaftalenos, sulfosuccinatos o sulfosuccinamatos. Ejemplos de sulfatos son los sulfatos de ácidos grasos y aceites, de alquilfenoles etoxilados, de alcoholes, de alcoholes etoxilados o de ésteres de ácidos grasos. Ejemplos de fosfatos son los ésteres de fosfato. Ejemplos de carboxilatos son los carboxilatos de alquilo y los etoxilatos de alcohol o alquilfenol carboxilados.

Los tensioactivos no iónicos adecuados son, por ejemplo, alcoxilatos, amidas de ácidos grasos *N*-sustituidos, óxidos de amina, ésteres, tensioactivos a base de azúcar, tensioactivos poliméricos y mezclas de estos. Ejemplos de alcoxilatos son compuestos como alcoholes, alquilfenoles, aminas, amidas, arilfenoles, ácidos grasos o ésteres de ácidos grasos que han sido alcoxilados con 1 a 50 equivalentes. Para la alcoxilación puede emplearse óxido de etileno y/o óxido de propileno, preferentemente óxido de etileno.

Ejemplos de amidas de ácidos grasos *N*-sustituidos son las glucamidas de ácidos grasos o las alcanolamidas de ácidos grasos. Ejemplos de ésteres son los ésteres de ácidos grasos, los ésteres de glicerol o los monoglicéridos. Algunos ejemplos de tensioactivos a base de azúcar son los sorbitanos, los sorbitanos etoxilados, los ésteres de sacarosa y glucosa o los alquilpoliglucósidos. Ejemplos de tensioactivos poliméricos son los homo- o copolímeros de pirrolidona de vinilo, alcoholes de vinilo o acetato de vinilo.

Los tensioactivos catiónicos adecuados son, por ejemplo, los tensioactivos cuaternarios, como los compuestos de amonio cuaternario con uno o dos grupos hidrófobos, o las sales de aminas primarias de cadena larga. Los tensioactivos anfóteros adecuados son las alquilbetainas y las imidazolininas. Los polímeros en bloque adecuados son, por ejemplo, polímeros en bloque del tipo A-B o A-B-A que comprenden bloques de óxido de polietileno y óxido de polipropileno, o del tipo A-B-C que comprenden alcohol, óxido de polietileno y óxido de polipropileno. Los polielectrolitos adecuados son, por ejemplo, los poliácidos o las polibases. Ejemplos de poliácidos son las sales alcalinas del ácido poliacrílico o los polímeros de peine de poliácido. Ejemplos de polibases son las aminas de polivinilo o las aminas de polietileno.

Los adyuvantes adecuados son compuestos que tienen una actividad plaguicida insignificante o incluso nula y que mejoran el rendimiento biológico del compuesto de fórmula (I) sobre el objetivo. Algunos ejemplos son los tensioactivos, los aceites minerales o vegetales y otros auxiliares. Knowles recoge otros ejemplos en "Adjuvants and Additives", Agrow Reports DS256, T&F Informa UK, 2006, chapter 5.

Los espesantes adecuados son, por ejemplo, polisacáridos (p. ej., goma xantana, carboximetilcelulosa), arcillas inorgánicas (modificadas orgánicamente o no), policarboxilatos y silicatos.

Los bactericidas adecuados son, por ejemplo, el bronopol y los derivados de la isotiazolinona, como las alquilisotiazolinonas y las benzoisotiazolinonas.

Los agentes anticongelantes adecuados son, por ejemplo, el etilenglicol, el propilenglicol, la urea y la glicerina.

Los agentes antiespumantes adecuados son, por ejemplo, las siliconas, los alcoholes de cadena larga y las sales de ácidos grasos.

Los colorantes adecuados (por ejemplo, en rojo, azul o verde) son, por ejemplo, pigmentos de baja solubilidad en agua y tintes hidrosolubles. Algunos ejemplos son los colorantes inorgánicos (por ejemplo, óxido de hierro, óxido de titanio,

hexacianoferrato de hierro) y los colorantes orgánicos (por ejemplo, colorantes de alizarina, azo y ftalocianina).

Los aglutinantes adecuados son, por ejemplo, las polivinilpirrolidonas, los acetatos de polivinilo, los alcoholes de polivinilo, los poliacrilatos, las ceras biológicas o sintéticas y los éteres de celulosa.

Algunos ejemplos de tipos de composición y su preparación son:

I) Concentrados hidrosolubles (SL, LS)

Del 10% al 60% en peso de un compuesto de fórmula (I) y del 5% al 15% en peso de agente humectante (p. ej., alcoxilatos de alcohol) se disuelven en agua y/o en un disolvente hidrosoluble (p. ej., alcoholes) hasta el 100% en peso. El principio activo se disuelve al diluirla en agua.

II) Concentrados dispersables (CD)

5% a 25% en peso de un compuesto de fórmula (I) y 1-10% en peso de dispersante (por ejemplo, polivinilpirrolidona) se disuelven en un solvente orgánico (por ejemplo, ciclohexanona) ad 100% en peso. La dilución con agua da una dispersión del principio activo.

III) Concentrados emulsionables (CE)

Se disuelven 15% a 70% en peso de un compuesto de Fórmula (I) y 5% a 10% en peso de emulsionantes (por ejemplo, dodecilbencenosulfonato de calcio y etoxilato de aceite de ricino) en un solvente orgánico inhidrosoluble (por ejemplo, hidrocarburo aromático) ad 100% en peso. La dilución con agua da una emulsión del principio activo.

IV) Emulsiones (EW, EO, ES)

Del 5% al 40% en peso de un compuesto de fórmula (I) y del 1% al 10% en peso de emulsionantes (p. ej., dodecilbencenosulfonato de calcio y etoxilato de aceite de ricino) se disuelven en 20% al 40% en peso de solvente orgánico insoluble en agua (p. ej., hidrocarburo aromático). Esta mezcla se introduce en agua ad 100% en peso mediante una máquina emulsionadora y se convierte en una emulsión homogénea. La dilución con agua da una emulsión del principio activo.

V) Suspensiones (SC, OD, FS)

En un molino de bolas agitado, se tritura un 20-60% en peso de un compuesto de fórmula (I) con la adición de 2-10% en peso de dispersantes y agentes humectantes (por ejemplo, lignosulfonato sódico y etoxilato de alcohol), 0,1-2% en peso de espesante (por ejemplo, goma xantana) y agua ad 100% en peso para obtener una suspensión fina de principio activo. La dilución con agua proporciona una suspensión estable del principio activo. Para la composición de tipo FS, se agrega hasta un 40% en peso de aglutinante (p. ej., alcohol polivinílico).

VI) Gránulos dispersables en agua y gránulos hidrosolubles (WG, SG)

50% a 80% en peso de un compuesto de fórmula (I) se muelen finamente con la adición de dispersantes y agentes humectantes (p. ej. lignosulfonato sódico y etoxilato de alcohol) ad 100% en peso y se preparan como gránulos dispersables en agua o hidrosolubles mediante aparatos técnicos (p. ej. extrusión, torre de pulverización, lecho fluidizado). La dilución con agua da una dispersión o solución estable del principio activo

VII) Polvos dispersables y polvos hidrosolubles (WP, SP, WS)

del 50% al 80% en peso de un compuesto de fórmula (I) se muelen en un molino de rotor-estator con la adición del 1% al 5% en peso de dispersantes (p. ej. lignosulfonato de sodio), del 1% al 3% en peso de agentes humectantes (p. ej., etoxilato de alcohol) y transportador sólido (p. ej., gel de sílice) hasta el 100% en peso. La dilución con agua da una dispersión o solución estable del principio activo

VIII) Gel (GW, GF)

En un molino de bolas agitado, el 5% a 25% en peso de un compuesto de fórmula (I) se tritura con la adición de 3% a 10% en peso de dispersantes (por ejemplo, lignosulfonato sódico), 1% a 5% en peso de espesante (por ejemplo, carboximetilcelulosa) y agua ad 100% en peso para obtener una suspensión fina del principio activo. La dilución con agua proporciona una suspensión estable del principio activo.

IX) Microemulsión (ME)

Se añaden del 5% al 20% en peso de un compuesto de fórmula (I) a un 5% al 30% en peso de mezcla de solventes orgánicos (p. ej., dimetilamida de ácido graso y ciclohexanona), del 10% al 25% en peso de mezcla de tensioactivos (p. ej., etoxilato de alcohol y etoxilato de arilfenol), y agua hasta el 100%. Esta mezcla se agita durante 1 h para producir espontáneamente una microemulsión termodinámicamente estable del principio activo.

X) Microcápsulas (CS)

Una fase oleosa que comprende de 5% a 50% en peso de un compuesto de fórmula (I), de 0% a 40% en peso de un solvente orgánico inhidrosoluble (por ejemplo, hidrocarburo aromático), de 2% a 15% en peso de monómeros acrílicos (por ejemplo, metilmetacrilato, ácido metacrílico y un di- o triacrilato) se dispersan en una solución acuosa de un coloide protector (por ejemplo, alcohol polivinílico). La polimerización radical da lugar a la formación de microcápsulas de poli(met)acrilato. Alternativamente, una fase oleosa que comprende de 5% a 50% en peso de un compuesto de fórmula (I) según la invención, de 0% a 40% en peso de un solvente orgánico inhidrosoluble (por ejemplo, hidrocarburo aromático) y un monómero de isocianato (por ejemplo, difenilmeteno-4,4'-diisocianato) se dispersan en una solución acuosa de un coloide protector (por ejemplo, alcohol polivinílico). La adición de una poliamina (por ejemplo, hexametilendiamina) da lugar a la formación de microcápsulas de poliurea que comprenden el principio activo. Los monómeros representan entre el 1 y el 10% en peso en peso El% en peso se refiere a la composición total de CS.

xi) Polvos espolvoreables (DP, DS)

de 1% a 10% en peso de un compuesto de fórmula (I) se muelen finamente y se mezclan íntimamente con un transportador sólido (por ejemplo, caolín finamente dividido) ad 100% en peso.

XII) Gránulos (GR, FG)

de 0,5% a 30% en peso de un compuesto de fórmula (I) se muelen finamente y se asocian con un transportador sólido (por ejemplo, silicato) ad 100% en peso

La granulación se consigue por extrusión, secado por pulverización o lecho fluidizado.

XIII) Líquidos de volumen ultrabajo (UL)

de 1% a 50% en peso de un compuesto de Fórmula (I) se disuelven en un solvente orgánico (por ejemplo, hidrocarburo aromático) ad 100% en peso.

La composición tipo I) a XIII) pueden comprender opcionalmente otros auxiliares, tales como del 0,1% al 1% en peso de bactericidas, del 5% al 15% en peso de agentes anticongelantes, del 0,1% al 1% en peso de agentes antiespumantes y del 0,1% al 1% en peso de colorantes.

Otra realización de la presente invención proporciona composiciones agroquímicas que contienen un compuesto de fórmula (I), que comprende el principio activo entre 0,01 y 95% por peso, preferentemente entre 0,1 y 90% y más preferentemente entre 1 y 70%, en particular entre 10 y 60% por peso del principio activo. Las sustancias activas se emplean en una pureza de 90% a 100%, preferentemente de 95% a 100% (según el espectro NMR).

Concentrados hidrosolubles (LS), suspoemulsiones (SE), concentrados fluidos (FS), polvos para el tratamiento en seco (DS), polvos dispersables en agua para el tratamiento de purines (WS), polvos hidrosolubles (SS), emulsiones (ES), concentrados emulsionables (EC) y geles (GF) en general se emplean para los fines del tratamiento de materiales de propagación vegetales, particularmente semillas. Las composiciones en cuestión proporcionan, tras una dilución de dos a diez veces, concentraciones de principios activos del 0,01 al 60% en peso, preferentemente del 0,1 al 40% en peso en los preparados listos para su uso. Debe llevarse a cabo la aplicación antes de la siembra o durante esta.

Los métodos para aplicar compuestos de fórmula (I) y sus composiciones, respectivamente, en el material de propagación vegetal, especialmente semillas, incluyen métodos de tratamiento de semillas, granulación, recubrimiento, espolvoreado, de remojo y empapado del material de propagación. Preferentemente, compuestos de fórmula (I) o sus composiciones, respectivamente, se aplican al material de propagación de plantas de una forma

que no se incluye la germinación, p. ej., mediante tratamiento de semillas, granulación, recubrimiento y espolvoreado.

Cuando se emplean en la protección de plantas, las cantidades de principios activos aplicados son, dependiendo del tipo de efecto deseado, que varía de 0,001 a 2 kg por ha, preferentemente de 0,005 a 2 kg por ha, más preferentemente de 0,05 a 0,9 kg por ha, en particular de 0,1 a 0,75 kg por ha.

Para el tratamiento de materiales de propagación de plantas, tales como semillas, p. ej., al espolvorear, recubrir o empapar las semillas, por lo general se necesitan cantidades de principio activo que oscilan entre 0,1 g y 1000 g, más preferentemente entre 1 g y 1000 g, más preferentemente entre 1 g y 100 g y lo más preferentemente entre 5 g y 100 g, por 100 de material de propagación vegetal (preferiblemente semillas).

Cuando se utiliza en la protección de materiales o productos almacenados, la cantidad de principio activo aplicado depende del tipo de zona de aplicación y del efecto deseado. Las cantidades habitualmente aplicadas en la protección de materiales oscilan entre 0,001 g y 2 kg, preferentemente entre 0,005 g y 1 kg, de principio activo por metro cúbico de material tratado.

Pueden añadirse diversos tipos de aceites, humectantes, adyuvantes, fertilizantes o micronutrientes y otros plaguicidas (por ejemplo, herbicidas, insecticidas, fungicidas, reguladores del crecimiento, protectores) a los principios activos o a las composiciones que las comprenden, como premezcla o, si procede, no hasta inmediatamente antes de su uso (mezcla de tanque). Estos agentes pueden mezclarse con las composiciones según la presente invención en una proporción en peso de 1:100 a 100:1, preferentemente de 1:10 a 10:1.

El usuario puede aplicar las composiciones según la presente invención, generalmente desde un dispositivo previo a la dosificación, un pulverizador de mochila, un tanque de pulverización, un aeronave de pulverización o un sistema de irrigación. Por lo general, la composición agroquímica está hecha con agua, tampón y/o auxiliares hasta la concentración de aplicación deseada, de manera que se obtiene la solución de pulverización o composición agroquímica lista para

usar según la presente invención. Normalmente, 20 a 2000 litros, preferentemente 50 a 400 litros, de la solución de pulverización lista para usar se aplican por hectárea de área agrícola útil.

Según una realización, los componentes individuales de la composición según la presente invención, tal como partes de un kit o partes de una mezcla binaria o terciaria, pueden ser mezclador por el mismo usuario en un tanque de pulverización y también pueden usarse otros auxiliares, si corresponde.

Los compuestos y las composiciones de la presente invención de esta manera son agronómicamente útiles para proteger cultivos de campo a partir de las plagas de invertebrados fitofagénicas y también no agronómicamente para proteger otros cultivos y plantas hortícolas a partir de las plagas de invertebrados fitofagénicas. Esta herramienta incluye proteger los cultivos y otras plantas (es decir, de forma agronómica y no agronómica) que contienen material genético introducido por ingeniería genética (es decir, transgénica) o modificado por mutagénesis para que proporcione rasgos beneficiosos.

Los compuestos de la presente invención están caracterizados por patrones metabólicos y/o residuales de suelo favorables y muestran actividad que controla un espectro de plagas de invertebrados agronómicas y no agronómicas. Los compuestos de la presente invención son ingredientes activos valioso de manera preventiva y/o curativa en el campo de control de plagas, incluso en velocidades de aplicación bajas que pueden usarse contra plagas resistentes a plaguicidas como los insectos, y/o tienen un espectro biocida muy favorable y son bien tolerados por especies de homeotermos, peces y plantas.

Los compuestos de la presente invención muestran actividad contra plagas agronómicas de importancia económica, plagas forestales, plagas de invernadero, plagas en plantas, ornamentales de vivero, plagas en alimentos y fibras, plagas para la salud animal y la salud pública, plagas en estructuras domésticas y comerciales, y plagas en productos para el hogar y almacenados. Estos incluyen larvas del orden de Lepidoptera, tales como gusanos ejércitos, gusanos cortadores, orugas agrimensoras y heliotinas en la familia de los

noctuidos (p. ej., gusano ejército de otoño (*Spodoptera fugiperda* J. E. Smith), gusano ejército de remolacha (*Spodoptera exigua* Hubner), gusano cortador negro (*Agrotis ipsilon* Hufnagel), gusano medidor falso (*Trichoplusia ni* Hubner), gusano cogollero (*Heliothis virescens* Fabricius); barrenadores, gusanos del saco, gusanos de bolsa, polillas del hocico, gusanos de la col y gusanos descarnadores de la vid de la familia de los pirálidos (por ejemplo, taladro del maíz (*Ostrinia nubilalis* Hubner), gusano naranja del ombligo (*Amyelois transitella* Walker), gusano telarañero de raíz de maíz (*Crambus caliginosellus* Clemens), gusano telarañero de césped (*Herpetogramma licarsisalis* Walker); fruteros, gusanos de las yemas, gusanos de las semillas, y gusanos de las frutas en la familia de los tortricidos (por ejemplo, polilla del manzano (*Cydia pomonella* Linnaeus), gusanos de la vid (*Endopiza viteana* Clemens), palomilla oriental de la fruta (*Grapholita molesta* Busck)); y muchos otros lepidópteros económicamente importantes (por ejemplo, palomilla dorso de diamante (*Plutella xylostella* Linnaeus), gusano rosado del algodón (*Pectinophora gossypiella* Saunders), polilla gitana (*Lymantria dispar* Linnaeus)); ninfa y adultos del orden de blatodeos que incluyen cucarachas de las familias de los blatélidos y los dictiópteros (por ejemplo, cucaracha oriental (*Blatta orientalis* Linnaeus), cucaracha asiática (*Blattella asahinai* Mizukubo), cucaracha alemana (*Blattella germanica* Linnaeus), cucaracha marrón con bandas (*Supella longipalpa* Fabricius), cucaracha americana (*Periplaneta americana* Linnaeus), cucaracha marrón (*Periplaneta brunnea* Burmeister), cucaracha de Madeira (*Leucophaea maderae* Fabricius); larvas que se alimentan de hojas y adultos del orden de los coleópteros que incluyen curculionoideas de las familias de los antríbidos, Bruchinae, y curculiónidos (por ejemplo, gorgojo de algodón (*Anthonomus grandis* Boheman), gorgojo acuático del arroz (*Lissorhoptrus oryzophilus* Kuschel), gorgojo del grano (*Sitophilus granarius* Linnaeus), gorgojo del arroz (*Sitophilus oryzae* Linnaeus); alticinos, escarabajo del pepino, gusanos de la raíz, escarabajos de la hoja, escarabajos de la patata y moscas minadoras de hojas en la familia de crisomélidos (por ejemplo, dorífora (*Leptinotarsa*

decemLineata Say), gusano de la raíz del maíz occidental (*Diabrotica virgifera* LeConte); escarabajos roedores y otros escarabajos de la familia de Scarabaeidae (por ejemplo, escarabajo japonés (*Popillia japonica* Newman) y escarabajo roedor europeo (*Rhizotrogus majalis* Razoumowsky); escarabajos de las alfombras de la familia de los derméstidos; gusanos alambre de la familia de los elatéridos; escarabajos de la corteza de la familia de los escolítidos y gusanos de la harina de la familia de los tenebriónidos. Además, incluye: adultos y larvas del orden de Dermaptera que incluyen tijeretas de la familia de forficúlidos (por ejemplo, tijeretas europeas (*Forficula auricularia* Linnaeus), tijeretas negras (*Chelisoches mono* Fabricius); adultos y ninfas de las órdenes de los hemípteros y homópteros tales como, chinches de las plantas de la familias Miridae, cigarras de la familia de los cicádidos, chicharras, (por ejemplo, *Empoasca* spp) de la familia de los cicadélidos, saltahojas de las familias Fulgoroidea y Delphacidae, periquitos de la familia de los membrácidos, psílidos de la familia Psyllidae, moscas blancas de la familia Aleyrodidae, áfidos de la familia Aphididae, filoxera de la familia Phylloxeridae, piojos harinosos de la familia Pseudococcidae, cochinillas de las familias Coccidae, Diaspididae y Margarodidae, chinches de encaje de la familia Tingidae, chinches apestosas de la familia Pentatomidae, chinches de los cereales (por ejemplo, *Blissus* spp.) y otros insectos de las semillas de la familia Lygaeidae, chicharritas (moscas pardas) de la familia Cercopidae, chinches de la calabaza de la familia Coreidae y chinches rojas y chinches manchadoras del algodón de la familia Pyrrhocoridae. También se incluyen adultos y larvas del orden Acari (ácaros), como los ácaros araña y los ácaros rojos de la familia Tetranychidae (p. ej., el ácaro rojo europeo (*Panonychus ulmi* Koch), la araña roja de dos manchas (*Tetranychus urticae* Koch), el ácaro McDaniel (*Tetranychus mcdanieli* McGregor)), los ácaros planos de la familia Tenuipalpidae (p. ej., ácaros planos de los cítricos (*Brevipalpus lewisi* McGregor)), ácaros de la roya y de la yema de la familia Eriophyidae y otros ácaros de alimentación foliar y ácaros importantes para la salud humana y animal, como los ácaros del polvo de la familia Epidermoptidae, los ácaros

foliculares de la familia Demodicidae, los ácaros del grano de la familia Glycyphagidae, las garrapatas del orden Ixodidae (p. ej., garrapata del ciervo (*Ixodes scapularis* Say), garrapata australiana de la parálisis (*Ixodes holocyclus* Neumann), garrapata americana del perro (*Dermacentor variabilis* Say), garrapata de la estrella solitaria (*Amblyomma americanum* Linnaeus) y ácaros de la sarna y del prurito de las familias Psoroptidae, Pyemotidae y Sarcoptidae; adultos e inmaduros del orden Orthoptera, incluidos saltamontes, langostas y grillos (p. ej., saltamontes migratorios (p. ej., *Melanoplus sanguinipes* Fabricius, *M. differentialis* Thomas), saltamontes americanos (p. ej., *Schistocerca americana* Drury), langosta del desierto (*Schistocerca gregaria* Forskal), langosta migratoria (*Locusta migratoria* Linnaeus), grillo doméstico (*Acheta domesticus* Linnaeus), grillo topo (*Gryllotalpa* spp.)); adultos e inmaduros del orden Diptera, incluidos minadores de hojas, mosquitos, moscas de la fruta (Tephritidae), moscas de la fruta (p. ej., *Oscinella frit* Linnaeus), gusanos del suelo, moscas domésticas (p. ej., *Musca domestica* Linnaeus), moscas domésticas menores (p. ej., *Fannia canicularis* Linnaeus, *F. femoralis* Stein), moscas de los establos (p. ej., *Stomoxys calcitrans* Linnaeus), moscas de la cara, moscas de los cuernos, moscardones (p. ej., *Chiysomya* spp., *Phonnia* spp.) y otras plagas de moscas muscoides, tábanos (p. ej., *Tabanus* spp.), moscardones (p. ej., *Gastrophilus* spp., *Oestrus* spp.), larvas del ganado (p. ej., *Hypoderma* spp.), moscas del ciervo (p. ej., *Chrysops* spp.), moscas de la caña (p. ej., *Melophagus ovinus* Linnaeus) y otros Brachycera, mosquitos (p. ej., *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Culex* spp.), moscas negras (p. ej., *Prosimulium* spp., *Simulium* spp.), jejenes picadores, moscas de la arena, esciáridos y otros Nematocera; adultos e inmaduros del orden Thysanoptera, incluido el trip de la cebolla (*Thrips tabaci* Lindeman) y otros trips que se alimentan por vía foliar; plagas de insectos del orden Hymenoptera, incluidas las hormigas (p. ej., hormiga carpintera roja (*Camponotus ferrugineus* Fabricius), hormiga carpintera negra (*Camponotus pennsylvanicus* De Geer), hormiga faraona (*Monomorium pharaonis* Linnaeus), hormiga pequeña de fuego (*Wasmannia auropunctata*

Roger), hormiga de fuego (*Solenopsis geminata* Fabricius), hormiga roja de fuego importada (*Solenopsis invicta* Buren), hormiga argentina (*Iridomyrmex humilis* Mayr), hormiga loca (*Paratrechina longicornis* Latreille), hormiga del pavimento (*Tetramorium caespitum* Linnaeus), hormigas de los maizales (*Lasius alienus* Försster), hormigas domésticas olorosas (*Tapinoma sessile* Say)), abejas (incluidas las abejas carpinteras), avispones, avispas amarillas y avispas; plagas de insectos del orden Isoptera, incluidas las termitas subterráneas orientales (*Reticulitermes flavipes* Kollar), las termitas subterráneas occidentales (*Reticulitermes hesperus* Banks), las termitas subterráneas de Formosa (*Coptotermes formosanus* Shiraki), las termitas de las Indias Occidentales de la madera seca (*Incisitermes immigrans* Snyder) y otras termitas de importancia económica; plagas de insectos del orden Thysanura, tales como el pececillo de plata (*Lepisma saccharina* Linnaeus) y el escarabajo de fuego (*Thermobia domestica* Packard); plagas de insectos del orden Mallophaga, como el piojo de la cabeza (*Pediculus humanus capitis* De Geer), el piojo del cuerpo (*Pediculus humanus* Linnaeus), el piojo del pollo (*Menacanthus stramineus* Nitzsch), el piojo picador del perro (*Trichodectes canis* De Geer), el piojo de la pelusa (*Goniocotes gallinae* De Geer), el piojo del ganado ovino (*Bovicola ovis* Schrank), el piojo de nariz corta del ganado (*Haematopinus eurysternus* Nitzsch), el piojo de nariz larga del ganado (*Linognathus setulosus* Linnaeus) y otros piojos parásitos chupadores y masticadores que atacan al hombre y a los animales; las plagas de insectos del orden Siphonoptera, incluidas la pulga de la rata oriental (*Xenopsylla cheopis* Rothschild), la pulga del gato (*Ctenocephalides felis* Bouche), la pulga del perro (*Ctenocephalides canis* Curtis), la pulga de la gallina (*Ceratophyllus gallinae* Schrank), la pulga pegajosa (*Echidnophaga gallinacea* Westwood), la pulga humana (*Pulex irritans* Linnaeus) y otras pulgas que afectan a mamíferos y aves. Otras plagas de artrópodos tratadas son las arañas del orden Araneae, tales como la araña reclusa parda (*Loxosceles reclusa* Gertsch y Mulaik) y la araña viuda negra (*Latrodectus mactans* Fabricius) y los ciempiés del orden Scutigleromorpha, tales como el ciempiés doméstico (*Scutigera*

coleoptrata Linnaeus). La actividad también incluye a los miembros de las clases Nematoda, Cestoda, Trematoda y Acanthocephala, incluidos los miembros económicamente importantes de los órdenes Strongylida, Ascaridida, Oxyurida, Rhabditida, Spirurida y Enoplida, tales como, a mero título enunciativo, las plagas agrícolas económicamente importantes (es decir, los nematodos de los nudos radiculares del género *Meloidogyne*, los nematodos de las lesiones del género *Pratylenchus*, los nematodos de las raíces del género *Trichodorus*, etc.) y plagas de la salud humana y animal (es decir, todos los parásitos, tenias y ascárides de importancia económica, tales como *Strongylus vulgaris* en caballos, *Toxocara canis* en perros, *Haemonchus contortus* en ovejas, *Dirofilaria immitis* Leidy en perros, *Anoplocephala peifoliata* en caballos, *Fasciola hepatica* Linnaeus en rumiantes, etc.).

Los compuestos de la presente invención muestran actividad particularmente contra las plagas en el orden de homópteros que incluye: *Acyrtosiphon pisum* Harris (pulgón verde del guisante); *Aphis craccivora* Koch (pulgón caupí); *Aphis fabae* Scopoli (pulgón de leguminosas negras); *Aphis gossypii* Glover (pulgón del algodón, pulgón del melón); *Aphis pomi* De Geer (pulgón de la manzana); *Aphis spiraecola* Patch (pulgón verde de los cítricos); *Aulacorthum solani* Kaltenbach (pulgón dedalera); *Chaetosiphon fragaefolii* Cockerell (pulgón de la frutilla); *Diuraphis noxia* Kurdjumov/Mordvilko (pulgón del cereal ruso); *Dysaphis plantaginea* Paaserini (pulgón ceniciento del manzano); *Eriosoma lanigerum* Hausmann (pulgón lanígero del manzano); *Hyalopterus pruni* Geoffroy (pulgón harinoso); *Lipaphis erysimi* Kaltenbach (pulgón del nabo); *Metopolophium dirrhodum* Walker (pulgón del cereal); *Macrosipum euphorbiae* Thomas (pulgón de la papa); *Myzus persicae* Sulzer (pulgón del melocotonero, pulgón verde del melocotonero); *Nasonovia ribisnigri* Mosley (pulgón de la lechuga); *Pemphigus* spp. (pulgón de la raíz y pulgón del cono); *Rhopalosiphum maidis* Fitch (pulgón del maíz); *Rhopalosiphum padi* Linnaeus (pulgón de avena cereza); *Schizaphis graminum* Rondani (pulgón de los cereales); *Sitobion avenae* Fabricius (pulgón de la espiga); *Therioaphis maculata* Buckton (pulgón de la alfalfa manchado);

Toxoptera aurantii Boyer de Fonscolombe (pulgón negro de los cítricos) y *Toxoptera citricida* Kirkaldy (pulgón marrón de los cítricos); *Adelges* spp. (áfidos de los pinos); *Phylloxera devastatrix* Pergande (phylloxera del pecán); *Bemisia tabaci* Gennadius (mosca blanca del tabaco, mosca blanca de la batata); *Bemisia argentifolii* Bellows y Perring (mosca blanca de las hojas plateadas); *Dialeurodes citri* Ashmead (mosca blanca de los cítricos); y *Trialeurodes vaporariorum* Westwood (mosca blanca de invernadero); *Empoasca fabae* Harris (cotorrita de la papa); *Laodelphax striatellus* Fallen (chinche pequeña marrón); *Macrolestes quadrilineatus* Forbes (cotorrita aster); *Nephotettix cincticeps* Uhler (cotorrita verde); *Nephotettix nigropictus* Stal (cotorrita del arroz); *Nilaparvata lugens* Stal (chinche marrón); *Peregrinus maidis* Ashmead (chinche del maíz); *Sogatella furcifera* Horvath (chinche del arroz); *Sogatodes orizicola* Muir falsa chinche del arroz; *Typhlocyba pomaria* McAfee (cotorrita blanca del manzano); *Erythroneoura* spp. (cotorritas de la uva); *Magacidada septendecim* Linnaeus (cigarra faraón); *Icerya purchasi* Maskell (cochinilla acanalada); *Quadraspidiotus perniciosus* Comstock (piojo de San José); *Planococcus citri* Risso (cotonet); *Pseudococcus* spp. (otro tipo de complejo de cochinillas); *Cacopsylla pyricola* Foerster (lechón de pera); *Trioza diospyri* Ashmead (lechón de caqui). Los compuestos de la presente invención también tienen actividad comercialmente significativa sobre miembros del orden de los lepidópteros (p. ej., *Alabama argillacea* Hubner (gusano de la hoja del algodónero), *Archips argyrospila* Walker (rodillo de la hoja del árbol frutal), *A. rosana* Linnaeus (enrollador europeo de la hoja) y otras especies de *Archips*, *Chilo suppressalis* Walker (barrenador del tallo del arroz), *Cnaphalocrosis medinalis* Guenee (enrollador de la hoja del arroz), *Crambus caliginosellus* Clemens (gusano telarañero de la raíz del maíz), *Crambus teterrellus* Zincken (gusano telarañero del césped azul), *Cydia pomonella* Linnaeus (polilla de la manzana), *Earias insulana* Boisduval (gusano espinoso de la cápsula), *Earias vittella* Fabricius (gusano manchado de la cápsula), *Helicoverpa armigera* Hübner (gusano americano de la cápsula), *Helicoverpa zea* Boddie (gusano de la espiga), *Heliothis virescens* Fabricius

(gusano de la yema del tabaco), *Herpetogramma licarsisalis* Walker (gusano telarañero del césped), *Lobesia botrana* Denis y Schiffertnüller (polilla de la uva), *Pectinophora gossypiella* Saunders (gusano rosado de la cápsula), *Phyllocnistis citrella* Stainton (minador de los cítricos), *Pieris brassicae* Linnaeus (mariposa blanca grande), *Pieris rapae* Linnaeus (mariposa blanca pequeña), *Plutella xylostella* Linnaeus (polilla de la remolacha), *Spodoptera exigua* Hubner (gusano de la remolacha), *Spodoptera litura* Fabricius (gusano cortador del tabaco, oruga del racimo), *Spodoptera frugiperda* J. E. Smith (gusano militar del otoño), *Trichoplusia ni* Hübner (gusano de la col) y *Tuta absoluta* Meyrick (gusano minador del tomate).

Los compuestos también tienen actividad en miembros de la orden de hemípteros que incluyen: *Acrostemum hilare* Say (chinche apestoso verde), *Anasa tristis* De Geer (chinche de la calabaza), *Blissus leucopterus* Say (chinche del algodón), *Corythuca gossypii* Fabricius (chinche del encaje del algodón), *Cyrtopeltis modesta* Distant (chinche del tomate), *Dysdercus suturellus* Herrich-Schäffer (chinche del algodón), *Euchistus servus* Say (chinche apestoso marrón), *Euchistus variolarius* Palisot de Beauvois (chinche apestoso de una mancha), *Graptostethus* spp. (complejo de chinches de la semilla), *Leptoglossus corculus* Say (chinche de la semilla del pino con patas de hoja), *Lygus lineolaris* Palisot de Beauvois (chinche de la planta deslustrada), *Nezara viridula* Linnaeus (chinche apestoso verde meridional), *Oebalus pugnax* Fabricius (chinche apestoso del arroz), *Oncopeltus fasciatus* Dallas (chinche grande del algodonero), *Pseudatomoscelis seriatus* Reuter (pulgón del algodón).

Otras órdenes de insectos controlados por los compuestos de la presente invención incluyen: Thysanoptera (p. ej., *Frankliniella occidentalis* Pergande (trip occidental de las flores), *Scirtothrips citri* Moulton (trips de los cítricos), *Sericothrips variabilis* Beach (trips de la soja) y *Thrips tabaci* Lindeman (trips de la cebolla); y el orden Coleoptera (p. ej., *Leptinotarsa decemlineata* Say (escarabajo de la patata de Colorado), *Epilachna varivestis* Mulsant (escarabajo

mexicano de la judía) y gusanos de alambre de los géneros *Agriotes*, *Athous* o *Limonium*).

Particularmente, los compuestos de fórmula (I), sus N-óxidos, sus estereoisómeros, sus polimorfos y sus sales son especialmente adecuadas para combatir de manera eficaz las siguientes plagas: Los insectos del orden de lepidópteros (Lepidoptera), por ejemplo *Agrotis ypsilon*, *Agrotis segetum*, *Alabama argillacea*, *Anticarsia gemmatilis*, *Argyresthia conjugella*, *Autographa gamma*, *Bupalus piniarius*, *Cacoecia murinana*, *Capua reticulana*, *Cheimatobia brumata*, *Chilo infuscatellus*, *Choristoneura fumiferana*, *Choristoneura occidentalis*, *Cirphis unipuncta*, *Cydia pomonella*, *Dendrolimus pini*, *Diaphania nitidalis*, *Diatraea grandiosella*, *Earias insulana*, *Earias vittella*, *Elasmopalpus lignosellus*, *Eupoecilia ambiguella*, *Evetria bouliana*, *Feltia subterranea*, *Galleria mellonella*, *Grapholita funebrana*, *Grapholita molesta*, *Helicoverpa armigera*, *Helicoverpa virescens*, *Helicoverpa zea*, *Hellula undalis*, *Hibernia defoliaria*, *Hyphantria cunea*, *Hyponomeuta malinellus*, *Keiferia lycopersicella*, *Lambdina fiscellaria*, *Laphygma exigua*, *Leucoptera coffeella*, *Leucoptera scitella*, *Lithocolletis blancardella*, *Lobesia botrana*, *Loxostege sticticalis*, *Leucinodes orbonalis*, *Lymantria dispar*, *Lymantria monacha*, *Lyonetia clerkella*, *Malacosoma neustria*, *Mamestra brassicae*, *Orgyia pseudotsugata*, *Ostrinia nubilalis*, *Panolis flammea*, *Pectinophora gossypiella*, *Peridroma saucia*, *Phalera bucephala*, *Phthorimaea operculella*, *Phyllocnistis citrella*, *Pieris brassicae*, *Plathypena scabra*, *Plutella xylostella*, *Pseudoplusia includens*, *Rhyacionia frustrana*, *Scirpophaga incertulas*, *Scrobipalpula absoluta*, *Sitotroga cerealella*, *Sparganothis pilleriana*, *Spodoptera frugiperda*, *Spodoptera littoralis*, *Spodoptera litura*, *Spodoptera exigua*, *Thaumatopoea pityocampa*, *Tortrix viridana*, *Trichoplusia ni* and *Zeiraphera canadensis*; y

Los escarabajos (Coleoptera), por ejemplo *Agrilus sinuatus*, *Agriotes lineatus*, *Agriotes obscurus*, *Amphimallus solstitialis*, *Anisandrus dispar*, *Anthonomus grandis*, *Anthonomus pomorum*, *Aphthona euphoridae*, *Athous haemorrhoidalis*, *Atomaria linearis*, *Blastophagus piniperda*, *Blitophaga undata*, *Bruchus*

rufimanus, *Bruchus pisorum*, *Bruchus lentis*, *Byctiscus betulae*, *Cassida nebulosa*, *Cerotoma trifurcata*, *Cetonia aurata*, *Ceuthorrhynchus assimilis*, *Ceuthorrhynchus napi*, *Chaetocnema tibialis*, *Conoderus vespertinus*, *Crioceris asparagi*, *Ctenicera ssp.*, *Diabrotica longicornis*, *Diabrotica semipunctata*, *Diabrotica undecimpunctata*, *Diabrotica speciosa*, *Diabrotica virgifera*, *Epilachna varivestis*, *Epitrix hirtipennis*, *Eutinobothrus brasiliensis*, *Hylobius abietis*, *Hypera brunneipennis*, *Hypera postica*, *Ips typographus*, *Lema bilineata*, *Lema melanopus*, *Leptinotarsa decemlineata*, *Limonius californicus*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Melanotus communis*, *Meligethes aeneus*, *Melolontha hippocastani*, *Melolontha*, *Oulema oryzae*, *Otiorrhynchus sulcatus*, *Otiorrhynchus ovatus*, *Phaedon cochleariae*, *Phyllobius pyri*, *Phyllotreta chrysocephala*, *Phyllophaga sp.*, *Phyllopertha horticola*, *Phyllotreta nemorum*, *Phyllotreta striolata*, *Popillia japonica*, *Sitona lineatus* and *Sitophilus granaria*; moscas, mosquitos (Diptera), p. ej. *Aedes aegypti*, *Aedes albopictus*, *Aedes vexans*, *Anastrepha ludens*, *Anopheles maculipennis*, *Anopheles crucians*, *Anopheles albimanus*, *Anopheles gambiae*, *Anopheles freeborni*, *Anopheles leucosphyrus*, *Anopheles minimus*, *Anopheles quadrimaculatus*, *Calliphora vicina*, *Ceratitis capitata*, *Chrysomya bezziana*, *Chrysomya hominivorax*, *Chrysomya macellaria*, *Chrysops discalis*, *Chrysops silacea*, *Chrysops atlanticus*, *Cochliomyia hominivorax*, *Contarinia sorghicola*, *Cordylobia anthropophaga*, *Culicoides furens*, *Culex pipiens*, *Culex nigripalpus*, *Culex quinquefasciatus*, *Culex tarsalis*, *Culiseta inornata*, *Culiseta melanura*, *Dacus cucurbitae*, *Dacus oleae*, *Dasineura brassicae*, *Delia antiqua*, *Delia coarctata*, *Delia platura*, *Delia radicum*, *Dermatobia hominis*, *Fannia canicularis*, *Geomyza tripunctata*, *Gasterophilus intestinalis*, *Glossina morsitans*, *Glossina palpalis*, *Glossina fuscipes*, *Glossina tachinoides*, *Haematobia irritans*, *Haplodiplosis equestris*, *Hippelates spp.*, *Hylemyia platura*, *Hypoderma lineata*, *Leptoconops torrens*, *Liriomyza sativae*, *Liriomyza trifolii*, *Lucilia caprina*, *Lucilia cuprina*, *Lucilia sericata*, *Lycoria pectoralis*, *Mansonia titillanus*, *Mayetiola destructor*, *Musca autumnalis*, *Musca domestica*, *Muscina stabulans*, *Oestrus ovis*, *Opomyza florum*, *Oscinella frit*, *Pegomya hysocyami*, *Phorbia antiqua*,

Phorbia brassicae, *Phorbia coarctata*, *Phlebotomus argentipes*, *Psorophora columbiae*, *Psila rosae*, *Psorophora discolor*, *Prosimulium mixtum*, *Rhagoletis cerasi*, *Rhagoletis pomonella*, *Sarcophaga haemorrhoidalis*, *Sarcophaga* spp., *Simulium vittatum*, *Stomoxys calcitrans*, *Tabanus bovinus*, *Tabanus atratus*, *Tabanus lineola*, and *Tabanus similis*, *Tipula oleracea*, and *Tipula paludosa*; termites (Isoptera), p. ej. *Calotermes flavicollis*, *Leucotermes flavipes*, *Heterotermes aureus*, *Reticulitermes flavipes*, *Reticulitermes virginicus*, *Reticulitermes lucifugus*, *Reticulitermes santonensis*, *Reticulitermes grassei*, *Termes natalensis*, and *Coptotermes formosanus*; cucarachas (Blattaria Blattodea), p. ej. *Blattella germanica*, *Blattella asahinae*, *Periplaneta americana*, *Periplaneta japonica*, *Periplaneta brunnea*, *Periplaneta fuliginosa*, *Periplaneta australasiae*, y *Blatta orientalis*; hormigas, abejas, avispa, sínfitos (Hymenoptera), p. ej. *Athalia rosae*, *Atta cephalotes*, *Atta capiguara*, *Atta cephalotes*, *Atta laevigata*, *Atta robusta*, *Atta sexdens*, *Atta texana*, *Crematogaster* spp., *Hoplocampa minuta*, *Hoplocampa testudinea*, *Lasius niger*, *Monomorium pharaonis*, *Solenopsis geminata*, *Solenopsis invicta*, *Solenopsis richteri*, *Solenopsis xyloni*, *Pogonomyrmex barbatus*, *Pogonomyrmex californicus*, *Pheidole megacephala*, *Dasymutilla occidentalis*, *Bombus* spp., *Vespula squamosa*, *Paravespula vulgaris*, *Paravespula pennsylvanica*, *Paravespula germanica*, *Dolichovespula maculata*, *Vespa crabro*, *Polistes rubiginosa*, *Camponotus floridanus* y *Linepithema humile*; grillos, saltamontes, langostas (Orthoptera), p. ej., *Acheta domestica*, *Gryllotalpa*, *Locusta migratoria*, *Melanoplus bivittatus*, *Melanoplus femurrubrum*, *Melanoplus mexicanus*, *Melanoplus sanguinipes*, *Melanoplus spretus*, *Nomadacris septemfasciata*, *Schistocerca americana*, *Schistocerca gregaria*, *Dociostaurus maroccanus*, *Tachycines asynamorus*, *Oedaleus senegalensis*, *Zonozerus variegatus*, *Hieroglyphus daganensis*, *Kraussaria angulifera*, *Calliptamus italicus*, *Chortoicetes terminifera* y *Locustana pardalina*; Araneida, p. ej., *Latrodectus mactans* y *Loxosceles reclusa*; pulgas (Siphonaptera), p. ej., *Ctenocephalides felis*, *Ctenocephalides canis*, *Xenopsylla cheopis*, *Pulex irritans*, *Tunga*

penetrans y *Nosopsyllus fasciatus*, *lepisma*, *termobia* (Thysanura), *p. ej.*, *Lepisma saccharina* y *Thermobia domestica*, centípedos (*Chilopoda*), *p. ej.*, *Scutigera oleoptrata*, millípedos (*Diplopoda*), *p. ej.*, *Narceus spp.*, Earwigs (*Dermaptera*), *p. ej.*, *forficula auricularia*, piojos (*Phthiraptera*), *p. ej.*, *Pediculus humanus capitis*, *Pediculus humanus corporis*, *Pthirus pubis*, *Haematopinus eurysternus*, *Haematopinus suis*, *Linognathus vituli*, *Bovicola bovis*, *Menopon allinae*, *Menacanthus stramineus* y *Solenopotes capillatus*. Colémbolos , *p. ej.* *Onychiurus ssp.*

También son adecuados para controlar nemátodos: nemátodos parásitos vegetales tales como nemátodos noduladores de la raíz, *Meloidogyne hapla*, *Meloidogyne incognita*, *Meloidogyne javanica* y otras especies de *Meloidogyne*; nemátodos que forman quistes, *Globodera rostochiensis* y otras especies de *Globodera*; *Heterodera avenae*, *Heterodera glycines*, *Heterodera schachtii*, *Heterodera trifolii*, y otras especies de *Heterodera*; nemátodos de bilis de semilla, *Anguina species*; nemátodos de tallo y follaje, especies de *Aphelenchoides*; nemátodos de *Sting*, *Belonolaimus longicaudatus* y otras especies de *Belonolaimus*; nemátodos de pino, *Bursaphelenchus xylophilus* y otras especies de *Bursaphelenchus*; nemátodos de *Ring*, especies de *Criconema*, especies de *Criconemella*, especies de *Criconemoides*, especies de *Mesocriconema*; nemátodos de tallo y bulbo, *Ditylenchus destructor*, *Ditylenchus dipsaci* y otras especies de *Ditylenchus*; nemátodos de *Awl*, especies de *Dolichodorus*; nemátodos de *Spiral*, *Heliocotylenchus multicinctus* y otras especies de *Helicotylenchus*; nemátodos de vaina y sheathoid, especies de *Hemicycliophora* y especies de *Hemicriconemoides*; especies de *Hirshmanniella*; nemátodos de *Lance*, especies de *Hoploaimus*; nemátodos nodulares de raíz falsa, especies de *Nacobbus*; nemátodos de *Needle*, *Longidorus elongatus* y otras especies de *Longidorus*; nemátodos de *Lesion*, *Pratylenchus neglectus*, *Pratylenchus penetrans*, *Pratylenchus curvatus*, *Pratylenchus goodeyi* y otras especies de *Pratylenchus*; nemátodos de *Burrowing*, *Radopholus similis* y otras especies de *Radopholus*; nemátodos de *Reniform*, *Rotylenchus robustus* y otras especies de

Rotylenchus; especies de *Scutellonema*; nemátodos de raíz *Stubby*, *Trichodorus primitivus* y otras especies de *Trichodorus*, especies de *Paratrichodorus*; nemátodos de *Stunt*, *Tylenchorhynchus claytoni*, *Tylenchorhynchus dubius* y otras especies de *Tylenchorhynchus*; nemátodos de *Citrus*, especies de *Tylenchulus*; nemátodos de *Dagger*, especies de *Xiphinema*; y otras especies de nemátodos parásitos vegetales.

Los compuestos de fórmula (I) y sus sales son útiles también para controlar arácnidos (Arachnoidea), tales como acaríes (Acarina), por ejemplo de las familias *Argasidae*, *Ixodidae* and *Sarcoptidae*, tales como *Amblyomma americanum*, *Amblyomma variegatum*, *Argas persicus*, *Boophilus annulatus*, *Boophilus decoloratus*, *Boophilus microplus*, *Dermacentor silvarum*, *Hyalomma truncatum*, *Ixodes ricinus*, *Ixodes rubicundus*, *Ornithodoros moubata*, *Otobius megnini*, *Dermanyssus gallinae*, *Psoroptes ovis*, *Rhipicephalus appendiculatus*, *Rhipicephalus evertsi*, *Sarcoptes scabiei*, y *Eriophyidae* spp. tales como *Aculus schlechtendali*, *Phyllocoptrata oleivora* y *Eriophyes sheldoni*; *Tarsonemidae* spp. tales como *Phytonemus pallidus* y *Polyphagotarsonemus latus*; *Tenuipalpidae* spp. tales como *Brevipalpus phoenicis*; *Tetranychidae* spp. tales como *Tetranychus cinnabarinus*, *Tetranychus kanzawai*, *Tetranychus pacificus*, *Tetranychus telarius* y *Tetranychus urticae*, *Panonychus ulmi*, *Panonychus citri* y *oligonychus pratensis*.

En otra realización, la presente invención proporciona los compuestos de fórmula (I) como compuestos activos y útiles para controlar los insectos seleccionados de insectos succionadores o perforadores tales como insectos del género tisanópteros, Díptera y hemípteros, en particular las siguientes especies:

Tisanópteros: *Frankliniella fusca*, *Frankliniella occidentalis*, *Frankliniella tritici*, *Scirtothrips citri*, *Thrips oryzae*, *Thrips palmi* y *Thrips tabaci*,

Díptera: p. ej. *Aedes aegypti*, *Aedes albopictus*, *Aedes vexans*, *Anastrepha ludens*, *Anopheles maculipennis*, *Anopheles crucians*, *Anopheles albimanus*, *Anopheles gambiae*, *Anopheles freeborni*, *Anopheles leucosphyrus*, *Anopheles minimus*, *Anopheles quadrimaculatus*, *Calliphora vicina*, *Ceratitis capitata*,

Chrysomya bezziana, *Chrysomya hominivorax*, *Chrysomya macellaria*, *Chrysops discalis*, *Chrysops silacea*, *Chrysops atlanticus*, *Cochliomyia hominivorax*, *Contarinia sorghicola*, *Cordylobia anthropophaga*, *Culicoides furens*, *Culex pipiens*, *Culex nigripalpus*, *Culex quinquefasciatus*, *Culex tarsalis*, *Culiseta inornata*, *Culiseta melanura*, *Dacus cucurbitae*, *Dacus oleae*, *Dasineura brassicae*, *Delia antique*, *Delia coarctata*, *Delia platura*, *Delia radicum*, *Dermatobia hominis*, *Fannia canicularis*, *Geomyza Tripunctata*, *Gasterophilus intestinalis*, *Glossina morsitans*, *Glossina palpalis*, *Glossina fuscipes*, *Glossina tachinoides*, *Haematobia irritans*, *Haplodiplosis equestris*, *Hippelates spp.*, *Hylemyia platura*, *Hypoderma lineata*, *Leptoconops torrens*, *Liriomyza sativae*, *Liriomyza trifolii*, *Lucilia caprina*, *Lucilia cuprina*, *Lucilia sericata*, *Lycoria pectoralis*, *Mansonia titillanus*, *Mayetiola destructor*, *Musca autumnalis*, *Musca domestica*, *Muscina stabulans*, *Oestrus ovis*, *Opomyza florum*, *Oscinella frit*, *Pegomya hysocyami*, *Phorbia antiqua*, *Phorbia brassicae*, *Phorbia coarctata*, *Phlebotomus argentipes*, *Psorophora columbiae*, *Psila rosae*, *Psorophora discolor*, *Prosimulium mixtum*, *Rhagoletis cerasi*, *Rhagoletis pomonella*, *Sarcophaga haemorrhoidalis*, *Sarcophaga spp.*, *Simulium vittatum*, *Stomoxys calcitrans*, *Tabanus bovinus*, *Tabanus atratus*, *Tabanus lineola* y *Tabanus similis*, *Tipula oleracea* y *Tipula paludosa*;

Hemípteros, en particular áfidos: *Acyrtosiphon onobrychis*, *Adelges laricis*, *Aphidula nasturtii*, *Aphis fabae*, *Aphis forbesi*, *Aphis pomi*, *Aphis gossypii*, *Aphis grossulariae*, *Aphis schneideri*, *Aphis spiraecola*, *Aphis sambuci*, *Acyrtosiphon pisum*, *Aulacorthum solani*, *Brachycaudus cardui*, *Brachycaudus helichrysi*, *Brachycaudus persicae*, *Brachycaudus prunicola*, *Brevicoryne brassicae*, *Capitophorus horni*, *Cerosipha gossypii*, *Chaetosiphon fragaefolii*, *Cryptomyzus ribis*, *Dreyfusia nordmannianae*, *Dreyfusia piceae*, *Dysaphis radicola*, *Dysaulacorthum pseudosolani*, *Dysaphis plantaginea*, *Dysaphis pyri*, *Empoasca fabae*, *Hyalopterus pruni*, *Hyperomyzus lactucae*, *Macrosiphum avenae*, *Macrosiphum euphorbiae*, *Macrosiphon rosae*, *Megoura viciae*, *Melanaphis pyriarius*, *Metopolophium dirhodum*, *Myzodes persicae*, *Myzus ascalonicus*,

Myzus cerasi, *Myzus varians*, *Nasonovia ribis-nigri*, *Nilaparvata lugens*, *Pemphigus bursarius*, *Perkinsiella saccharicida*, *Phorodon humuli*, *Psylla mali*, *Psylla piri*, *Rhopalomyzus ascalonicus*, *Rhopalosiphum maidis*, *Rhopalosiphum padi*, *Rhopalosiphum insertum*, *Sappaphis mala*, *Sappaphis mali*, *Schizaphis graminum*, *Schizoneura lanuginosa*, *Sitobion avenae*, *Trialeurodes vaporariorum*, *Toxoptera aurantii* and *Viteus vitifolii*.

En una realización preferida, la presente invención de los compuestos de fórmula (I) son especialmente útiles para controlar, por ejemplo, el trip occidental de las flores (*Frankliniella occidentalis*), la chicharrita de la patata (*Empoasca fabae*), la chicharrita del arroz (*Nilaparvata lugens*), la chicharrita verde del arroz (*Nephotettix virescens*), el pulgón del algodón/melón (*Aphis gossypii*), el pulgón verde del melocotonero (*Myzus persicae*), la mosca blanca del tabaco/camote (*Bemisia tabaci*) y la mosca blanca de la hoja plateada (*Bemisia argentifolii*).

En una realización, la presente invención se refiere, además, a una composición que comprende una cantidad biológicamente eficaz del compuesto de fórmula (I) y al menos otro compuesto biológico activo compatible seleccionado de fungicidas, insecticidas, nematocidas, acaricidas, bioplaguicidas, herbicidas, reguladores de crecimiento vegetal, antibióticos, fertilizantes o nutrientes. Los compuestos utilizados en la composición y en combinación con el compuesto de fórmula (I) también se denominan compuestos compatibles activos.

Los fungicidas, insecticidas, nematocidas, acaricidas, biopesticidas, herbicidas, reguladores de crecimiento de planta, bioestimulantes, antibióticos y nutrientes conocidos e informados pueden combinarse con al menos un compuesto de la Fórmula (I) de la presente divulgación. Por ejemplo, fungicidas, insecticidas, nematocidas, acaricidas, biopesticidas, herbicidas, reguladores de crecimiento de planta, bioestimulantes, antibióticos, fertilizantes y nutrientes divulgados e informados en WO2016156129 y o WO2017153200 puede combinarse con al menos un compuesto de la fórmula (I) de la presente divulgación.

En determinadas instancias, las combinaciones con otros compuestos o agentes de control de plagas de invertebrados, que tienen un espectro similar de control,

pero un modo de acción diferente, será particularmente beneficiosa para la gestión de la resistencia. Por lo tanto, las composiciones de la presente invención pueden comprender una cantidad biológicamente eficaz de al menos otro compuesto o agente de control de plagas de invertebrados que tienen un espectro similar de control, pero un modo de acción diferente. El contacto de una planta genéticamente modificada para expresar un compuesto de protección a la planta (p. ej., proteína) o el lugar de la planta con una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto de la invención también puede proporcionar un espectro más amplio de protección a la planta y puede ser beneficioso para la gestión de la resistencia.

En una realización de la presente invención, la cantidad biológicamente eficaz del compuesto de fórmula (I) en las composiciones varía de 0,1 a 99% por peso con respecto al peso total de la composición, preferentemente de 5 a 50% por peso con respecto al peso total de la composición.

La presente invención se refiere, además, a un método para combatir plagas de insectos y ácaros, dicho método que comprende contactar las plagas de insectos y ácaros, su hábitat, su terreno fértil, sus fuentes de alimento, la planta, semilla, suelo, área, material o entorno en el que las plagas de insectos y ácaros crecen o pueden crecer; o con los materiales, plantas, semillas, suelos, superficies o espacios que se quieren proteger de un ataque o infestación de la plaga, con una cantidad biológicamente eficaz del compuesto o la composición de la presente invención.

Las plagas de invertebrados se controlan y la protección de los cultivos agronómicos, hortícolas y de especialidades, la salud animal y humana se consigue al aplicar uno o más de los compuestos de la presente invención, en una cantidad eficaz, al entorno de las plagas, incluido el locus agronómico y/o no agronómico de infestación, al área a proteger, o directamente sobre las plagas a controlar. Por lo tanto, la presente invención comprende además un método para el control de invertebrados que habitan foliarmente y en el suelo y la protección de cultivos agronómicos y/o no agronómicos, que comprende contactar con los

invertebrados o su entorno con una cantidad biológicamente eficaz de uno o más de los compuestos de la presente invención, o con una composición que comprende al menos uno de dichos compuestos o una composición que comprende al menos uno de dichos compuestos y una cantidad eficaz de al menos un compuesto o agente biológicamente activo adicional. Un método preferido de contacto es mediante pulverización. De manera alternativa, una composición granular que comprende un compuesto de la presente invención puede aplicarse al follaje de la planta o al suelo. Los compuestos de la presente invención son eficaces en el suministro a través de la absorción de plantas mediante el contacto de la planta con una composición que comprende un compuesto de la presente invención aplicado como un empapado del suelo de una formulación líquida, una formulación granular al suelo, un tratamiento de caja de vivero o un goteo de trasplantes. Otros métodos de contacto incluyen la aplicación de un compuesto o una composición de la presente invención mediante pulverizaciones directas y residuales, pulverizaciones aéreas, recubrimientos de semillas, microencapsulaciones, absorción sistémica, cebos, crotales, bolos, nebulizadores, fumigantes, aerosoles, polvos y muchos otros. Los compuestos de la presente invención pueden incorporarse en cebos que los invertebrados consumen o dentro de dispositivos tales como trampas o similares. Los gránulos o cebos que comprenden entre 0,01% a 5% de ingrediente activo, 0,05% a 10% de agente de retención de humedad y 40% a 99% de harina vegetal son eficaces en el control de insectos de suelo en velocidades de aplicación muy bajas, particularmente en dosis de ingredientes activos que son letales mediante ingestión en lugar de contacto directo. Los compuestos de la presente invención se pueden aplicar en estado puro, pero lo más frecuente es que la aplicación sea de una formulación que comprende uno o más compuestos con transportadores, diluyentes y tensioactivos adecuados y posiblemente en combinación con un alimento dependiendo del uso final contemplado. Un método de aplicación preferido implica la pulverización de una solución de dispersión de agua o aceite refinado de los compuestos. Las combinaciones con aceites de pulverización,

concentraciones de aceite de pulverización, esparcidor, adhesivos, adyuvantes, otros solventes y sinergistas tales como el butóxido de piperonilo suelen aumentar la eficacia del compuesto.

La tasa de aplicación necesaria para un control eficaz (es decir, la “cantidad biológicamente eficaz”) dependerá de tales factores como la especie de invertebrado que se desea controlar, el ciclo vital de la plaga, la fase vital, su tamaño, ubicación, época del año, cultivo o animal hospedador, comportamiento alimentario, comportamiento de apareamiento, humedad ambiental, temperatura y otros similares. En circunstancias normales, las velocidades de aplicación de aproximadamente 0,01 a 2 kg de ingrediente activo por hectárea son suficientes para controlar plagas en ecosistemas agronómicos, pero la menor cantidad de 0,0001 kg por hectárea puede ser suficiente o puede requerirse tanto como 8 kg/hectárea. Para aplicaciones no agronómicas, las dosis de uso eficaces oscilarán entre aproximadamente 1,0 y 50 mg/metro cuadrado, pero puede ser suficiente con tan solo 0,1 mg/metro cuadrado o pueden ser necesarios hasta 150 mg/metro cuadrado. Un experto en la técnica puede determinar fácilmente la cantidad biológicamente eficaz necesaria para la cantidad deseada del control de plagas de invertebrados.

La plaga animal, es decir, los insectos, arácnidos y nematodos, la planta, el suelo o el agua en que crece la planta pueden ponerse en contacto con los compuestos de fórmula (I), sus N-óxidos y sales o las composiciones que los contienen mediante cualquier método de aplicación conocido en la técnica. Como tal, “contacto” incluye tanto el contacto directo (al aplicar los compuestos/composiciones directamente sobre la plaga animal o planta típicamente al follaje, tallo o raíces de la planta) como el contacto indirecto (al aplicar los compuestos/composiciones al locus de la plaga animal o planta).

Los compuestos de la presente invención o las composiciones plaguicidas que los comprenden se pueden utilizar para proteger plantas y cultivos en crecimiento de un ataque o infestación por plagas animales, especialmente insectos, ácaros o arácnidos mediante el contacto de la planta/cultivo con una cantidad plaguicida

eficaz de al menos un compuesto de la presente invención. El término “cultivo” se refiere tanto a los cultivos en crecimiento como a los cosechados.

Por consiguiente, la presente invención se refiere a un método para proteger los cultivos de un ataque o infestación por plagas de insectos y ácaros, que comprende poner en contacto el cultivo con una cantidad biológicamente eficaz del compuesto o la composición de la presente invención, isómero, polimorfo, N-óxido o una sal de este.

Los compuestos de la presente invención se emplean como tales o en forma de composiciones que tratan los insectos o las plantas, materiales de propagación de plantas, tales como semillas, suelo, superficies, materiales o habitaciones a proteger del ataque insecticida con una cantidad insecticida eficaz de los compuestos activos. La aplicación puede realizarse tanto antes como después de la infección de las plantas, materiales de propagación de plantas, tales como semillas, suelo, superficies, materiales o habitaciones por los insectos.

En consecuencia, la presente invención también se refiere a un método para la protección de las semillas de los insectos del suelo y de las raíces y brotes de las plántulas de los insectos del suelo y foliares que comprende el contacto de las semillas antes de la siembra y/o después de la pregerminación con el compuesto o la composición de la presente invención, N-óxido o sal de este.

Además, la presente invención se refiere a un método para tratar o proteger animales contra la infestación o infección por parásitos que comprende administrar o aplicar a los animales por vía oral, tópica o parenteral una cantidad biológicamente eficaz del compuesto o composición de la presente invención, isómero, polimorfo, N-óxido o una sal veterinaria aceptable de este.

Para usar en el tratamiento de las plantas de cultivo, la tasa de aplicación (al aplicar dosis eficaces) del compuesto de la presente invención puede estar en el intervalo de 1 gai a 5000 gai por hectárea en cultivos agrícolas u hortícolas, preferentemente de 25 g a 600 g por hectárea, más preferentemente de 35 g a 300 g por hectárea.

Los compuestos y las composiciones de la presente invención son particularmente útiles en el control de multitud de insectos en diversas plantas cultivadas, tales como cereales, tubérculos, oleaginosas, hortalizas, especias, plantas ornamentales, por ejemplo semillas de trigo duro y otros trigos, cebada, avena, centeno, maíz (maíz forrajero y maíz azucarero/maíz dulce y de campo), soja, oleaginosas, crucíferas, algodón, girasoles, plátanos, arroz, colza oleaginosa, nabina, remolacha azucarera, remolacha forrajera, berenjenas, patatas, hierba, césped, césped forrajero, tomates, puerros, calabaza/calabaza, col, lechuga iceberg, pimiento, pepinos, melones, especies Brassica, melones, judías, guisantes, ajos, cebollas, zanahorias, plantas tuberosas como las patatas, caña de azúcar, tabaco, uvas, petunias, geranios/pelargonios, pensamientos e impatiens.

En particular, el compuesto o la composición de la presente invención son útiles para proteger cultivos agrícolas tales como cereales, maíz, arroz, soja y otras leguminosas, frutas y árboles frutales, uvas, nueces y árboles de frutos secos, cítricos y árboles de cítricos, cualquier planta hortícola, cucurbitáceas, plantas oleaginosas, tabaco, café, té, cacao, remolacha azucarera, caña de azúcar, algodón, papa, tomate, cebollas, pimientos y otras hortalizas, y plantas ornamentales.

La presente invención también se refiere a procesos para preparar el compuesto seleccionado de la Fórmula (I).

Los compuestos de la presente invención son eficaces tanto por contacto (a través del suelo, vidrio, pared, mosquitera, alfombra, partes de plantas o partes de animales), como por ingestión (cebo o parte de la planta).

Los compuestos de la presente invención también se pueden aplicar contra plagas de insectos y ácaros no relacionados con los cultivos, tales como hormigas, termitas, avispa, moscas, mosquitos, grillos o cucarachas. Para su uso contra dichas plagas no relacionadas con los cultivos, los compuestos de la presente invención se utilizan preferentemente en una composición de cebo.

El cebo puede ser una preparación líquida, sólida o semisólida (p. ej., un gel). Los cebos sólidos pueden adoptar diversas formas, p. ej., gránulos, bloques, palos o discos. Los cebos líquidos se pueden introducir en diversos dispositivos para garantizar una aplicación adecuada, p. ej., recipientes abiertos, dispositivos de pulverización, fuentes de gotas o fuentes de evaporación. Los geles se pueden basar en matrices acuosas o aceitosas y se pueden formular según necesidades particulares en términos de pegajosidad, retención de humedad o características de envejecimiento.

El cebo empleado en la composición es un producto suficientemente atractivo para incitar a insectos tales como hormigas, termitas, avispas, moscas, mosquitos, grillos, etc. o cucarachas a comerlo. El atractivo se puede manipular mediante estimulantes de la alimentación o feromonas sexuales. Los estimulantes alimentarios se eligen, por ejemplo, a mero título enunciativo, entre proteínas animales y/o vegetales (harina de carne, pescado o sangre, partes de insectos, yema de huevo), grasas y aceites de origen animal y/o vegetal, o mono-, oligo- o poliorganosacáridos, especialmente sacarosa, lactosa, fructosa, dextrosa, glucosa, almidón, pectina o incluso melaza o miel. Las partes frescas o en descomposición de frutas, cultivos, plantas, animales, insectos o partes específicas de estos también pueden servir como estimulantes de la alimentación. Se sabe que las feromonas sexuales son más específicas para los insectos. Las feromonas específicas se describen en la literatura y son conocidas por los expertos en la materia.

Para su uso en composiciones de cebo, el contenido típico de ingrediente activo es de 0,001% en peso a 15% en peso, deseablemente de 0,001% en peso a 5% en peso del compuesto activo.

Las formulaciones de compuestos de la presente invención como aerosoles (p. ej., en botes pulverizadores), pulverizadores de aceite o pulverizadores de bomba son muy adecuadas para el usuario no profesional para controlar plagas tales como moscas, pulgas, garrapatas, mosquitos o cucarachas. Las recetas en aerosol se componen preferentemente del compuesto activo, de solventes tales

como alcoholes inferiores (p. ej., metanol, etanol, propanol, butanol), de cetonas (p. ej., acetona, metiletilcetona), hidrocarburos parafínicos (p. ej., querosenos) con intervalos de ebullición de aproximadamente 50 a 250 °C, dimetilformamida, N-metilpirrolidona, dimetilsulfóxido, hidrocarburos aromáticos tales como tolueno, xileno, agua, además de auxiliares como emulgentes como monooleato de sorbitol, etoxilato de oleilo con 3-7 mol de óxido de etileno, etoxilato de alcohol graso, aceites de perfume tales como aceites etéreos, ésteres de ácidos grasos medios con alcoholes inferiores, compuestos carbonílicos aromáticos, en su caso de estabilizantes tales como benzoato de sodio, tensioactivos anfóteros, epóxidos inferiores, ortoformato de trietilo y, en su caso, propulsores como propano, butano, nitrógeno, aire comprimido, éter dimetílico, dióxido de carbono, óxido nitroso o mezclas de estos gases.

Las formulaciones de pulverización de aceite difieren de las recetas de aerosol en que no se utilizan propelentes. Para su uso en composiciones de pulverización, el contenido de ingrediente activo oscila entre 0,001% y 80% en peso, preferentemente entre 0,01% y 50% en peso y más preferentemente entre 0,01% y 15% en peso.

Los compuestos de la presente invención y sus respectivas composiciones también se pueden utilizar en espirales antimosquitos y fumigadoras, cartuchos de humo, placas vaporizadoras o vaporizadores de larga duración y también en papeles antipolillas, almohadillas antipolillas u otros sistemas vaporizadores independientes del calor.

Los métodos para controlar enfermedades infecciosas transmitidas por insectos (p. ej., malaria, dengue y fiebre amarilla, filariasis linfática y leishmaniasis) con compuestos de fórmula (I) y sus respectivas composiciones también comprenden el tratamiento de superficies de cabañas y casas, la pulverización de aire y la impregnación de cortinas, tiendas de campaña, prendas de vestir, mosquiteras, trampas para la mosca tse-tsé o similares. Las composiciones insecticidas para su aplicación a fibras, tejidos, géneros de punto, telas no tejidas, material de red o láminas y lonas comprenden preferentemente una

mezcla que incluye el insecticida, opcionalmente un repelente y al menos un aglutinante. Los repelentes adecuados, por ejemplo, son *N,N*-dietil-meta-toluamida (DEET), *N,N*-dietilfenilacetamida (DEPA), 1-(3-ciclohexan-1-il-carbonil)-2-metilpiperina, lactona de ácido (2hidroximetillociclohexil)acético, 2-etil-1,3-hexandiol, indalona, metilneodecanamida (MNDA), un piretroide no utilizado para el control de insectos tales como 4-oxociclopent-2-(+)-enil-(+)-trans-crisantemato de {(+/-)-3-alil-2-metilo (Esbiothrin), un repelente derivado de extractos de plantas o idéntico a estos, como limoneno, eugenol, (+)-Eucamalol (1), (-)-l-epi-eucamalol o extractos de planta crudos a partir de plantas como *Eucalyptus maculata*, *Vitex rotundifolia*, *Cymbopogon martinii*, *Cymbopogon citratus* (limoncillo), *Cymbopogon nardus* (citronela). Los aglutinantes adecuados se seleccionan, por ejemplo, de polímeros y ésteres de copolímeros de vinilo de ácidos alifáticos (tales como acetato de vinilo y versatato de vinilo), ésteres de alcoholes acrílicos y metacrílicos, tales como acrilato de butilo, 2-etilhexilacrilato y acrilato de metilo, hidrocarburos insaturados mono y di-etilénicamente, tales como dienos de estireno y alifáticos, tal como butadieno.

La impregnación de cortinas y mosquiteros se realiza en general al sumergir el material textil en emulsiones o dispersiones del insecticida o al pulverizarlas sobre los mosquiteros.

Los compuestos de la presente invención y sus composiciones se pueden utilizar para proteger de hormigas y/o termitas materiales de madera tales como árboles, vallas de tablas, traviesas, etc., y edificios tales como casas, letrinas, fábricas, pero también materiales de construcción, muebles, cueros, fibras, artículos de vinilo, alambres y cables eléctricos, etc., y para evitar que las hormigas y las termitas dañen los cultivos o a los seres humanos (p. ej., cuando las plagas invaden casas e instalaciones públicas). Los compuestos de la presente invención se aplican no solo a la superficie del suelo circundante o en el suelo bajo el suelo con el fin de proteger los materiales de madera, pero también se puede aplicar a los artículos de madera, tales como superficies del hormigón bajo el suelo, postes de alcoba, vigas, madera contrachapada, muebles, etc.,

artículos de madera, tales como tableros de partículas, tableros de media, etc., y artículos de vinilo, tales como cables eléctricos recubiertos, láminas de vinilo, material aislante del calor, tales como espumas de estireno, etc.

Tratamiento de semillas

La presente invención se refiere aún más a una semilla que comprende los compuestos de la presente invención, particularmente en una cantidad que varía de aproximadamente 0,0001% a aproximadamente 1% por peso de la semilla antes del tratamiento.

Los compuestos de la presente invención son particularmente útiles para la protección de la semilla a partir de plagas de suelo y raíces y brotes de la planta resultantes contra las plagas de suelo y los insectos de hojas. Se prefiere la protección de las raíces y los brotes de la planta resultantes. Se prefiere más la protección de los brotes de la planta resultante frente a insectos perforadores y chupadores, donde la protección frente a pulgones es la que más se prefiere.

Por lo tanto, la presente invención comprende un método para la protección de las semillas frente a los insectos, en particular frente a los insectos del suelo y de las raíces y brotes de las plántulas frente a los insectos, en particular frente a los insectos del suelo y foliares, comprendiendo dicho método el contacto de las semillas antes de la siembra y/o después de la pregerminación con un compuesto de la presente invención. Se prefiere particularmente un método donde las raíces y brotes de la planta están protegidos, más preferentemente un método donde los brotes de las plantas están protegidos de los insectos perforadores y chupadores, más preferentemente un método donde los brotes de las plantas están protegidos de los áfidos.

El término semilla abarca semillas y propágulos vegetales de todo tipo, incluidos, a mero título enunciativo, trozos de semillas, chupones, cormos, bulbos, frutos, tubérculos, granos, esquejes, brotes cortados y similares y medios en semillas reales de una realización preferida.

El término tratamiento de semillas comprende todas las técnicas adecuadas de tratamiento de semillas conocidas en la técnica, como el aderezo de semillas, el

recubrimiento de semillas, el espolvoreado de semillas, el remojo de semillas y el granulado de semillas.

La presente invención también comprende semillas recubiertas con el compuesto activo o que contengan el mismo. Las semillas se pueden recubrir con composiciones de recubrimiento de semillas que contengan los compuestos de la presente invención. Por ejemplo, las composiciones de recubrimiento de semillas informadas en EP3165092, EP3158864, WO2016198644, WO2016039623, WO2015192923, CA2940002, US2006150489, US2004237395, WO2011028115, EP2229808, WO2007067042, EP1795071, EP1273219, WO200178507, EP1247436, NL1012918 y CA2083415.

El término “recubierto con y/o que contiene”, en general significa que el ingrediente activo está en su mayor parte en la superficie del producto de propagación en el momento de la aplicación, aunque una parte mayor o menor del ingrediente puede penetrar en el producto de propagación, según el método de aplicación. Cuando dicho producto de propagación se (re)planta, puede absorber el ingrediente activo.

Las semillas adecuadas son semillas de cereales, tubérculos, cultivos oleaginosos, hortalizas, especias, plantas ornamentales, por ejemplo semillas de trigo duro y otros trigos, cebada, avena, centeno, maíz (maíz forrajero y maíz azucarero/maíz dulce y de campo), soja, cultivos oleaginosos, crucíferas, algodón, girasoles, plátanos, arroz, colza, colza, remolacha azucarera, remolacha forrajera, berenjenas, patatas, hierba, césped, hierba forrajera, tomates, puerros, calabaza/zapallo, repollo, lechuga iceberg, pimienta, pepinos, melones, especies de Brassica, melones, frijoles, guisantes, ajo, cebollas, zanahorias, plantas tuberosas como patatas, caña de azúcar, tabaco, uvas, petunias, geranios/pelargonios, pensamientos e impaciencias.

Además, los compuestos de la presente invención se pueden utilizar para tratar semillas de plantas que toleran la acción de herbicidas, fungicidas o insecticidas debido a la reproducción, incluidos los métodos de ingeniería genética.

Por ejemplo, el compuesto de la presente invención se puede emplear en el tratamiento de semillas de plantas, que son resistentes a herbicidas del grupo que consiste en las sulfonilureas, imidazolinonas, glufosinato-amonio o glifosato-isopropilamonio y principios activos análogos (véase por ejemplo, EP242236, EP242246) (WO92/00377) (EP257993, US5013659) o en plantas de cultivo transgénicas, por ejemplo algodón, con la capacidad de producir toxinas de *Bacillus thuringiensis* (toxinas Bt) que hacen que las plantas sean resistentes a ciertas plagas (EP142924, EP193259),

Además, el compuesto de la presente invención se puede utilizar para el tratamiento de semillas de plantas, que tienen características modificadas en comparación con las plantas existentes, que pueden generarse, por ejemplo, mediante métodos tradicionales de cría y/o la generación de mutantes, o mediante procedimientos recombinantes). Por ejemplo, se han descrito varios casos de modificaciones recombinantes de plantas de cultivo con el fin de modificar el almidón sintetizado en las plantas (p. ej., WO92/11376, WO92/14827, WO91/19806) o de plantas de cultivo transgénicas que tienen una composición de ácidos grasos modificada (WO91/13972).

La aplicación del tratamiento de semillas del compuesto de la presente invención se realiza pulverizando o espolvoreando las semillas antes de sembrar las plantas y antes de que las plantas emerjan.

Los compuestos especialmente útiles para el tratamiento de semillas son, p. ej.:

- A. Concentrados solubles (SL, LS)
- B. Emulsiones (EW, EO, ES)
- C. Suspensiones (SC, OD, FS)
- D. Gránulos dispersables en agua y gránulos hidrosolubles (WG, SG)
- E. Polvos dispersables en agua y polvos hidrosolubles (WP, SP, WS)
- F. Formulaciones en gel (GF)
- G. Polvos espolvoreables (DP, DS)

Las formulaciones convencionales de tratamiento de semillas incluyen, por ejemplo, concentrados fluidos FS, soluciones LS, polvos para tratamiento en

seco DS, polvos dispersables en agua para tratamiento de purines WS, polvos hidrosolubles SS, emulsiones ES y EC y formulación en gel GF. Estas formulaciones se pueden aplicar a las semillas diluidas o sin diluir. La aplicación a las semillas se realiza antes de la siembra, ya sea directamente sobre las semillas o después de haberlas pregerminado.

En una realización se utiliza una formulación FS para el tratamiento de semillas. En general, una formulación FS puede comprender de 1 a 800 g/L de ingrediente activo, de 1 a 200 g/L de tensioactivo, de 0 a 200 g/L de agente anticongelante, de 0 a 400 g/L de aglutinante, de 0 a 200 g/L de un pigmento y hasta 1 litro de un solvente, preferentemente agua.

Especialmente las formulaciones FS de compuestos de la presente invención para el tratamiento de semillas, en general comprenden de 0,1 a 80% por peso (de 1 a 800 g/L) del ingrediente activo, de 0,1 a 20% por peso (de 1 a 200 g/L) de al menos un tensioactivo, p. ej., de 0,05 a 5% en peso de un humectante y de 0,5 a 15% en peso de un agente dispersante, hasta un 20% en peso, p. ej., de 5 a 20% de un agente anticongelante, de 0 a 15% en peso, p. ej., de 1 a 15% en peso de un pigmento y/o un colorante, de 0 a 40% en peso, p. ej., de 1 a 40% en peso de un aglutinante (adhesivo/agente de adherencia), opcionalmente hasta el 5% en peso, p. ej., de 0,1 a 5% en peso de un espesante, opcionalmente de 0,1 a 2% en peso de un agente antiespumante y, opcionalmente un conservante como un biocida, antioxidante o similar, p. ej. en una cantidad de 0,01 a 1% en peso y un relleno/vehículo de hasta 100% en peso.

Las formulaciones del tratamiento de semillas pueden comprender además aglutinantes y, opcionalmente, colorantes.

Los aglutinantes se pueden añadir para mejorar la adhesión de los materiales activos a las semillas después del tratamiento. Los aglutinantes adecuados son homo y copolímeros de óxidos de alquileo como óxido de etileno u óxido de propileno, polivinilacetato, polivinilalcoholes, polivinilpirrolidonas y los copolímeros de estos, copolímeros de etileno-acetato de vinilo, homo y copolímeros acrílicos, polietilenaminas, polietilenamidas y polietilenpirimidinas,

polisacáridos como celulosas, tilosa y almidón, homo y copolímeros de poliolefina como copolímeros de olefina/anhídrido maleico, poliuretanos, poliésteres, homo y copolímeros de poliestireno.

En la formulación, también se pueden incluir colorantes opcionalmente. Los colorantes o tintes adecuados para las formulaciones de tratamiento de semillas son Rodamina B, C.I. Pigmento Rojo 1 12, C.I. Solvente Rojo 1, pigmento azul 15:4, pigmento azul 15:3, pigmento azul 15:2, pigmento azul 15:1, pigmento azul 80, pigmento amarillo 1, pigmento amarillo 13, pigmento rojo 1 12, pigmento rojo 48:2, pigmento rojo 48:1, pigmento rojo 57:1, pigmento rojo 53:1, pigmento naranja 43, pigmento naranja 34, pigmento naranja 5, pigmento verde 36, pigmento verde 7, pigmento blanco 6, pigmento marrón 25, violeta básico 10, violeta básico 49, rojo ácido 51, rojo ácido 52, rojo ácido 14, azul ácido 9, amarillo ácido 23, rojo básico 10, rojo básico 108.

Un ejemplo de gelificante es el carragenato (Satiagel®).

En el tratamiento de semillas, las dosis de aplicación de los compuestos de la presente invención son, en general, de 0,1 g a 10 kg por 100 kg de semilla, preferentemente de 1 g a 5 kg por 100 kg de semilla, más preferentemente de 1 g a 1 kg por 100 kg de semilla y en particular de 1 g a 200 g por 100 kg de semilla. Por lo tanto, la presente invención también proporciona semillas que comprenden un compuesto de fórmula (I) o una sal agrícolamente útil de fórmula (I), tal como se define en el presente documento. La cantidad del compuesto de fórmula (I) o la sal agrícolamente útil de este variará en general de 0,1 g a 10 kg por 100 kg de semilla, preferentemente de 1 g a 5 kg por 100 kg de semilla, en particular de 1 g a 1 kg por 100 kg de semilla. Para cultivos específicos tales como la lechuga, la dosis puede ser superior.

Salud animal

La presente invención también proporciona una composición agrícola y/o veterinaria que comprende al menos un compuesto de la presente invención.

La presente invención se refiere aún más a un uso del compuesto, N-óxido o una sal veterinariamente aceptable de este o de la composición de la presente

invención, para la preparación de un medicamento para tratar o proteger animales contra la infestación o infección por plagas o parásitos de insectos y ácaros.

Los compuestos de fórmula (I), sus N-óxidos y/o sales veterinariamente aceptables de estos son también particularmente adecuados para utilizarse para combatir parásitos en animales y sobre estos.

Un objeto de la presente invención es, por lo tanto, proporcionar nuevos métodos para controlar los parásitos en animales y sobre estos. Otro objeto de la presente invención es proporcionar plaguicidas más seguros para los animales. Otro objeto de la presente invención es proporcionar plaguicidas para animales que se puedan utilizar en dosis más bajas que los plaguicidas existentes. Otro objeto de la presente invención es proporcionar plaguicidas para animales que proporcionen un control duradero de los parásitos.

La presente invención también se refiere a composiciones que contienen una cantidad parasitocida eficaz de al menos un compuesto de fórmula (I), N-óxido o sal veterinariamente aceptable de este y un transportador aceptable, para combatir los parásitos en animales y sobre estos.

La presente invención también proporciona un método para tratar, controlar, prevenir y proteger animales contra la infestación e infección por parásitos, que comprende administrar o aplicar a los animales por vía oral, tópica o parenteral una cantidad parasitocida eficaz de un compuesto de la presente invención o una composición que lo comprende.

La presente invención también proporciona un proceso para la preparación de una composición para tratar, controlar, prevenir o proteger animales contra la infestación o infección por parásitos que comprende una cantidad parasiticidamente eficaz de un compuesto de la presente invención o una composición que lo comprende.

La actividad de los compuestos contra las plagas agrícolas no sugiere su idoneidad para el control de endoparásitos y ectoparásitos en animales y sobre estos, lo que requiere, por ejemplo, dosis bajas y no eméticas en el caso de una

aplicación oral, compatibilidad metabólica con el animal, baja toxicidad y una manipulación segura.

Sorprendentemente, ahora se ha descubierto que los compuestos de la presente invención son adecuados para combatir los endoparásitos y ectoparásitos en y sobre animales.

Los compuestos de la presente invención y las composiciones que los comprenden se utilizan preferentemente para controlar y prevenir infestaciones e infecciones de animales, incluidos los animales homeotermos (incluidos los seres humanos) y los peces. Por ejemplo, son adecuados para controlar y prevenir infestaciones e infecciones en mamíferos tales como vacas, ovejas, cerdos, camellos, ciervos, caballos, cerdos, aves de corral, conejos, cabras, perros y gatos, búfalos de agua, burros, gamos y renos, y también en animales de peletería tales como visones, chinchillas y mapaches, aves tales como gallinas, gansos, pavos y patos y peces tales como peces de agua dulce y salada como truchas, carpas y anguilas.

Los compuestos de la presente invención y las composiciones que los comprenden se utilizan preferentemente para controlar y prevenir infestaciones e infecciones en animales domésticos, tales como perros o gatos.

Las infestaciones en animales homeotermos y peces incluyen, a mero título enunciativo, piojos, malófagos, garrapatas, bots nasales, keds, tábanos, moscas mucoides, moscas, larvas de mosca miasis, niguas, mosquitos y pulgas.

Los compuestos de la presente invención y las composiciones que los comprenden son adecuados para un control sistémico y/o no sistémico de ectoparásitos y/o endoparásitos. Pueden ser activos contra todos o algunas etapas de desarrollo.

Los compuestos de la presente invención son especialmente útiles para combatir ectoparásitos.

Los compuestos de la presente invención son especialmente útiles para combatir parásitos de los siguientes órdenes y especies, respectivamente: *pulgas* (*Siphonaptera*), *p. ej.*, *Ctenocephalides felis*, *Ctenocephalides cams*, *Xenopsylla*

cheopis, *Pulex irritans*, *Tunga penetrans* y *Nosopsyllus fasciatus*, cucarachas (*Blattaria Blattodea*), p. ej., *Blattella germanica*, *Blattella asahinae*, *Periplaneta americana*, *Periplaneta japonica*, *Periplaneta brunnea*, *Periplaneta fuliginosa*, *Periplaneta australasiae* y *Blatta orientalis*, moscas, mosquitos (*Diptera*), p. ej., *Aedes aegypti*, *Aedes albopictus*, *Aedes vexans*, *Anastrepha ludens*, *Anopheles maculipennis*, *Anopheles crucians*, *Anopheles albimanus*, *Anopheles gambiae*, *Anopheles freeborni*, *Anopheles leucosphyrus*, *Anopheles minimus*, *Anopheles quadrimaculatus*, *Calliphora vicina*, *Chrysomya bezziana*, *Chrysomya hominivorax*, *Chrysomya macellaria*, *Chrysops discalis*, *Chrysops silacea*, *Chrysops atlanticus*, *Cochliomyia hominivorax*, *Cordylobia antropophaga*, *Culicoides furens*, *Culex pi ens*, *Culex nigripalpus*, *Culex quinquefasciatus*, *Culex tarsalis*, *Culiseta inornata*, *Culiseta melanura*, *Dermatobia hominis*, *Fannia canicularis*, *Gasterophilus intestinalis*, *Glossina morsitans*, *Glossina palpalis*, *Glossina fuscipes*, *Glossina tachinoides*, *Haematobia irritans*, *Haplodiplosis equestris*, *Hippelates spp.*, *Hypoderma lineata*, *Leptoconops torrens*, *Lucilia caprina*, *Lucilia cuprina*, *Lucilia sericata*, *Lycoria pectoralis*, *Mansonia spp.*, *Musca domestica*, *Muscina stabulans*, *Oestrus ovis*, *Phlebotomus argentipes*, *Psorophora columbiae*, *Psorophora discolor*, *Prosimulium mixtum*, *Sarcophaga haemorrhoidalis*, *Sarcophaga sp.*, *Simulium vittatum*, *Stomoxys calcitrans*, *Tabanus bovinus*, *Tabanus atratus*, *Tabanus lineola* y *Tabanus similis*, piojos (*Phthiraptera*), p. ej., *Pediculus humanus capitis*, *Pediculus humanus corporis*, *Pthirus pubis*, *Haematopinus eurysternus*, *Haematopinus suis*, *Linognathus vituli*, *Bovicola bovis*, *Menopon gallinae*, *Menacanthus stramineus* y *Solenopotes capillatus*, garrapatas y ácaros parásitos (*Parasitiformes*): garrapatas (*Ixodida*), p. ej., *Ixodes scapularis*, *Ixodes holocyclus*, *Ixodes pacificus*, *Rhiphicephalus sanguineus*, *Dermacentor andersoni*, *Dermacentor variabilis*, *Amblyomma americanum*, *Ambryomma maculatum*, *Ornithodoros hermsi*, *Ornithodoros turicata* y ácaros parásitos (*Mesostigmata*), p. ej., *Ornithonyssus bacoti* y *Dermanyssus gallinae*, *Actinedida* (*Prostigmata*) y *Acaridida* (*Astigmata*), p. ej., *Acarapis spp.*, *Cheyletiella spp.*, *Ornithocheyletia spp.*, *Myobia spp.*, *Psorergates*

spp., *Demodex* spp., *Trombicula* spp., *Listrophorus* spp., *Acarus* spp., *Tyrophagus* spp., *Caloglyphus* spp., *Hypodectes* spp., *Pterolichus* spp., *Psoroptes* spp., *Chorioptes* spp., *Otodectes* spp., *Sarcoptes* spp., *Notoedres* spp., *Knemidocoptes* spp., *Cytodites* spp. y *Laminosioptes* spp, Chinchés (Heteropterida): *Cimex lectularius*, *Cimex hemipterus*, *Reduvius senilis*, *Triatoma* spp., *Rhodnius* spp., *Panstrongylus* spp. y *Arilus critatus*, Anoplurida, p. ej., *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Phthirus* spp. y *Solenopotes* spp, Mallophagida (subórdenes Armblycerina y Ischnocerina), p. ej., *Trimenopon* spp., *Menopon* spp., *Trinoton* spp., *Bovicola* spp., *Werneckiella* spp., *Lepikentron* spp., *Trichodectes* spp. y *Felicola* spp.

Nematodo:

Wipeworms y Trichinosis (*Trichosyringida*), p. ej., *Trichinellidae* (*Trichinella* spp.), (*Trichuridae*,) *Trichuris* spp., *Capillaria* spp, *Rhabditida*, p. ej., *Rhabditis* spp, *Strongyloides* spp., *Helicephalobus* spp, *Strongylida*, e.g. *Strongylus* spp., *Ancylostoma* spp., *Necator americanus*, *Bunostomum* spp. (*Anquilostoma*), *Trichostrongylus* spp., *Haemonchus contortus*., *Ostertagia* spp., *Cooperia* spp., *Nematodirus* spp., *Dictyocaulus* spp., *Cyathostoma* spp., *Oesophagostomum* spp., *Stephanurus dentatus*, *Ollulanus* spp., *Chabertia* spp., *Stephanurus dentatus*, *Syngamus trachea*, *Ancylostoma* spp., *Uncinaria* spp., *Globocephalus* spp., *Necator* spp., *Metastrongylus* spp., *Muellerius capillaris*, *Protostrongylus* spp., *Angiostrongylus* spp., *Parelaphostrongylus* spp. *Aleurostrongylus abstrusus* y *Diectophyma renale*, Intestinal roundworms (*Ascaridida*), p. ej., *Ascaris lumbricoides*, *Ascaris suum*, *Ascaridia galli*, *Parascaris equorum*, *Enterobius vermicularis* (nematodo), *Toxocara canis*, *Toxascaris leonine*, *Skrjabinema* spp., and *Oxyuris equi*, *Camallanida*, p. ej., *Dracunculus medinensis* (guinea worm) *Spirurida*, p. ej., *Thelazia* spp. *Wuchereria* spp., *Brugia* spp., *Onchocerca* spp., *Dirofilari* spp. a, *Dipetalonema* spp., *Setaria* spp., *Elaeophora* spp., *Spirocerca lupi* y *Habronema* spp, Thorny headed worms (*Acanthocephala*), p. ej., *Acanthocephalus* spp., *Macracanthorhynchus hirudinaceus* y *Oncicola* spp, Planarians (*Plathelminthes*): Flukes (*Trematoda*),

p. ej., Fasciola spp., Fascioloides magna, Paragonimus spp., Dicrocoelium spp., Fasciolopsis buski, Clonorchis sinensis, Schistosoma spp., Trichobilharzia spp., Alaria a lata, Paragonimus spp. y Nanocyetes spp, Cercomeromorpha, en particular Cestoda (Tapeworms), p. ej., Diphylobothrium spp., Tenia spp., Echinococcus spp., Dipylidium caninum, Multiceps spp., Hymenolepis spp., Mesocestoides spp., Vampirolepis spp., Moniezia spp., Anoplocephala spp., Sirometra spp., Anoplocephala spp. y Hymenolepis spp.

Los compuestos de fórmula (I) y las composiciones que los contienen son particularmente útiles para el control de plagas de los órdenes Diptera, Siphonaptera e Ixodida.

Además, el uso de los compuestos de fórmula (I) y las composiciones que los contienen para combatir mosquitos es una realización de la presente invención.

El uso de los compuestos de la presente invención y las composiciones que los contienen para combatir moscas es otra realización de la presente invención.

Además, el uso de los compuestos de la presente invención y las composiciones que los contienen para combatir pulgas es todavía otra realización de la invención presente.

El uso de los compuestos de la presente invención y las composiciones que los contienen para combatir garrapatas es todavía otra realización de la presente invención.

Los compuestos de la presente invención también son especialmente útiles para combatir endoparásitos (nematodos, gusanos espinosos y planarias).

La administración se puede realizar tanto de forma profiláctica como terapéutica. La administración de los compuestos de la presente invención se realiza directamente o en forma de preparados adecuados, por vía oral, tópica/dermal o parenteral.

Para una administración oral a animales homeotermos, los compuestos de la presente invención se pueden formular como piensos, premezclas de piensos, concentrados de piensos, píldoras, soluciones, pastas, suspensiones, empapes, geles, comprimidos, bolos y cápsulas. Además, los compuestos de la presente

invención se pueden administrar a los animales en el agua para consumo. Para la administración oral, la forma farmacéutica elegida debe proporcionar al animal de 0,01 mg/kg a 100 mg/kg de peso corporal animal por día del compuesto de la presente invención, preferentemente de 0,5 mg/kg a 100 mg/kg de peso corporal animal por día.

De forma alternativa, los compuestos de la presente invención se pueden administrar a los animales por vía parenteral, por ejemplo, mediante inyección intraruminal, intramuscular, intravenosa o subcutánea. Los compuestos de la presente invención se pueden dispersar o disolver en un transportador fisiológicamente aceptable para inyección subcutánea. De forma alternativa, los compuestos de la presente invención se pueden formular en un implante para administración subcutánea. Además, el compuesto de la presente invención se puede administrar a los animales de forma transdérmica. Para la administración parenteral, la forma farmacéutica elegida debe proporcionar al animal de 0,01 mg/kg a 100 mg/kg de peso corporal animal por día del compuesto de la presente invención.

Los compuestos de la presente invención también se pueden aplicar tópicamente a los animales en forma de inmersiones, polvos, polvillos, collares, medallones, aerosoles, champús, formulaciones parasitarias y tópicas y en ungüentos o emulsiones de aceite en agua o agua en aceite. Para la aplicación tópica, los recipientes y aerosoles contienen normalmente de 0,5 ppm a 5.000 ppm y preferentemente de 1 ppm a 3.000 ppm del compuesto de la presente invención. Además, los compuestos de la presente invención se pueden formular como crotales para animales, en particular cuadrúpedos como bovinos y ovinos.

Los preparados adecuados son: soluciones, tales como soluciones orales, concentrados para administración oral después de la dilución, soluciones para uso cutáneo o en cavidades corporales, formulaciones vertidas, geles; emulsiones y suspensiones para administración oral o dérmica; preparaciones semisólidas; formulaciones en las que el compuesto activo se procesa en una

base de pomada o en una base de emulsión de aceite en agua o agua en aceite; preparaciones sólidas, tales como polvos, premezclas o concentrados, gránulos, pellets, comprimidos, bolos, cápsulas; aerosoles e inhalantes y artículos conformados que contienen compuestos activos.

Las composiciones inyectables se preparan al disolver el ingrediente activo en un solvente adecuado y al añadir opcionalmente otros ingredientes tales como ácidos, bases, sales tampón, conservantes y solubilizantes.

Las soluciones se filtran y se llenan de forma estéril.

Los solventes adecuados son solventes fisiológicamente tolerables tales como el agua, alcanos como el etanol, butanol, alcohol bencílico, glicerol, propilenglicol, polietilenglicoles, N-metilpirrolidona, 2-pirrolidona y mezclas de estos.

Los compuestos activos se pueden disolver opcionalmente en aceites vegetales o sintéticos fisiológicamente tolerables que sean adecuados para inyección.

Los solubilizantes adecuados son los solventes que promueven la disolución del compuesto activo en el solvente principal o evitan su precipitación. Algunos ejemplos son la polivinilpirrolidona, el alcohol polivinílico, el aceite de ricino polioxietilado y el éster de sorbitán polioxietilado.

Los conservantes adecuados son el alcohol bencílico, el triclorobutanol, los ésteres del ácido p-hidroxibenzoico y el n-butanol.

Las soluciones orales se administran directamente. Los concentrados se administran por vía oral después de la dilución previa hasta la concentración de uso. Las soluciones orales y los concentrados se preparan según el estado de la técnica y conforme se describe arriba para las soluciones inyectables, sin necesidad de procedimientos estériles.

Las soluciones para uso cutáneo se aplican por goteo, se extienden, se frotan, se rocían o se pulverizan.

Las soluciones para uso cutáneo se preparan según el estado de la técnica y según lo que se describe arriba para las soluciones inyectables, sin necesidad de procedimientos estériles.

Otros solventes adecuados son polipropilenglicol, fenil etanol, fenoxietanol, ésteres tales como acetato de etilo o butilo, benzoato de bencilo, éteres tales como alquilenglicol alquiléter, p. ej., dipropilenglicol monometileter, cetonas tales como acetona, metiletilcetona, hidrocarburos aromáticos, aceites vegetales y sintéticos, dimetilformamida, dimetilacetamida, transcutool, solketal, propilencarbonato y mezclas de estos.

Puede resultar útil añadir espesantes durante la preparación. Los espesantes adecuados son espesantes inorgánicos tales como bentonitas, ácido silícico coloidal, monoestearato de aluminio, espesantes orgánicos tales como derivados de la celulosa, alcoholes polivinílicos y sus copolímeros, acrilatos y metacrilatos.

Los geles se aplican o extienden sobre la piel o se introducen en cavidades corporales. Los geles se preparan al tratar las soluciones que se han preparado, tal como se describe en el caso de las soluciones inyectables con suficiente espesante para obtener un material transparente con una consistencia similar a la pomada. Los espesantes empleados son los indicados anteriormente.

Las formulaciones tópicas se vierten o se pulverizan sobre zonas limitadas de la piel. El compuesto activo penetra en la piel y actúa sistémicamente. Las formulaciones tópicas se preparan al disolver, suspender o emulsionar el compuesto activo en solventes o mezclas de solventes compatibles con la piel. Si es necesario, se añaden otros auxiliares tales como colorantes, sustancias que favorecen la bioabsorción, antioxidantes, estabilizadores de la luz o adhesivos.

Los solventes adecuados son los siguientes: agua, alcanos, glicoles, polietilenglicoles, polipropilenglicoles, glicerol, alcoholes aromáticos como alcohol bencílico, feniletanol, fenoxietanol, ésteres como acetato de etilo, acetato de butilo, benzoato de bencilo, éteres como éteres alquílicos de alquilenglicol como éter monometílico de dipropilenglicol, éter monobutílico de dietilenglicol, cetonas como acetona, metiletilcetona, carbonatos cíclicos como carbonato de propileno, carbonato de etileno, hidrocarburos aromáticos y/o alifáticos, aceites

vegetales o sintéticos, DMF, dimetilacetamida, n-alquilpirrolidonas como metilpirrolidona, n-butilpirrolidona o nitroxipirrolidona, N-metilpirrolidona, 2-pirrolidona, 2,2-dimetil-4-oximetilen-1,3-dioxolano y glicerol formal.

Los colorantes adecuados son todos los permitidos para el uso en animales y que se pueden disolver o suspender.

Las sustancias adecuadas para promover la absorción son, por ejemplo, DMSO, aceites para untar tales como miristato de isopropilo, pelargonato de dipropilenglicol, aceites de silicona y copolímeros de estos con poliéteres, ésteres de ácidos grasos, triglicéridos, alcoholes grasos.

Los antioxidantes adecuados son sulfitos o metabisulfitos tales como el metabisulfito potásico, ácido ascórbico, butilhidroxitolueno, butilhidroxianisol, tocoferol.

Los estabilizadores de la luz adecuados son, por ejemplo, el ácido novantisólico. Adhesivos adecuados son, por ejemplo, derivados de celulosa, derivados de almidón, poliacrilatos, polímeros naturales tales como alginatos, gelatina. Las emulsiones se pueden administrar por vía oral, dérmica o inyectable. Las emulsiones son del tipo agua en aceite o aceite en agua.

Se preparan al disolver el compuesto activo en la fase hidrófoba o en la hidrófila y homogeneizándolo con el solvente de la otra fase con la ayuda de emulsionantes adecuados y, si es necesario, otros auxiliares tales como colorantes, sustancias que favorecen la absorción, conservantes, antioxidantes, estabilizadores de la luz o sustancias que aumentan la viscosidad.

Las fases hidrófobas adecuadas (aceites) son las siguientes:

Parafinas líquidas, aceites de silicona, aceites vegetales naturales tales como aceite de sésamo, aceite de almendras, aceite de ricino, triglicéridos sintéticos tales como biglicérido caprílico/cáprico, mezcla de triglicéridos con ácidos grasos vegetales de la longitud de cadena Cs-Ci2 u otros ácidos grasos naturales especialmente seleccionados, mezclas parciales de glicéridos de ácidos grasos saturados o insaturados que posiblemente contengan también grupos hidroxilo, mono y diglicéridos de los ácidos grasos Cs-do, ésteres de ácidos grasos tales

como estearato de etilo, adipato de di-n-butilo, laurato de hexilo, perlargonato de dipropilenglicol, ésteres de un ácido graso ramificado de longitud de cadena media con alcoholes grasos saturados de longitud de cadena C16-C18, miristato de isopropilo, palmitato de isopropilo, ésteres de ácido caprílico/cáprico de alcoholes grasos saturados de longitud de cadena C12-C18, estearato de isopropilo, oleato de oleilo, oleato de decilo, oleato de etilo, lactato de etilo, ésteres cerosos de ácidos grasos tales como la grasa sintética de la glándula coccígea del pato, el ftalato de dibutilo, el adipato de diisopropilo y las mezclas de ésteres relacionadas con estos últimos, alcoholes grasos tales como el alcohol isotridecílico, el 2-octildodecanol, el alcohol cetilestearílico, el alcohol oleílico y ácidos grasos tales como el ácido oleico y mezclas de estos. Las fases hidrófilas adecuadas son las siguientes: agua, alcoholes tales como el propilenglicol, glicerol, sorbitol y mezclas de estos.

Los emulgentes adecuados son los siguientes: tensioactivos no iónicos, p. ej., el aceite de ricino polietoxilado, el monooleato de sorbitán polietoxilado, el monoestearato de sorbitán, el monoestearato de glicerol, el estearato de polioxietilo, el éter poliglicólico de alquilfenol; tensioactivos anfóteros, tales como el N-lauril-p-iminodipropionato de sodio o la lecitina.

Los tensioactivos aniónicos adecuados son el lauril sulfato sódico, los éteres sulfatos de alcoholes grasos, la sal mono/dialquil poliglicol éter ortofosfórico de éster monoetanolamina; los tensioactivos catiónicos adecuados son el cloruro de cetiltrimetilamonio.

Otros auxiliares adecuados son los siguientes: sustancias que aumentan la viscosidad y estabilizan la emulsión, tales como carboximetilcelulosa, metilcelulosa y otros derivados de la celulosa y el almidón, poliacrilatos, alginatos, gelatina, goma arábiga, polivinilpirrolidona, alcohol polivinílico, copolímeros de metil vinil éter y anhídrido maleico, polietilenglicoles, ceras, ácido silícico coloidal o mezclas de las sustancias mencionadas.

Las suspensiones se pueden administrar por vía oral o tópica/dermal. Se preparan al suspender el compuesto activo en un agente de suspensión, si

procede con la adición de otros auxiliares como agentes humectantes, colorantes, sustancias promotoras de la bioabsorción, conservantes, antioxidantes, estabilizadores de la luz.

Los agentes de suspensión líquidos son todos solventes homogéneos y mezclas de solventes.

Los humectantes (dispersantes) adecuados son los emulsionantes mencionados arriba.

Otros auxiliares que se pueden mencionar son los mencionados arriba.

Los preparados semisólidos se pueden administrar por vía oral o tópica/dermal. Se diferencian de las suspensiones y emulsiones descritas arriba únicamente por su mayor viscosidad.

Para la producción de preparados sólidos, el compuesto activo se mezcla con excipientes adecuados, si corresponde, con la adición de auxiliares y se obtiene la forma deseada.

Los excipientes adecuados son todas las sustancias sólidas inertes fisiológicamente tolerables. Se utilizan sustancias inorgánicas y orgánicas. Las sustancias inorgánicas son, por ejemplo, cloruro de sodio, carbonatos como el carbonato de calcio, hidrocarbonatos, óxidos de aluminio, óxido de titanio, ácidos silícicos, tierras arcillosas, sílice precipitada o coloidal o fosfatos. Las sustancias orgánicas son, por ejemplo, azúcar, celulosa, alimentos y piensos como leche en polvo, harinas animales, harinas y triturados de cereales, almidones.

Los conservantes, antioxidantes y/o colorantes mencionados arriba, son auxiliares adecuados.

Otros auxiliares adecuados son lubricantes y deslizantes tales como estearato de magnesio, ácido esteárico, talco, bentonitas, sustancias que favorecen la desintegración como almidón o polivinilpirrolidona reticulada, aglutinantes tales como almidón, gelatina o polivinilpirrolidona lineal y aglutinantes secos tales como celulosa microcristalina.

En general, por “cantidad parasitocida eficaz” se entiende la cantidad de ingrediente activo necesaria para lograr un efecto observable sobre el

crecimiento, incluida la muerte, el retraso, la prevención, la eliminación y la destrucción, o la disminución de otro modo de la aparición y la actividad de los organismos objetivo. La cantidad parasiticida eficaz puede variar para los distintos compuestos/composiciones utilizadas en la presente invención. La cantidad parasiticida eficaz de las composiciones también variará según las condiciones imperantes, tales como el efecto parasiticida deseado y la duración, la especie objetivo, el modo de aplicación y similares. Las composiciones que se pueden utilizar en la presente invención comprenden generalmente de aproximadamente 0,001 a 95% del compuesto de la presente invención.

En general, es favorable aplicar los compuestos de la presente invención en cantidades totales de 0,5 mg/kg a 100 mg/kg por día, preferentemente 1 mg/kg a 50 mg/kg por día. Los preparados listos para su uso contienen los compuestos que actúan contra los parásitos, preferentemente ectoparásitos, en concentraciones de 10 ppm a 80 por ciento en peso, preferentemente de 0,1 a 65 por ciento en peso, más preferentemente de 1 a 50 por ciento en peso, más preferentemente de 5 a 40 por ciento en peso. Los preparados se diluyen antes de su uso que contienen los compuestos que actúan contra los ectoparásitos en concentraciones de 0,5 a 90 por ciento en peso, preferentemente de 1 a 50 por ciento en peso. Además, los preparados comprenden los compuestos de la presente invención contra endoparásitos en concentraciones de 10 ppm a 2 por ciento en peso, preferentemente de 0,05 a 0,9 por ciento en peso, muy particularmente preferentemente de 0,005 a 0,25 por ciento en peso.

En una realización, las composiciones que comprenden los compuestos de la presente invención se aplican por vía dérmica/tópica.

En otra realización, la aplicación tópica se lleva a cabo en forma de artículos moldeados que contienen compuestos, como collares, medallones, crotales, bandas para fijar en partes del cuerpo y tiras y láminas adhesivas.

En general, es favorable aplicar formulaciones sólidas que liberen compuestos de la presente invención en cantidades totales de 10 mg/kg a 300 mg/kg,

preferentemente de 20 mg/kg a 200 mg/kg, más preferentemente de 25 mg/kg a 160 mg/kg de peso corporal del animal tratado en el transcurso de tres semanas. Para la preparación de los artículos moldeados se utilizan plásticos termoplásticos y flexibles, así como elastómeros y elastómeros termoplásticos. Los plásticos y elastómeros adecuados son resinas de polivinilo, poliuretano, poliacrilato, resinas epoxi, celulosa, derivados de celulosa, poliamidas y poliéster que sean suficientemente compatibles con los compuestos de la presente invención. En el documento WO 2003/086075, p. ej., figura una lista detallada de plásticos y elastómeros, así como de procedimientos de preparación de los artículos conformados.

Tecnologías digitales

Los compuestos de la invención pueden utilizarse en combinación con modelos, p. ej., integrados en programas informáticos para la gestión de cultivos específicos del sitio, agricultura satelital, cultivo de precisión o agricultura de precisión. Tales modelos ayudan a una gestión específica del sitio de sitios agrícolas con información de diferentes fuentes tales como suelos, clima, cultivos (p. ej., tipo, etapa de crecimiento, salud de la planta), malas hierbas (p. ej., tipo, etapa de crecimiento), enfermedades, plagas, nutrientes, agua, humedad, biomasa, información satelital, rendimiento, etc. con el objetivo de optimizar la rentabilidad, la sustentabilidad y la protección del medio ambiente. En particular, tales modelos pueden ayudar a optimizar las decisiones agrícolas, controlar la precisión de las aplicaciones de plaguicidas y registrar el trabajo realizado.

A modo de ejemplo, los compuestos de la invención pueden aplicarse a una planta de cultivo según un esquema de dosificación adecuado si un modelo modela el desarrollo de una plaga y calcula que se ha alcanzado un umbral para el que se recomienda aplicar el compuesto de la invención al cultivo.

Los sistemas disponibles comercialmente que incluyen modelos agronómicos son, p. ej., FieldScripts™ de The Climate Corporation, Xarvio™ de BASF, AGLogic™ de John Deere, etc.

Los compuestos de la invención también pueden utilizarse en combinación con equipos de pulverización inteligentes como, p. ej., equipos de pulverización por puntos o de pulverización de precisión unidos a un vehículo agrícola o alojados en este, tal como un tractor, robot, helicóptero, aeronave, vehículo aéreo no tripulado (UAV) tal como un dron, etc. Tal equipo suele incluir sensores de entrada (tales como, p. ej., una cámara) y una unidad de procesamiento configurada para analizar la información de entrada y proporcionar una decisión según el análisis de la información de entrada para aplicar el compuesto de la invención a las plantas de cultivo (respectivamente, las malas hierbas) de manera específica y precisa. El uso de tales equipos de pulverización inteligentes suele también requerir de sistemas de posición (p. ej., receptores de GPS) para localizar la información registrada y para guiar o controlar los vehículos agrícolas; sistemas de información geográfica (GIS) para representar la información en mapas inteligibles y vehículos agrícolas adecuados para realizar las acciones agrícolas necesarias tales como la pulverización.

En un ejemplo, las plagas se pueden detectar a partir de imágenes adquiridas por una cámara. En un ejemplo, las plagas se pueden identificar y/o clasificar según dichas imágenes. Dicha identificación y/o clasificación puede hacer uso de algoritmos de procesamiento de imágenes. Dichos algoritmos de procesamiento de imágenes pueden utilizar algoritmos de aprendizaje automático, tales como redes neutras entrenadas, árboles de decisión y algoritmos de inteligencia artificial. De este modo, los compuestos descritos en el presente documento se pueden aplicar solo cuando sea necesario.

Respuesta positiva de los cultivos:

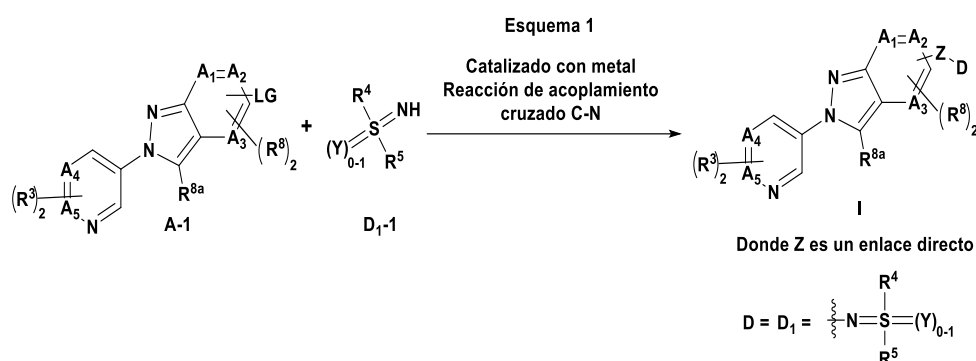
Los compuestos de la presente invención no solo controlan de forma eficaz las plagas de insectos y ácaros, sino que también muestran una respuesta positiva de los cultivos, tales como efectos de mejora del crecimiento de las plantas, como un mayor crecimiento de las raíces, una mayor tolerancia a la sequía, a la salinidad, a las altas temperaturas, al frío, a las heladas o a la radiación luminosa, una mejor floración, una mejor utilización de los nutrientes (tal como una mejor

asimilación del nitrógeno), una mayor calidad de los productos vegetales, un mayor número de hijuelos productivos, una mayor resistencia a las plagas de insectos y similares, lo que se traduce en un mayor rendimiento.

Esquema general de síntesis:

La invención se ilustrará ahora con más detalle mediante los siguientes ejemplos, sin imponer ninguna limitación al respecto.

Esquema 1:



En una de las realizaciones preferidas, los compuestos de fórmula (I), donde D representa D₁ y Z es un enlace directo, pueden prepararse mediante reacciones de acoplamiento cruzado catalizadas por metales entre los compuestos de fórmula A-1, donde LG representa un grupo saliente y compuestos de fórmula D₁-1 siguiendo el procedimiento descrito en la bibliografía *US 20190297887* y en otra bibliografía allí citada. Los compuestos de fórmula D₁-1 pueden obtenerse comercialmente o sintetizarse por el método descrito en *Chem. Eur. J.* 2021, 27, 17293–17321, *European Journal of Medicinal Chemistry* 2017, 126, 225-245, *Chem. Commun.*, 2017, 53, 348-351, *J. Am. Chem. Soc.* 2020, 142(36), 15445–15453 y en más bibliografía allí citada. A menos que se indique lo contrario, la definición de cada variable es la definida arriba para los compuestos de fórmula (I).

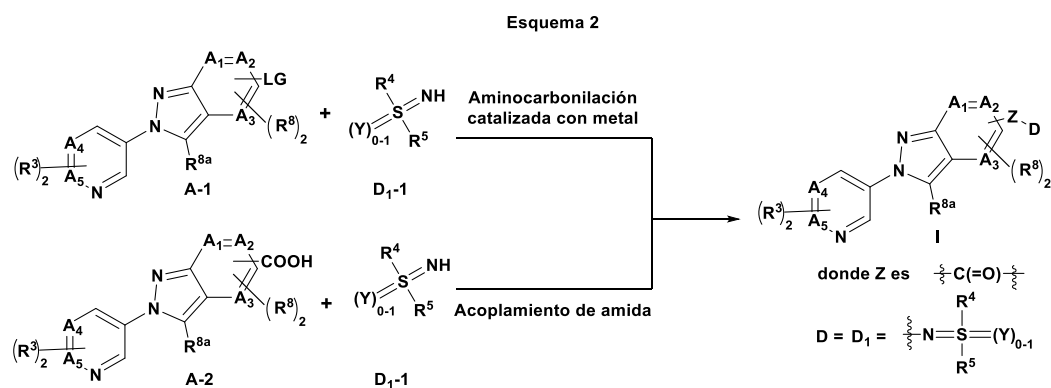
Las reacciones de acoplamiento C-N suelen llevarse a cabo en presencia de solventes y los solventes que pueden utilizarse para esta reacción no están especialmente limitados, siempre que no afecten negativamente a la reacción. Por ejemplo, éteres tales como dioxano, tetrahidrofurano, etilenglicol, dimetiléter

y dietilenglicol dimetiléter; hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno; N-amidas tales como *N,N*-dimetilformamida, *N,N*-dimetilacetamida y 1-metil-2-pirrolidona; alcoholes tales como metanol, etanol, propanol, butanol, 2-propanol y 2-metil-2-propanol; nitrilos tales como acetonitrilo; o agua o una mezcla de estos. Los solventes preferidos incluyen hidrocarburos aromáticos tales como el tolueno y el xileno; y amidas tales como *N,N*-dimetilformamida, *N,N*-dimetilacetamida y 1-metil-2-pirrolidona; de las cuales *N,N*-dimetilformamida y tolueno son las más preferidas. La reacción se lleva a cabo en presencia de una base seleccionada de, pero no limitada a, alcóxidos metálicos tales como metóxido de sodio, etóxido de sodio, *tert*-butóxido de potasio y *tert*-butóxido de sodio; bases inorgánicas tales como hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, carbonato de cesio, fosfato de sodio, fosfato de potasio, hidrogenofosfato de potasio e hidruro de potasio; bases orgánicas tales como trietilamina, *N,N*-diisopropiletilamina y piridina. Las bases preferidas incluyen alcóxidos metálicos tales como *tert*-butóxido de potasio y *tert*-butóxido de sodio. Los catalizadores de paladio que pueden utilizarse para esta reacción incluyen, a mero título enunciativo, paladio-carbono; sales inorgánicas de paladio, tales como cloruro de paladio; complejos orgánicos de paladio, tales como acetato de paladio; tetraquis (trifenilfosfina) paladio (0), cloruro de bis (trifenilfosfina) paladio (II), cloruro de 1,1'-bis (difenilfosfino) fenilpaladio (II) y tris (dibencilideno acetona) dipaladio (0); y un complejo orgánico de paladio inmovilizado por polímeros, tal como un bis (acetato) trifenilfosfina paladio (II) soportado por polímeros y un di (acetato) dicitclohexilfosfina paladio (II) soportado por polímeros. Son más preferidos los catalizadores de paladio tales como cloruro de paladio, acetato de paladio, tetraquis (trifenilfosfina) paladio (0), cloruro de bis (trifenilfosfina) paladio (II), cloruro de 1'-bis (difenilfosfino) fenilpaladio (II) y tris (dibencilideno acetona) dipaladio (0). Ejemplos de ligandos que pueden usarse para esta reacción incluyen, a mero título enunciativo, tris(*o*-tolil)fosfina, triciclohexilfosfina, tetrafluoroborato de tri-*tert*-butilfosfonio, (oxidi-2,1-

fenileno)bis[diciclohexil]fosfina, 4,5-bis(difenilfosfino)-9,9-dimetilxanteno, 2-diciclohexilfosfino-2'-(*N,N*-dimetilamino)bifenilo, 2-diciclohexilfosfino-2',4',6'-triisopropilbifenil, 2-diciclohexilfosfino-2',6'-dimetoxibifenil, 2-diciclohexilfosfino-2',6'-diisopropoxibifenil, 2-di-*tert*-butilfosfino-2',4',6'-triisopropilbifenilo, 2-di-*tert*-butilfosfino-3,4,5,6-tetrametil-2',4',6'-trisopropil-1,1'-bifenilo, (2-bifenilil) di-*tert*-butilfosfina,; 2-(di-*tert*-butilfosfino)bifenilo, 2-di-*tert*-butilfosfino-3,4,5,6-tetrametil-2',4',6'-triisopropil-1,1'-bifenilo, 1,1'-ferrocenediil-bis(difenilfosfina), 2-di-*tert*-butilfosfino-2'-metilbifenilo, 2-metil-2'-diclohexilfosfinobifenilo y ácido [1,1'-bifenil]-3-sulfónico, sal de sodio 2'-(diciclohexilfosfino)-2,6-dimetoxi. Los ligandos preferidos incluyen 2-(di-*tert*-butilfosfino)bifenilo, 2-di-*tert*-butilfosfino-3,4,5,6-tetrametil-2',4',6'-triisopropil-1,1'-bifenilo (Oxidi-2,1-fenileno)bis[diciclohexil]fosfina, 1,1'-ferrocenediil-bis(difenilfosfina y 4,5-bis(difenilfosfina)-9,9-dimetilxanteno.

La reacción puede llevarse a cabo a una temperatura en el intervalo de 0 °C a 200 °C, preferentemente a una temperatura en el intervalo de 50 °C a 150 °C por una duración en el intervalo de 30 minutos a 24 horas.

Esquema 2:



En otra realización preferida, los compuestos de fórmula (I), donde D representa D₁ y Z es -C=O, pueden prepararse mediante reacciones de aminocarbonilación catalizadas por metales o mediante reacciones de acoplamiento de amidas entre los compuestos de fórmula A-1 (A-2 para reacciones de acoplamiento amida), donde LG representa un grupo saliente y compuestos de fórmula D₁-1, siguiendo

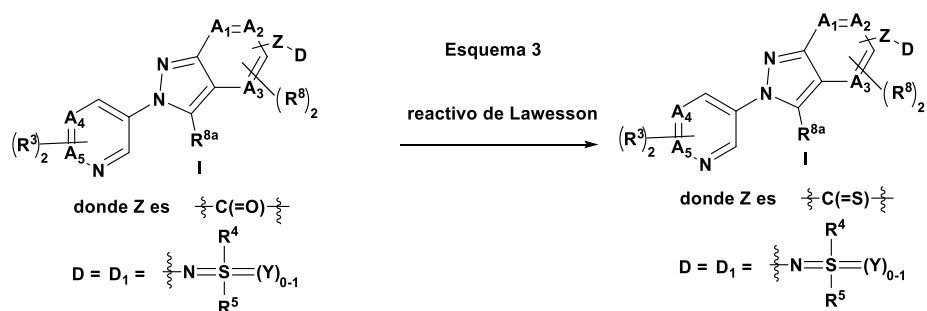
el procedimiento descrito en la bibliografía WO2016144351, *Chem. Eur. J.* 2021, 27, 17293–17321 y en más bibliografía allí citada. Los compuestos de fórmula D₁-1 pueden obtenerse comercialmente o sintetizarse por el método descrito en *Chem. Eur. J.* 2021, 27, 17293–17321, *European Journal of Medicinal Chemistry* 2017, 126, 225-245, *Chem. Commun.*, 2017, 53, 348-351, *J. Am. Chem. Soc.* 2020, 142, 36 15445–15453 y en más bibliografía allí citada. Salvo que se indique lo contrario, la definición de cada variable es la definida arriba para los compuestos de fórmula (I).

La reacción de aminocarbonilación catalizada por metales, como se representa en el esquema 2, se lleva a cabo en presencia de un solvente, tal como, a mero título enunciativo, N-amidas, con, por ejemplo: N, N-dimetilformamida, N-dimetilacetamida y 1-metil-2-pirrolidona; siendo la N,N-dimetilformamida los solventes preferidos. Los hexacarbonilos metálicos que sirven como “sustitutos de CO” en esta reacción se seleccionan de, pero no se limitan a, hexacarbonilo de molibdeno y hexacarbonilo de tungsteno. La reacción se lleva a cabo en presencia de una base seleccionada de, pero no limitada a, hidruros metálicos, tales como hidruro de sodio, hidruro de litio e hidruro de potasio; carbonatos metálicos, tales como, carbonato de sodio, carbonato de potasio, carbonato de cesio; bases aminas orgánicas, tales como trietilamina, N,N-diisopropiletilamina, 1,8-diazabicyclo[5.4.0]undec-7-eno; y preferentemente en presencia de aminas orgánicas tales como N,N-diisopropiletilamina, y 1,8-diazabicyclo[5.4.0]undec-7-eno. Los catalizadores que pueden utilizarse para esta reacción incluyen, por ejemplo, a mero título enunciativo, complejos orgánicos de paladio tales como un paladio (II) bis (acetato) trifenilfosfina soportado por polímeros, *trans*-di-μ-acetatobis[2-[bis(2-metilfenil)fosfino]bencil]dipaladio y un paladio (II) di (acetato) dicitclohexilfosfina soportado por polímeros. Un ejemplo de ligandos usados para esta reacción es el tetrafluoroborato de tri-*tert*-butilfosfonio. Esta reacción habitualmente se lleva a cabo en un intervalo de temperatura de 0 °C a 200 °C, preferentemente de 50 °C a 180 °C para una duración en un intervalo de

30 minutos a 24 horas. Opcionalmente, la reacción también puede realizarse en condiciones de irradiación por microondas.

Las reacciones de acoplamiento de amidas, como se representa en el esquema 2, se llevan a cabo normalmente en presencia de un solvente, tal como, por ejemplo, pero no limitado a, *N*-amidas, por ejemplo *N,N*-dimetilformamida, *N*-dimetilacetamida y 1-metil-2-pirrolidona; siendo *N,N*-dimetilformamida el solvente preferido. Además, estas reacciones se llevan a cabo en presencia de una base seleccionada de, pero no limitada a, bases aminas orgánicas, tales como trietilamina, *N,N*-diisopropiletilamina, 1,8-diazabicyclo[5.4.0]undec-7-eno, siendo la trietilamina y *N,N*-diisopropiletilamina las bases preferidas. Los reactivos de acoplamiento que pueden utilizarse para esta reacción son, entre otros, *N,N'*-diclohexilcarbodiimida, 1-[3-(dimetilamino)propil]-3-etilcarbodiimida metioduro, hidrato de 1-hidroxibenzotriazol, 1-[bis(dimetilamino)metileno]-1*H*-1,2,3-triazolo[4,5-*b*]piridinio 3-oxid hexafluorofosfato, y *N*-[(dimetilamino)-1*H*-1,2,3-triazolo-[4,5-*b*]piridin-1-ilmetileno]-*N*-metilmetanaminio hexafluorofosfato *N*-óxido. Esta reacción puede llevarse a cabo a una temperatura en el intervalo de 0 °C a 200 °C, preferentemente de 0 °C a 50 °C por una duración en el intervalo de 30 minutos a 24 horas.

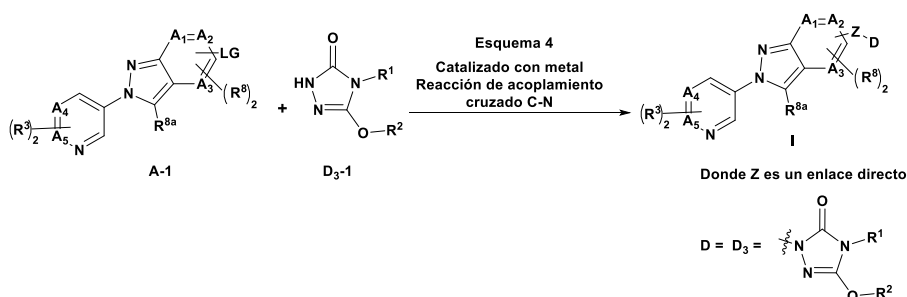
Esquema 3:



En otra realización preferida, los compuestos de fórmula (I), donde D representa D₁ y Z es -C=S, puede ser preparado empezando de los compuestos de fórmula (I), donde D representa D₁ y Z representa -C=O, en presencia del reactivo de Lawesson en condiciones de reacción de tioacilación apropiadas, como se describe en la bibliografía en *Chem. Sci.*, 2021,12, 6393-6405 y en más

bibliografía allí citada. Salvo que se indique lo contrario, la definición de cada variable es la definida arriba para los compuestos de fórmula (I). Las reacciones de tioacilación, como se representa en el esquema 3, se llevan a cabo en presencia de un solvente, tal como, por ejemplo, pero no limitado a, hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno; preferentemente en tolueno. Esta reacción puede llevarse a cabo a una temperatura en el intervalo de 0 °C a 200 °C, preferentemente de 50 °C a 150 °C por una duración en el intervalo de 30 minutos a 24 horas.

Esquema 4:



En otra realización preferida, los compuestos de fórmula (I), donde D representa D₃ y Z es un enlace directo, pueden prepararse mediante reacciones de acoplamiento cruzado catalizadas por metales entre los compuestos de fórmula A-1, donde LG representa un grupo saliente y alcoxitriazolonas de fórmula D₃-1 siguiendo el procedimiento descrito en la bibliografía en *US 20190297887* y en otra bibliografía allí citada. Las alcoxitriazolonas de fórmula D₃-1 pueden obtenerse comercialmente o sintetizarse por el método descrito en *US 005606070A* y en otra bibliografía allí citada. Salvo que se indique lo contrario, la definición de cada variable es la definida arriba para el compuesto de fórmula (I).

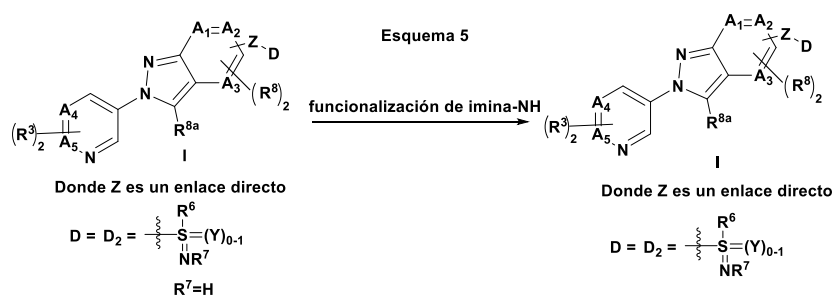
La reacción se lleva a cabo en presencia de un solvente, tal como, por ejemplo, entre otros, éteres tales como dioxano, tetrahidrofurano, 2-metil-tetrahidrofurano, éter dimetil de etilenglicol y éter dimetil de dietilenglicol; hidrocarburos aromáticos tales como benceno, tolueno y xileno; *N*, *N*-dimetilformamida, *N*-amidas tales como *N*-dimetilacetamida y 1-metil-2-pirrolidona; alcoholes tales

como metanol, etanol, propanol, butanol, 2-propanol, 2-metil-2-propanol y 2-metil-2-butanol; nitrilos tales como acetonitrilo; y agua o una mezcla de estos. Los solventes preferidos incluyen amidas tales como *N,N*-dimetilformamida, *N,N*-dimetilacetamida y 1-metil-2-pirrolidona y alcoholes tales como metanol, etanol, propanol, butanol, 2-propanol, 2-metil-2-butanol y 2-metil-2-propanol; *N,N*-dimetilformamida y 2-metil-2-butanol.

Las bases que pueden usarse en esta reacción incluyen, a mero título enunciativo, alcóxidos metálicos tales como metóxido de sodio, etóxido de sodio, *tert*-butóxido de potasio y *tert*-butóxido de sodio; bases inorgánicas tales como hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, carbonato de cesio, fosfato de sodio, fosfato de potasio, hidrogenofosfato de potasio e hidruro de potasio; y bases orgánicas tales como trietilamina, *N,N*-diisopropiletilamina y piridina. Las bases preferidas incluyen fosfatos tales como fosfato de sodio, fosfato de potasio, hidrogenofosfato de potasio y carbonatos tales como carbonato de sodio, carbonato de potasio y carbonato de cesio; donde los carbonatos tales como carbonato de sodio, carbonato de potasio y carbonato de cesio las bases más preferidas. Los catalizadores de paladio que pueden utilizarse para esta reacción incluyen, a mero título enunciativo, paladio-carbono; sales inorgánicas de paladio, tales como cloruro de paladio; complejos orgánicos de paladio, tales como acetato de paladio; tetraquis (trifenilfosfina) paladio (0), cloruro de bis (trifenilfosfina) paladio (II), cloruro de 1,1'-bis (difenilfosfino) fenilpaladio (II) y tris (dibencilideno acetona) dipaladio (0); y complejos orgánicos de paladio inmovilizados por polímeros, tales como un bis (acetato) trifenilfosfina paladio (II) soportado por polímeros y un di (acetato) dicitclohexilfosfina paladio (II) soportado por polímeros. Son más preferidos los catalizadores de paladio tales como cloruro de paladio, acetato de paladio, tetraquis (trifenilfosfina) paladio (0), cloruro de bis (trifenilfosfina) paladio (II), cloruro de 1'-bis (difenilfosfino) fenilpaladio (II) y tris (dibencilideno acetona) dipaladio (0). Ejemplos de ligandos que pueden usarse para esta reacción incluyen, a mero título enunciativo, tris(*o*-tolil)fosfina, triciclohexilfosfina,

tetrafluoroborato de tri-*tert*-butilfosfonio, (oxidi-2,1-fenileno)bis[diciclohexil]fosfina, 4,5-bis(difenilfosfino)-9,9-dimetilxanteno, 2-diciclohexilfosfino-2'-(*N,N*-dimetilamino)bifenilo, 2-diciclohexilfosfino-2',4',6'-triisopropilbifenil, 2-diciclohexilfosfino-2',6'-dimetoxibifenil, 5-(di-*tert*-butilfosfino)-1',3',5'-trifenil-1'H-[1,4]bipirazol, 5-(diciclohexilfosfino)-1',3',5'-trifenil-1'H-[1,4]bipirazol, 5-[di(1-adamantil)fosfino]-1',3',5'-trifenil-1'H-[1,4]bipirazol, 2-diciclohexilfosfino-2',6'-diisopropoxibifenilo, 2-di-*tert*-butilfosfino-2',4',6'-trisopropilbifenilo, 2-di-*tert*-butilfosfino-3,4,5,6-tetrametil-2',4',6'-triisopropil-1,1'-bifenilo, (2-bifenil) di-*tert*-butilfosfina, 2-(di-*tert*-butilfosfino)bifenilo, 2-di-*tert*-butilfosfino-3,4,5,6-tetrametil-2',4',6'-triisopropil-1,1'-bifenilo, 1,1'-ferrocenediil-bis(difenilfosfina), 2-di-*tert*-butilfosfino-2'-metilbifenilo, 2-metil-2'-diciclohexilfosfinobifenilo, ácido [1,1'-bifenil]-3-sulfónico, sal de sodio 2'-(diciclohexilfosfino)-2,6-dimetoxi. Los ligandos preferidos incluyen 2-(di-*tert*-butilfosfino)bifenilo, 5-(di-*tert*-butilfosfino)-1', 3', 5'-trifenil-1'H-[1,4]bipirazol, 5-(diciclohexilfosfino)-1',3',5'-trifenil-1'H-[1,4]bipirazol, 5-[di(1-adamantil)fosfino]-1',3',5'-trifenil-1'H-[1,4]bipirazol, 1,1'-ferrocenediil-bis(difenilfosfina y 4,5-is(difenilfosfino)-9,9-dimetilxanteno. La reacción se lleva a cabo a una temperatura en el intervalo de 0 °C a 200 °C, preferentemente de 50 °C a 150 °C por una duración en el intervalo de 30 min a 24 horas.

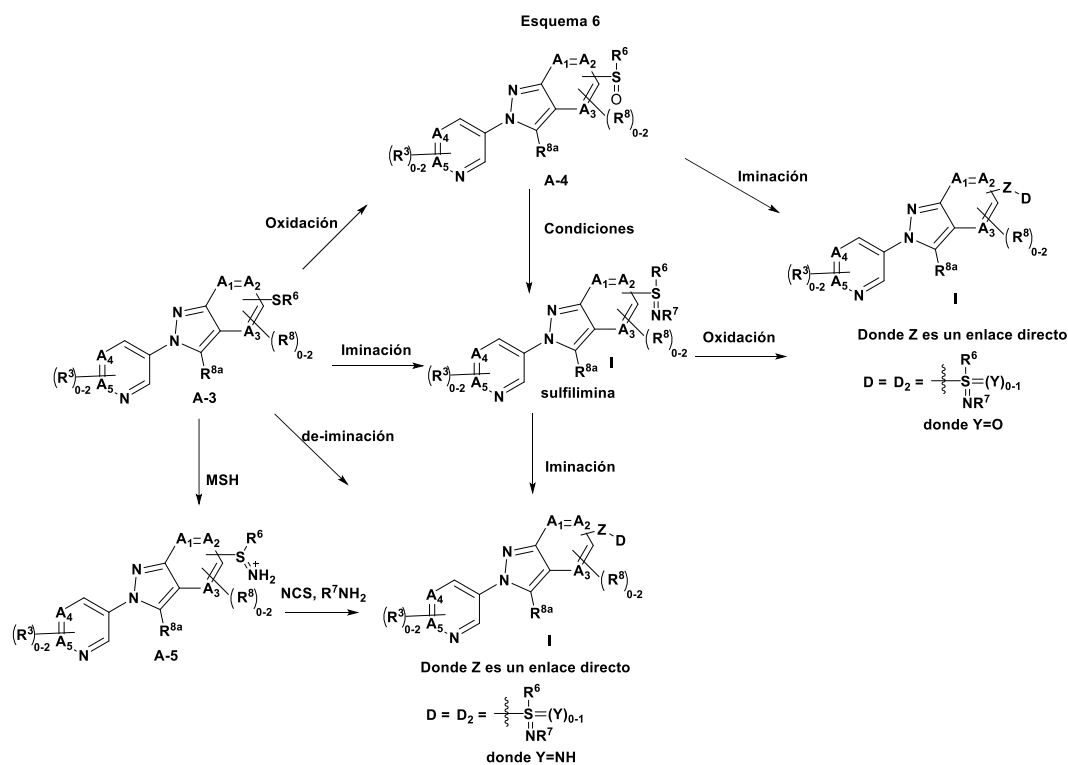
Esquema 5:



En otra realización preferida, los compuestos de fórmula (I), donde D representa D_2 , Z es un enlace directo, y R^7 representa hidrógeno pueden derivarse más en el grupo funcional imina -NH, usando reacciones tales como, pero no limitadas a, *N*-(halo)alquilación, *N*-(hetero)arilación, *N*-acilación, *N*-amidación, *N*-

halogenación y N-cianación para formar compuestos de fórmula (I), donde D representa D₂, Z representa un enlace directo, y R⁷ representa su significado habitual excluido hidrógeno siguiendo métodos adecuados como los descritos en la bibliografía, por ejemplo, *European Journal of Medicinal Chemistry* 2017, 126, 225-245, *Org. Lett.* 2015, 17, 12, 3166–3169, *Tetrahedron Letters* 56 (2015) 7056–7058, *Eur. J. Org. Chem.* 2012, 20, 3737-3741 y WO2019150219 en más bibliografía allí citada. Salvo que se indique lo contrario, la definición de cada variable es la que figura más arriba.

Esquema 6:



En otra realización preferida, una o más de una serie de representantes que contienen azufre de los compuestos de fórmula (I), tales como, pero no limitados a, sulfoximinas, sulfiliminas y sulfondiimidas, representados por fórmula (I), donde D representa D₂, Z es un enlace directo y R⁷ es como se define en el presente documento más arriba, se pueden preparar a partir de los compuestos de fórmula A-3, siguiendo el procedimiento como se describe en la literatura, por

ejemplo, en el *European Journal of Medicinal Chemistry* 2017, 126, 225-245 y *Chem. Commun.*, 2017, 53, 348-351 y en más bibliografía allí citada. Salvo que se indique lo contrario, la definición de cada variable es la definida arriba para los compuestos de fórmula (I). Las sulfoximinas de fórmula (I) pueden prepararse a partir de sulfuros de fórmula A-3 en presencia de carbamato de amonio y diacetoxiyodobenceno (véase, por ejemplo, *Angew. Chem. Int. Ed.* 2016, 55, 7203-7207). Alternativamente, las sulfoximinas (I) también pueden sintetizarse a través de la oxidación de sulfiliminas (I) (véase, por ejemplo, *Chem. Rev.* 1977, 77, 409-435). Por otra parte, las sulfiliminas de fórmula (I) pueden obtenerse a partir de sulfuros de fórmula (A-3) a través de una reacción de iminación utilizando reactivos aminantes electrófilos, tales como la O-(mesitilsulfonil)hidroxilamina (MSH) o O-(2,4-dinitrofenil)hidroxilamina (DPH), siguiendo el procedimiento descrito en la bibliografía, por ejemplo, en *Angew. Chem. Int. Ed.* 2012, 51, 4440-4443 y en más bibliografía allí citada. Las sulfiliminas de fórmula (I) también pueden prepararse a partir de los sulfóxidos de fórmula (A-4) a través de iminación usando a) reactivos de tipo Burgess, como se describe en la bibliografía, por ejemplo, en el *Adv. Synth. Catal.* 2013, 355, 3363-3368 y en más bibliografía allí citada, o b) condiciones catalizadas por rodio en presencia de reactivos aminantes electrófilos, tales como, pero no limitados a, O-(mesitilsulfonil)hidroxilamina (MSH) u O-(2,4-dinitrofenil)hidroxilamina (DPH), tal como se describe en la bibliografía, por ejemplo, en *Chem. Commun.*, 2014, 50, 9687-9689 y en más bibliografía allí citada. Las sulfondiimidias de fórmula (I) pueden sintetizarse mediante a) iminación directa de sulfuros de fórmula A-3 como se describe en la bibliografía, por ejemplo, en *Chem. Ber.* 1984, 117, 2779-2784 y en la literatura adicional citada en el mismo o b) iminación de sulfiliminas de fórmula (I) como se describe en la bibliografía, por ejemplo, en *Angew. Chem. Int. Ed.* 2012, 51, 4440-4443 y en más bibliografía allí citada o c) iminación de las sales de sulfiliminio, representadas por fórmula A-5, utilizando N-clorosuccinimida y aminas como se describe en la bibliografía,

por ejemplo, en *Angew. Chem. Int. Ed.* 2012, 51, 4440-4443 y en más bibliografía allí citada.

Según una característica de la presente invención, los compuestos de fórmula A-3 donde todos los sustituyentes son conforme se define anteriormente, pueden prepararse mediante el método que se describe en el esquema 7, el esquema 8, el esquema 9 o como se divulga en los ejemplos experimentales. A continuación se muestran los procedimientos representativos; sin embargo, esta divulgación no debe interpretarse como limitante del alcance de esta invención para sintetizar los compuestos de fórmula A-3.

Esquema 7:



Según el esquema 7, el compuesto representado por la fórmula A-3 puede prepararse mediante una reacción de acoplamiento C-S mediada por bases o catalizada por metales entre los compuestos de la fórmula A-1 y los tioles de la fórmula R^6SH conforme se describe en *WO2020257145* y en la bibliografía citada en el mismo. Los tioles de la fórmula R^6SH pueden obtenerse comercialmente. A menos que se indique lo contrario, la definición de cada una de las variables A_1 , A_2 , A_3 , A_4 , A_5 , R^3 , R^6 , R^8 y R^{8a} es conforme se define anteriormente. LG representa a los grupos salientes, tal como los halógenos y los tosilatos.

El protocolo general para el acoplamiento C-S: por lo general, la reacción se lleva a cabo en presencia de un solvente, tal como éteres como dioxano, tetrahidrofurano, 2-metil-tetrahidrofurano, éter dimetílico de metilenglicol y éter dimetílico de dietilenglicol; hidrocarburos aromáticos como benceno, tolueno y xileno; N, N-dimetilformamida, N-amidas como N-dimetilacetamida y 1-metil-2-pirrolidona; alcoholes como metanol, etanol, propanol, butanol, 2-propanol, 2-metil-2-propanol y 2-metil-2-butanol; nitrilos como acetonitrilo; y agua o una

mezcla de estos. Los solventes de mayor preferencia incluyen amidas como N,N-dimetilformamida, N,N-dimetilacetamida y 1-metil-2-pirrolidona, e hidrocarburos aromáticos como benceno, tolueno y xileno; donde la N,N-dimetilformamida y el tolueno son los solventes de mayor preferencia. La reacción se lleva a cabo en presencia de una base seleccionada de forma no limitante entre, alcóxidos metálicos, tales como metóxidos de sodio, etóxidos de sodio, *tert*-butóxido de potasio y *tert*-butóxido de sodio; bases inorgánicas, como hidróxido de sodio, hidróxido de potasio, carbonato de sodio, carbonato de potasio, carbonato de cesio, fosfato de sodio, fosfato de potasio, hidrogenofosfato de potasio e hidruro de potasio, y bases orgánicas como trietilamina, N,N-diisopropiletilamina y piridina. Las bases preferidas incluyen alcóxidos metálicos como metóxidos de sodio, etóxidos de sodio, *tert*-butóxido de potasio, *tert*-butóxido de sodio y carbonatos como carbonato de sodio, carbonato de potasio y carbonato de cesio; donde los carbonatos como el carbonato de cesio y los alcóxidos metálicos como el *tert*-butóxido de sodio y el *tert*-butóxido de potasio son los de mayor preferencia. Los catalizadores de paladio que pueden utilizarse para esta reacción son, por ejemplo, a mero título enunciativo, paladio-carbono; sales inorgánicas de paladio como el cloruro de paladio; complejos orgánicos de paladio como el acetato de paladio; tetraquis (trifenilfosfina) paladio (0), cloruro de bis (trifenilfosfina) paladio (II), cloruro de 1,1'-bis (difenilfosfino) fenilpaladio (II) y tris (dibencilideno acetona) dipaladio (0); y complejos orgánicos de paladio inmovilizados por polímeros, como un bis (acetato) trifenilfosfina paladio (II) soportado por polímeros y un di (acetato) dicitclohexilfosfina paladio (II) soportado por polímeros. Los catalizadores de paladio, como el cloruro de paladio, el acetato de paladio, el tetraquis (trifenilfosfina) paladio (0), el cloruro de bis (trifenilfosfina) paladio (II), el cloruro de 1'-bis (difenilfosfino) fenilpaladio (II) y el tris (dibencilideno acetona) dipaladio (0) son los de mayor preferencia. Los ligandos que pueden utilizarse para esta reacción incluyen, a mero título enunciativo, tris(*o*-tolil)fosfina, triciclohexilfosfina, tetrafluoroborato de tri-*tert*-butilfosfonio, (oxidi-2,1-fenileno)bis[dicitclohexil]fosfina, 4,5-bis(difenilfosfino)-

9,9-dimetilxanteno, 2-diclohexilfosfino-2'-(N,N-dimetilamino)bifenilo, 2-diclohexilfosfino-2',4',6'-trisopropilbifenilo, 2-diclohexilfosfino-2',6'-dimetoxibifenilo, 5-(di-*tert*-butilfosfino)-1', 3', 5'-trifenil-1'H-[1,4]bipirazol, 5-(diciclohexilfosfino)-1',3',5'-trifenil-1'H-[1,4]bipirazol, 5-[di(1-adamantil)fosfino]-1',3', 5'-trifenil-1'H-[1,4]bipirazol, 2-diclohexilfosfino-2',6'-diisopropoxibifenilo, 2-di-*tert*-butilfosfino-2',4',6'-trisopropilbifenilo, 2-di-*tert*-butilfosfino-3,4,5,6-tetrametil-2',4',6'-trisopropil-1,1'-bifenilo, (2-bifenil) di-*tert*-butilfosfina, 2-(di-*tert*-butilfosfino)bifenilo, 2-di-*tert*-butilfosfino-3,4,5,6-tetrametil-2',4',6'-trisopropil-1,1'-bifenilo, 1,1'-ferrocenediil-bis(difenilfosfina), 2-di-*tert*-butilfosfino-2'-metilbifenilo, 2-metil-2'-diclohexilfosfinobifenilo, ácido [1,1'-bifenil]-3-sulfónico, sal de 2'-(diciclohexilfosfino)-2,6-dimetoxi-sodio. Los ligandos preferidos incluyen 2-(di-*tert*-butilfosfino)bifenilo, 5-(di-*tert*-butilfosfino)-1',3',5'-trifenil-1'H-[1,4]bipirazol, 5-(diciclohexilfosfino)-1',3',5'-trifenil-1'H-[1,4]bipirazol, 5-[di(1-adamantil)fosfino]-1',3',5'-trifenil-1'H-[1,4]bipirazol, 1,1'-ferrocenediil-bis(difenilfosfina, y 4,5-bis(difenilfosfino)-9,9-dimetilxanteno. Esta reacción habitualmente se lleva a cabo en un intervalo de temperatura de 0 °C a 200 °C, preferentemente de 50 °C a 150 °C para una duración en un intervalo de 30 minutos a 24 horas.

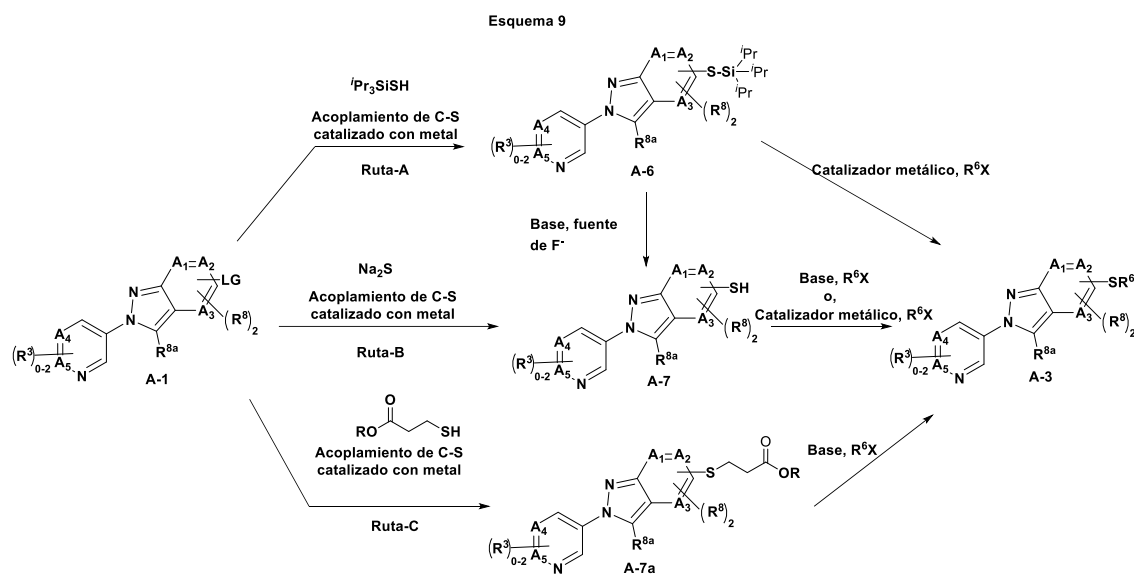
Esquema 8:



Alternativamente, los compuestos de la fórmula A-3 pueden prepararse también, como se representa en el esquema 8, al seguir el “protocolo general para el acoplamiento C-S” conforme se describe arriba. Los compuestos de la fórmula A-1 y los tiolatos metálicos de adecuados de la fórmula R^6SM puede producir compuestos de la fórmula A-3 conforme se describe en la bibliografía en WO2020257145 y en la bibliografía citada en el mismo. Los tiolatos metálicos de la fórmula R^6SM , donde M puede ser, a mero título enunciativo, sodio o potasio, y pueden obtenerse comercialmente o pueden ser generados *in situ* mediante el

tratamiento de los tioles correspondientes con bases orgánicas e inorgánicas. A menos que se indique lo contrario, la definición de cada una de las variables A_1 , A_2 , A_3 , A_4 , A_5 , R^3 , R^6 , R^8 y R^{8a} es conforme se define anteriormente. LG representa a los grupos salientes, tal como los halógenos y los tosilatos.

Esquema 9:

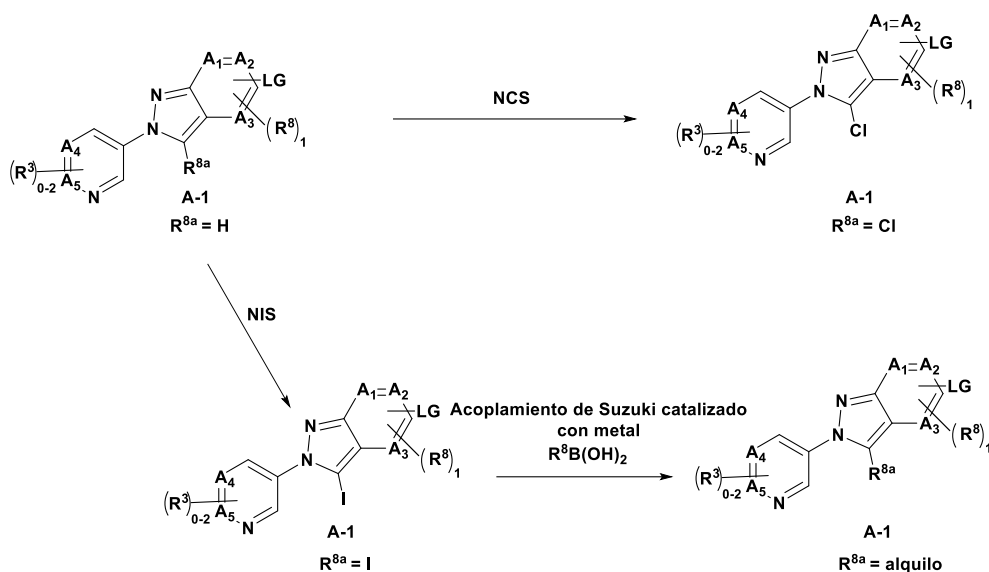


En otra realización de la presente invención, los compuestos de la fórmula A-3, donde todos los sustituyentes son conforme se describe anteriormente, pueden prepararse mediante los métodos dados en el esquema de reacción 9. Los compuestos de fórmula A-1 pueden someterse a reacciones de acoplamiento C-S catalizadas por metales conforme se describe arriba en el protocolo general del acoplamiento C-S en presencia de trialquililsilanotioles, como el triisopropilsilanotiol, para obtener compuestos tiosililos de la fórmula A-6 (vía-A). Los tiosilos de fórmula A-6 pueden así desprotegerse para obtener compuestos de fórmula A-7 mediante el uso de una base adecuada, como, a mero título enunciativo, carbonato sódico, carbonato potásico, carbonato de cesio, o bases de hidruro metálico, como, a mero título enunciativo, hidruro sódico, hidruro potásico y fuentes de fluoruro, como fluoruros metálicos, por ejemplo, a mero título enunciativo, de fluoruro de cesio, fluoruro de sodio o reactivos en los que el ion metálico se intercambia por cationes de tetraalquilamonio, por ejemplo, a

mero título enunciativo, como en el fluoruro de tetrametilamonio, el fluoruro de tetraetilamonio, el fluoruro de tetrabutilamonio, conforme se describe en la bibliografía en WO2020257145 y en la bibliografía complementaria citada en el mismo. Los tioles de fórmula A-7 pueden obtenerse también mediante las reacciones de acoplamiento catalizadas por metales entre los compuestos de la fórmula A-1 y el sulfuro sódico comercial ($\text{Na}_2\text{S} \cdot 9\text{H}_2\text{O}$) mediante cantidades catalíticas de 1,2-etaneditiol (vía B; véase, por ejemplo, *Synlett* 2017; 28(17) 2272-2276 y la bibliografía complementaria citada en el mismo). Los tioles de fórmula A-7 pueden también ser alquilados en presencia de bases orgánicas e inorgánicas adecuadas y haluros de alquilo adecuados de la fórmula R^6X para obtener compuestos de la fórmula A-3. Los haluros de alquilo de la fórmula R^6X pueden obtenerse comercialmente. Alternativamente, los compuestos de tiosililo de fórmula A-6 pueden (hetero)arilarse en presencia de haluros de (hetero)arilo, o triflatos, o tosilatos de la fórmula R^6X apropiados mediante condiciones de reacción de acoplamiento cruzado C-C catalizadas por metales adecuados para obtener los compuestos de la fórmula A-3, conforme se describe en la bibliografía en WO2011087712, WO2004087156 y en la bibliografía complementaria citada en los mismos. Además, los compuestos de fórmula A-1 pueden someterse también a reacciones de acoplamiento C-S catalizadas por metales en presencia de mercapto ésteres conforme se describe en el protocolo general para obtener sulfuros de fórmula A-7a (vía C), donde R representa grupos alquilo. Se puede concebir además una reacción retro-Micheal mediada por bases para generar sulfuros metálicos *in situ* que pueden someterse a varias S-alkilaciones con haluros de alquilo apropiados para obtener uno o más de una serie de sulfuros A-3 conforme se describe en la bibliografía de *J. Med. Chem.* 2020, 63, 2308-2324 y en la literatura citada en el presente documento. A menos que se indique lo contrario la definición de cada variable es conforme se describe anteriormente. X representa los grupos salientes, tal como los halógenos, los triflatos, los mesilatos o los tosilatos.

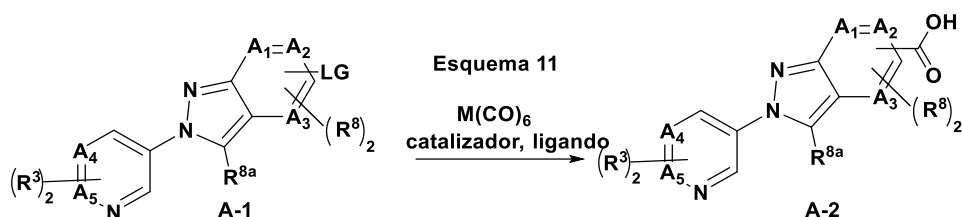
Esquema 10:

Esquema 10



Según el esquema 10, la presente invención proporciona un método para la funcionalización C-H selectiva en R⁸ del anillo central de pirazol de fórmula A-1, donde el mismo R⁸ representa hidrógeno y todas las otras variables conllevan su significado habitual. En presencia de N-clorosuccinimida (NCS), A-1 puede sufrir selectivamente la cloración de R⁸ en el anillo central de pirazol para formar compuestos de la fórmula A-1, en los que el pirazol-R⁸ representa Cl. Además, el mismo hidrógeno R⁸ de A-1 puede también ser alquilado en dos pasos sucesivos. En primer lugar, una yodación similar de R⁸ en presencia de N-yodo-succinimida, seguida de una reacción de acoplamiento de Suzuki catalizada por metales en presencia de diversos ácidos alquil borónicos, representados por la fórmula R⁸B(OH)₂, para formar compuestos de fórmula A-1, en los que el pirazol-R⁸ representa diferentes grupos alquilo (para una visión global sobre la funcionalización C-H en el indazol R⁸, véase: *Org. Biomol. Chem.*, 2022, 20, 7746).

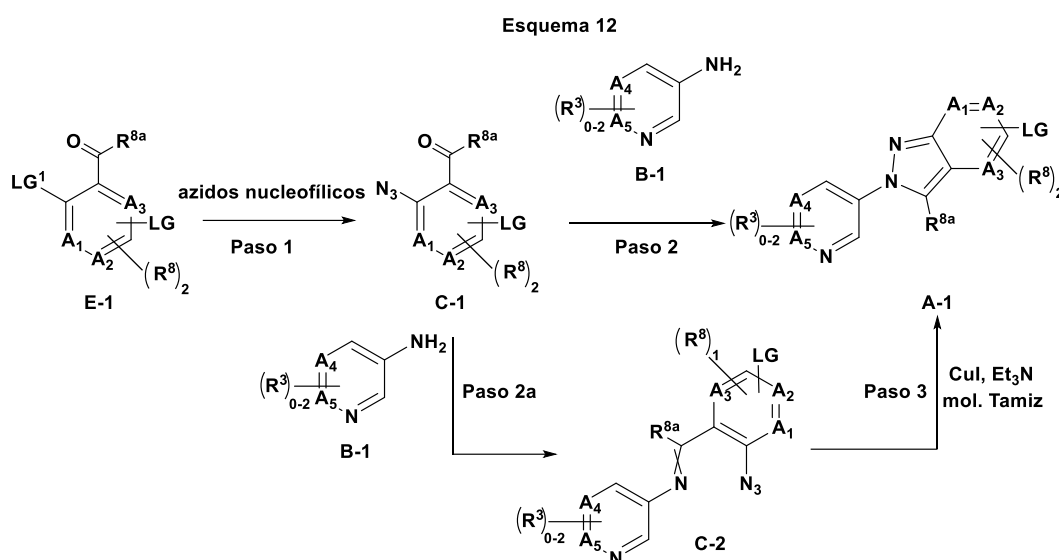
Esquema 11:



En otra realización según el esquema 11, la presente invención proporciona un método para la preparación de los compuestos de fórmula A-2, donde todos los sustituyentes son conforme se definen anteriormente. Los compuestos de la fórmula A-1, en los que A₁, A₂, A₃, A₄, A₅, R³, R⁸ y R^{8a} tienen su significado habitual conforme se define anteriormente y LG representa un grupo saliente, preferentemente un halógeno, pueden convertirse en ácidos carboxílicos de la fórmula A-2, mediante un procedimiento como el que se describe en WO 2016144351 y en la bibliografía complementaria citada en el presente documento. Los hexacarbonilos metálicos que sirven como "fuente de CO" en esta reacción se seleccionan entre, a mero título enunciativo, el hexacarbonilo de molibdeno y el hexacarbonilo de wolframio. La reacción se lleva a cabo en presencia de una base seleccionada de, a mero título enunciativo, hidruros metálicos, tales como hidruro de sodio, hidruro de litio, e hidruro de potasio; carbonatos metálicos, tales como carbonato de sodio, carbonato de potasio, carbonato de cesio; bases aminas orgánicas, tales como trietilamina, N,N-diisopropiletilamina, 1,8-diazabicyclo[5.4.0]undec-7-eno; y aminas orgánicas como N,N-diisopropiletilamina, y 1,8-diazabicyclo[5.4.0]undec-7-eno como bases preferidas. Los catalizadores que pueden utilizarse para esta reacción incluyen, por ejemplo, a mero título enunciativo, complejos orgánicos de paladio como un paladio (II) bis (acetato) trifenilfosfina soportado por polímeros, trans-di-μ-acetatobis[2-[bis(2-metilfenil)fosfino]bencil]dipaladio, y un paladio (II) di(acetato) dicitclohexilfosfina soportado por polímeros. Los ejemplos de los ligandos que se utilizan para esta reacción se seleccionan de, a mero título enunciativo, tetrafluoroborato de tri-*tert*-butilfosfonio. Esta reacción habitualmente se lleva a cabo en un intervalo de temperatura de 0 °C a 200 °C, preferentemente de 50 °C

a 180 °C para una duración en un intervalo de 30 minutos a 24 horas. Opcionalmente, esta reacción puede llevarse a cabo en condiciones de irradiación de microondas.

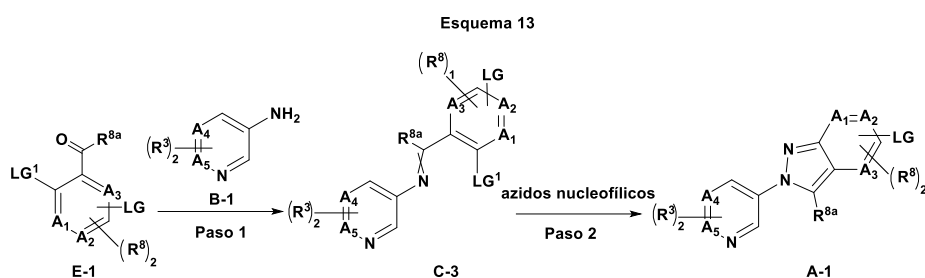
Esquema 12:



Según el esquema 12, la presente invención proporciona un método para la preparación de los compuestos de fórmula A-1 de los benzaldehídos sustituidos de fórmula E-1, donde A_1 , A_2 , A_3 , R^8 and R^{8a} son conforme se define anteriormente. LG y LG^1 representan los grupos salientes, preferentemente los sustituyentes de halógeno. Los benzaldehídos convenientemente sustituidos de la fórmula E-1 pueden someterse a reacciones de sustitución nucleofílica en presencia de azidas orgánicas o inorgánicas nucleofílicas, ya sea a temperatura ambiente o a temperatura elevada para obtener aril-azidas de la fórmula C-1. Las aril-azidas de la fórmula C-1 pueden someterse a reacción además con aminas heteroarílicas de fórmula B-1, en las que A_4 , A_5 y R^3 son conforme se definen anteriormente, para formar productos intermedios de imina que se someten a ciclización *in situ* a temperatura elevada para obtener los productos bicíclicos deseados de fórmula A-1 (véase, por ejemplo, WO2016144351). Sin embargo, y según la naturaleza del sustrato, la temperatura elevada del método de ciclización *in situ* puede presentar otros desafíos. Para evitarlo, puede

aplicarse un método a baja temperatura mediado por Cu/ligando para ciclar C-2, conforme se describe en la bibliografía *Chem.* 2011, 47, 10133-10135 y en la literatura citada en el presente documento (paso 3).

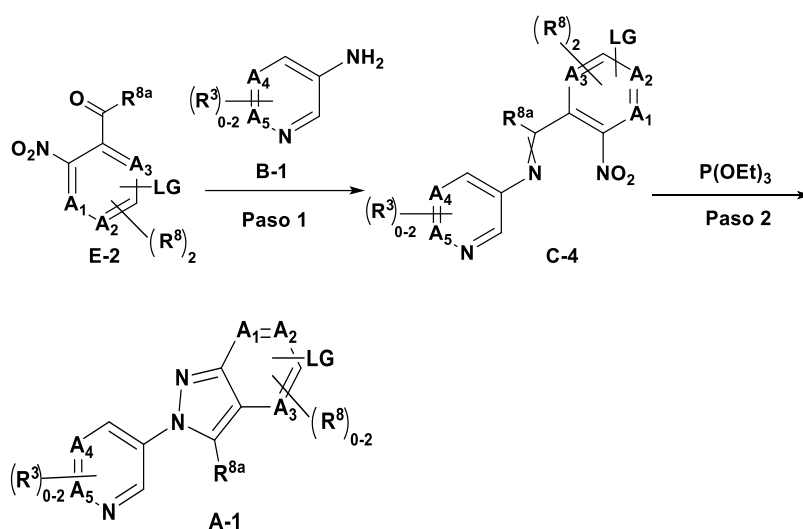
Esquema 13:



Alternativamente, los compuestos de fórmula A-1 pueden prepararse conforme se describe en el esquema 13. Los benzaldehídos sustituidos de la fórmula E-1, en los que A₁, A₂, A₃, R⁸ y R^{8a} son conforme se definen anteriormente, mientras que LG y LG¹ representan un grupo saliente, preferentemente sustituyentes halógenos, se someten a reacción con las aminas heteroarílicas de la fórmula B-1, en las que A₄, A₅ y R³ son conforme se definen anteriormente, ya sea a temperatura ambiente o a temperatura elevada para formar iminas de la fórmula C-3. La imina de fórmula C-3, en presencia de una azida orgánica o inorgánica nucleófila, ya sea a temperatura ambiente o a temperatura elevada, puede experimentar primero una reacción de sustitución intermolecular seguida de la consiguiente reacción de ciclación intramolecular *in situ* para obtener los productos bicíclicos de la fórmula A-1 (véase, por ejemplo, WO2016144351).

Esquema 14:

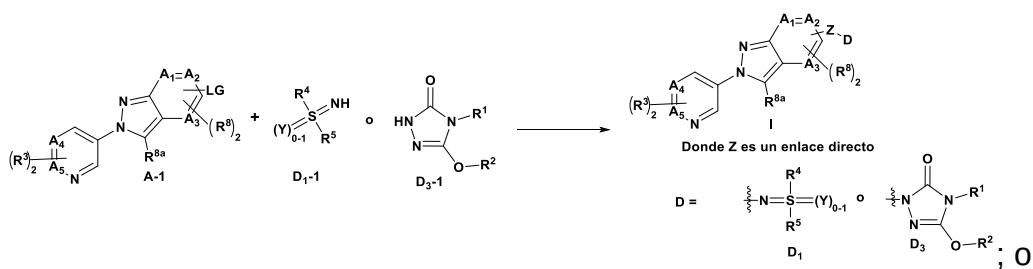
Esquema 14



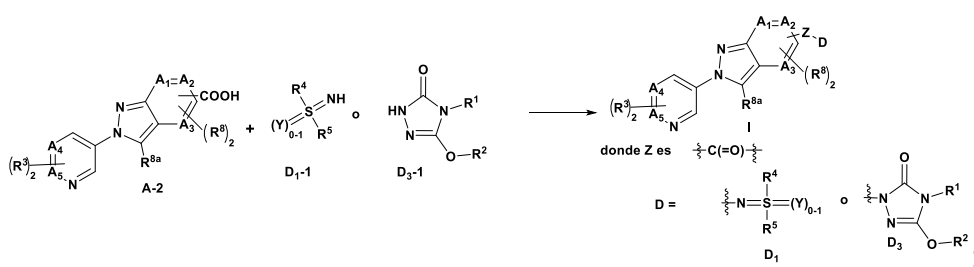
Alternativamente, los compuestos de fórmula A-1 pueden prepararse conforme se describe en el esquema 14. Los 2-nitrobenzaldehídos de fórmula E-2 convenientemente sustituidos, en los que A₁, A₂, A₃, R⁸ y R^{8a} son conforme se definen anteriormente, pueden someterse a reacción con las aminas heterocíclicas de fórmula B-1, en las que A₄, A₅ y R³ son conforme se definen anteriormente, para formar iminas C-4. Por consiguiente, una ciclización reductora en el segundo paso de reacción, en presencia de un reactivo de fósforo (III) adecuado, por ejemplo fosfito de trietilo, a una temperatura elevada, puede producir compuestos bicíclicos de la fórmula A-1 (véase, por ejemplo, *US2019029788*). Se encuentran disponibles varios métodos de ciclización reductiva alternativos y pueden implementarse como se representa en la *Org. Lett.* 2014, 16, 3114-3117 y en la literatura citada en el presente documento.

En una realización, la presente invención proporciona un método para la preparación de los compuestos de fórmula (I) donde D es D₁ o D₃ y comprende los pasos de:

- i. someter a reacción un compuesto de fórmula (A-1) con un compuesto de fórmula (D₁-1) o (D₃-1) para obtener un compuesto de fórmula (I) donde Z es un enlace directo;



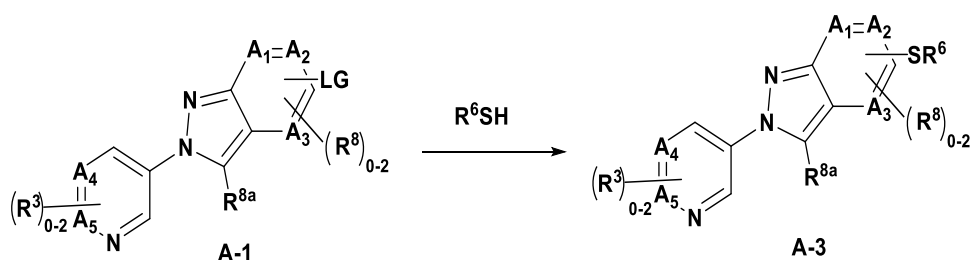
i. hacer reaccionar un compuesto de fórmula (A-2) con un compuesto de fórmula (D1-1) o (D3-1) para obtener un compuesto de fórmula (I) donde Z sea un enlace $-\text{C}(=\text{O})-$;



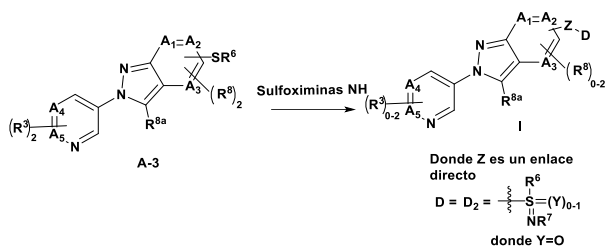
donde la definición de A₁, A₂, A₃, A₄, A₅, R¹, R², R³, R⁴, R⁵, R⁸ y R^{8a} es la misma que se define en la descripción.

En otra realización, la presente invención proporciona un método para la preparación de los compuestos de fórmula (I) donde D es D₂ y comprende los pasos de:

i. hacer reaccionar un compuesto de fórmula (A-1) con un compuesto de fórmula R⁶SH para obtener un compuesto de fórmula (A-3), donde Z es un enlace directo;

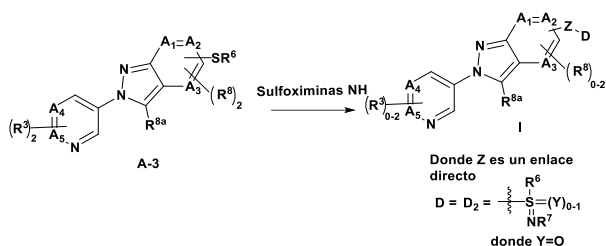


ii. convertir el compuesto de fórmula (A-3) en un compuesto de fórmula (I) mediante la transferencia de O y NH usando reactivos oxidantes y fuentes de N adecuados,



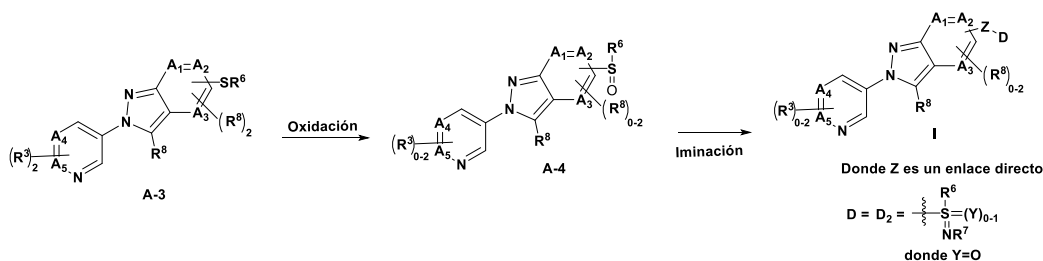
En una realización, en la presente invención se proporciona un método para preparar compuestos de fórmula (I), donde D es D₂ y el paso II se puede llevar a cabo en una sola acción, como se menciona a continuación:

ii. convertir el compuesto de fórmula (A-3) en un compuesto de fórmula (I) mediante la transferencia de O y NH usando reactivos oxidantes y fuentes de N adecuados,



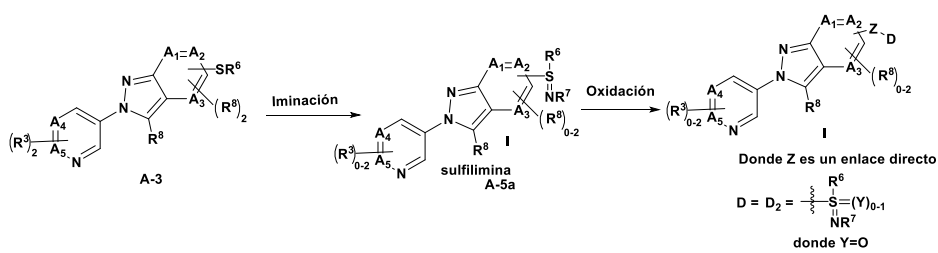
En una realización, en la presente invención se proporciona un método para preparar compuestos de fórmula (I), donde D es D₂ y el paso II se puede llevar a cabo en dos acciones, como se menciona a continuación:

ii. oxidar un compuesto de fórmula (A-3) con un reactivo oxidante adecuado para obtener un compuesto de fórmula (A-4), que se convirtió posteriormente en el compuesto de fórmula (I) mediante iminación con una fuente de N o un reactivo de iminación adecuados;



O

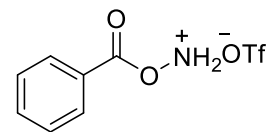
ii. iminar un compuesto de fórmula (A-3) con una fuente de N o un reactivo de iminación adecuados para obtener un compuesto de fórmula (A-5a), que se convirtió posteriormente en el compuesto de fórmula (I) mediante oxidación con un agente oxidante adecuado;



donde LG representa un grupo saliente y A₁, A₂, A₃, A₄, A₅, R³, R⁶, R⁷, R⁸ y R^{8a} son iguales según lo definido en la reivindicación 1.

El agente oxidante adecuado en el paso (II) se selecciona de: H₂O₂; H₂O₂, FeCl₃ (catalizador); H₂O₂, óxido de molibdeno y cerio (catalizador); H₂O₂, ácido trifluorometansulfónico, óxido de sodio y tungsteno (Na₂WO₄); ácido *m*-cloroperbenzoico; periodato de sodio; diacetato de feniliodina(III) (PIDA); ácido clorhídrico o ácido acético, peróxido de hidrógeno; ácido peracético; hidroperóxido de trifenilmetilo; catalizadores: *bis*(acetilacetato)dioxomolibdeno; H₂O₂, bromuro de tetrafenilfosfonio (*PB-7-23-111'1'2*)-diaquaodiperoximolibdeno 1*H*-imidazolio, 1,3-*bis*[(1*S*)-1-carboxi-2-metilpropil]-, ion dipolar; 2-(1-hidroperoxi-1-metiletil)furano; catalizadores: dietiltartrato, isopropóxido de titanio; H₂O₂; catalizadores: pentacloruro de tantalio; hidroperóxido de *tert*-butilo; oxígeno; catalizadores: dióxido de nitrógeno; oxígeno; catalizadores: tetrafluoroborato de nitrosonio; hipoclorito de *tert*-butilo; clorotrimetilsilano; H₂O₂; nitrato de tetrabutilamonio; catalizadores: nitrato cúprico, tetracarbonilbis(trifenilfosfina)molibdeno; o H₂O₂, cloruro de circonio (ZrCl₄).

La fuente de N o el reactivo de iminación adecuados en el paso II se seleccionan de lo siguiente:



carbamato de amonio; azida de sodio, bicarbonato de sodio, FeSO_4 , fenantrolina y MeCN (0,4 mL); azida de sodio, H_2SO_4 concentrado; trifluoroacetamida, MgO, y $\text{Rh}_2(\text{OAc})_4$, $\text{PhI}(\text{OAc})_2$; (O-(mesitilsulfonyl)hidroxilamina); Ph-I=N-Ts (Ts = toluensulfonyl); Ph-I=N-Ns (Ns = N-alkil nitrobenzenosulfonamidas); Ph-I=N-Ses (2-(trimetilsilil)etansulfonyl); o $\text{Rh}_2(\text{esp})_2$ y O-(2,4-dinitrofenil)hidroxilamina.

En una realización, el agente oxidante y la fuente de N o el reactivo de iminación se pueden utilizar en un receptáculo o de manera individual en una reacción por pasos.

En una realización, el agente oxidante y la fuente de N o el reactivo de iminación se pueden utilizar de forma individual o en una combinación de estos.

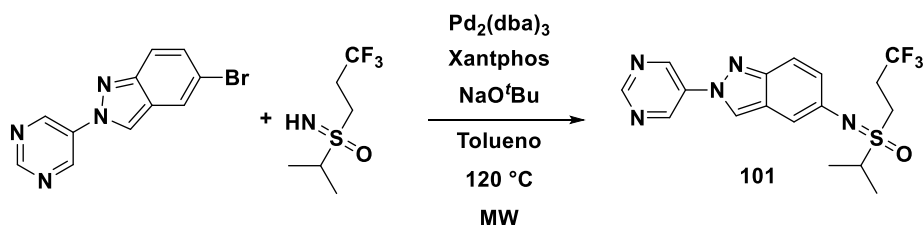
Sin más elaboración, es razonable creer que cualquier experto en la técnica que aplica la descripción precedente pueda utilizar la presente invención en su máxima extensión.

EJEMPLOS DE QUÍMICA:

Los siguientes ejemplos demuestran la manera y el proceso de producción de los compuestos de la presente invención, sin que sean una limitación de estos e incluyen el mejor modo que contemplaron los inventores para llevar a cabo la invención.

Procedimiento experimental:

Ejemplo 1: Síntesis de isopropil((2-(pirimidin-5-il)-2H-indazol-5-il)imino)(3,3,3-trifluoropropil)- λ^6 -sulfanona **101**



Se trató una solución de 5-bromo-2-(pirimidin-5-il)-2H-indazol (0,25 g; 0,909 mmol) e imino(isopropil)(3,3,3-trifluoropropil)-λ⁶-sulfanona (0,185 g; 0,909 mmol) en tolueno (5 mL) con tris(dibencilidenacetona)dipaladio(0) (Pd₂(dba)₃) (0,042 g; 0,045 mmol), (9,9-dimetil-9H-xanteno-4,5-diil)bis(difenilfosfano) (Xantphos) (0,053 g; 0,091 mmol), *tert*-butóxido de sodio (NaO^tBu) (0,087 g; 0,909 mmol) y se irradió en un dispositivo de microondas (MW) a 120 °C durante 1 h. Tras completarse la reacción, la mezcla de reacción se desactivó con la adición de agua (10 mL) y se extrajo con acetato de etilo (2 × 25 mL). Se secaron las capas orgánicas combinadas sobre sulfato de sodio anhidro y se concentraron a presión reducida para obtener un residuo aceitoso. Este residuo se purificó mediante cromatografía líquida de alta resolución (HPLC) en fase inversa preparativa (método de gradiente: tampón de solución acuosa de acetato de amonio 10 mM en acetonitrilo en una proporción de 19:1 a 0:100) para obtener la isopropil((2-(pirimidin-5-il)-2H-indazol-5-il)imino)(3,3,3-trifluoropropil)-λ⁶-sulfanona **101** deseada (209 mg; 0,526 mmol, rendimiento del 58%).

Tabla 1: Los compuestos representativos de la presente divulgación se prepararon según el material inicial y el método adecuados conforme se describe en el Ejemplo 1.

Nota: Para ciertos sustratos, se observaron mejores resultados cuando se usaron carbonato de cesio (Cs₂CO₃) o fosfato potásico tribásico (K₃PO₄) en vez de *tert*-butóxido de sodio.

N.º de comp.	Nombres del compuesto	Datos analíticos
1	dimetil((2-(piridazin-3-il)-2H-indazol-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,27 (d, J = 2,2 Hz, 1H), 8,93 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 8,60 (dd, J = 4,8; 1,3 Hz; 1H), 8,41 (dq, J = 8,3, 1,4 Hz, 1H),

		7,62-7,57 (m, 2H), 7,16 (q, J = 1,0 Hz, 1H), 6,97 (dd, J = 9,2, 2,1 Hz, 1H), 3,23 (s, 6H); ESI MS (m/z): 286,95 [M+1].
2	etil(metil)((2-(piridin-3-il)-2H-indazol-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,27 (d, J = 2,1 Hz, 1H), 8,92 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 8,60 (dd, J = 4,7; 1,4 Hz, 1H), 8,41 (dq, J = 8,3; 1,4 Hz, 1H), 7,62-7,56 (m, 2H), 7,17 (q, J = 0,9 Hz, 1H), 6,98 (dd, J = 9,2; 2,1 Hz, 1H), 3,37 (q, J = 7,3 Hz, 2H), 3,12 (s, 3H), 1,29 (t, J = 7,3 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 300,9 [M+1].
3	dietil((2-(piridin-3-il)-2H-indazol-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,26 (d, J = 2,8 Hz, 1H), 8,91 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 8,60 (dd, J = 4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,41 (dq, J = 8,4; 1,3 Hz, 1H), 7,61 (ddd, J = 8,3; 4,7; 0,7 Hz, 1H), 7,56 (dt, J = 9,2; 0,9 Hz, 1H), 7,17 (q, J = 0,9 Hz, 1H), 7,00 (dd, J = 9,2; 2,1 Hz, 1H),

		3,34 (s, 2H), 3,29 (d, J = 7,3 Hz, 2H), 1,26 (t, J = 7,3 Hz, 6H); ESI MS (m/z): 314,9 [M+1].
4	1-óxido de 1-((2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)tetrahidro-1 <i>H</i> -λ ⁶ -tiofeno	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,27 (d, J = 2,8 Hz, 1H), 8,94 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 8,60 (dd, J = 4,6; 1,5 Hz, 1H), 8,41 (dq, J = 8,3; 1,4 Hz, 1H), 7,62-7,58 (m, 2H), 7,11 (q, J = 0,9 Hz, 1H), 6,98 (dd, J = 9,2; 2,1 Hz, 1H), 3,41-3,35 (m, 2H), 3,27-3,20 (m, 2H), 2,26-2,18 (m, 2H), 2,14-2,07 (m, 2H) ESI MS (m/z): 312,9 [M+1].
5	etil((2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)(metil)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,20 (d, J = 1,2 Hz, 1H), 8,96 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 8,63 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,42 (dt, J = 10,1; 2,3 Hz, 1H), 7,57 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 7,15 (t, J = 0,9 Hz, 1H), 7,00 (dd, J = 9,2; 1,8 Hz, 1H), 3,37 (q, J = 7,3 Hz, 2H),

		3,13 (s, 3H), 1,29 (t, J = 7,3 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 318,9 [M+1].
6	dietil((2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,19 (d, J = 1,5 Hz, 1H), 8,95 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 8,63 (d, J = 2,8 Hz, 1H), 8,41 (dt, J = 10,2; 2,4 Hz, 1H), 7,56 (dd, J = 9,2; 0,9 Hz, 1H), 7,16 (q, J = 0,9 Hz, 1H), 7,02 (dd, J = 9,2; 2,1 Hz, 1H), 3,33 (d, J = 7,3 Hz, 2H), 3,30 (d, J = 7,6 Hz, 2H), 1,25 (t, J = 7,5 Hz, 6H) ESI MS (m/z): 332,85 [M+1].
7	1-óxido de 1-((2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)tetrahidro-1 <i>H</i> -λ ⁶ -tiofeno	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,20 (t, J = 1,4 Hz, 1H), 8,98 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 8,63 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,42 (dt, J = 10,1; 2,3 Hz, 1H), 7,59 (dd, J = 9,2; 0,9 Hz, 1H), 7,09 (q, J = 1,0 Hz, 1H), 7,00 (dd, J = 9,2; 2,1 Hz, 1H), 3,42-3,35 (m, 2H), 3,28-3,21 (m, 2H), 2,28-

		2,18 (m, 2H), 2,14-2,05 (m, 2H) ESI MS (m/z): 330,85 [M+1].
8	((2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)dimetil-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,20 (d, J = 1,5 Hz, 1H), 8,97 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 8,63 (d, J = 2,0 Hz, 1H), 8,42 (dt, J = 10,1, 2,3 Hz, 1H), 7,57 (dt, J = 9,2; 0,9 Hz, 1H), 7,14 (q, J = 0,9 Hz, 1H), 6,98 (dd, J = 9,2; 2,1 Hz, 1H), 3,22 (d, J = 7,3 Hz, 6H); ESI MS (m/z): 304,85 [M+1].
9	dimetil((2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,48 (s, 2H), 9,21 (s, 1H), 8,99 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 7,59 (dt, J = 9,2; 0,9 Hz, 1H), 7,16 (q, J = 0,9 Hz, 1H), 6,99 (dd, J = 9,2; 2,1 Hz, 1H), 3,24 (s, 6H); ESI MS (m/z): 287,85 [M+1].
10	etil(metil)((2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,47 (s, 2H), 9,21 (s, 1H), 8,98 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 7,59

		(d, J = 9,2 Hz, 1H), 7,17 (q, J = 0,9 Hz, 1H), 7,01 (dd, J = 9,2; 2,1 Hz, 1H), 3,38 (q, J = 7,3 Hz, 2H), 3,13 (s, 3H), 1,29 (t, J = 7,3 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 301,9 [M+1].
11	dietil((2-(pirimidin-5-il)-2H-indazol-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,47 (s, 2H), 9,21 (s, 1H), 8,97 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 7,58 (dt, J = 9,2; 0,9 Hz, 1H), 7,17 (q, J = 0,9 Hz, 1H), 7,03 (dd, J = 9,2; 1,8 Hz, 1H), 3,35-3,29 (m, 4H), 1,26 (t, J = 7,3 Hz, 6H); ESI MS (m/z): 315,9 [M+1].
12	1-óxido de 1-((2-(pirimidin-5-il)-2H-indazol-5-il)imino)tetrahidro-1H-λ ⁶ -tiofeno	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,48 (s, 2H), 9,21 (s, 1H), 9,00 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 7,61 (dt, J = 9,2; 0,9 Hz, 1H), 7,10 (q, J = 0,9 Hz, 1H), 7,01 (dd, J = 9,2; 2,1 Hz, 1H), 3,42-3,35 (m, 2H), 3,28-3,22 (m, 2H), 2,26-2,08 (m, 4H); ESI MS (m/z): 313,85 [M+1].

13	bencil((2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)(metil)- λ^6 -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,18 (s, 1H), 8,90 (s, 1H), 8,59 (d, <i>J</i> = 2,4 Hz, 1H), 8,36 (dt, <i>J</i> = 9,9; 2,3 Hz, 1H), 7,56 (d, <i>J</i> = 9,2 Hz, 1H), 7,46-7,44 (m, 2H), 7,39-7,36 (m, 3H), 7,19 (d, <i>J</i> = 1,5 Hz, 1H), 7,00 (dd, <i>J</i> = 9,3; 2,0 Hz, 1H), 4,74 (d, <i>J</i> = 13,8 Hz, 1H), 4,66 (d, <i>J</i> = 14,1 Hz, 1H), 3,08 (s, 3H) ESI MS (<i>m/z</i>): 380 [M+1].
14	((2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)(metil)(fenil)- λ^6 -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,13 (d, <i>J</i> = 1,2 Hz, 1H), 8,88 (d, <i>J</i> = 1,0 Hz, 1H), 8,61-8,60 (m, 1H), 8,35 (dt, <i>J</i> = 10,2; 2,3 Hz, 1H), 7,98-7,95 (m, 2H), 7,67-7,58 (m, 3H), 7,52 (dt, <i>J</i> = 9,2; 0,9 Hz, 1H), 7,04 (dd, <i>J</i> = 9,2; 2,1 Hz, 1H), 6,97 (q, <i>J</i> = 0,9 Hz, 1H), 3,41 (s, 3H); ESI MS (<i>m/z</i>): 367 [M+1].

15	(4-fluorofenil)((2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)(isopropil)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,13 (d, J = 1,5 Hz, 1H), 8,88 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 8,61 (d, J = 2,2 Hz, 1H), 8,35 (dt, J = 10,0; 2,3 Hz, 1H), 7,93-7,84 (m, 2H), 7,53 (dt, J = 9,1; 0,9 Hz, 1H), 7,48-7,42 (m, 2H), 7,08-7,04 (m, 1H), 6,97 (q, J = 0,9 Hz, 1H), 3,70-3,59 (m, 1H), 1,33 (dd, J = 14,4; 6,6 Hz, 3H), 1,18 (dd, J = 15,2; 6,8 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 413,05 [M+1].
16	bencil(metil)((2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,48 (s, 2H), 9,21 (s, 1H), 9,00 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 7,60 (d, J = 9,0 Hz, 1H), 7,43-7,36 (m, 5H), 7,22 (q, J = 0,9 Hz, 1H), 6,98 (dd, J = 9,3; 2,0 Hz, 1H), 4,79 (d, J = 13,7 Hz, 1H), 4,70 (d, J = 13,7 Hz, 1H), 3,03 (s, 3H); ESI MS (m/z): 364 [M+1].

17	metil(fenil)((2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)- λ^6 -sulfanona	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, $\text{DMSO-}d_6$) δ 9,41 (s, 2H), 9,19 (s, 1H), 8,90 (d, $J = 1,0$ Hz, 1H), 7,97-7,95 (m, 2H), 7,67-7,58 (m, 3H), 7,54 (dt, $J = 9,2$; 0,9 Hz, 1H), 7,05 (dd, $J = 9,2$; 2,1 Hz, 1H), 6,98 (q, $J = 1,0$ Hz, 1H), 3,42 (s, 3H); ESI MS (m/z): 350 [$M+1$].
18	(4-fluorofenil)(isopropil)((2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)- λ^6 -sulfanona	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, $\text{DMSO-}d_6$) δ 9,41 (s, 2H), 9,19 (s, 1H), 8,89 (d, $J = 0,7$ Hz, 1H), 7,92-7,89 (m, 2H), 7,55 (d, $J = 9,3$ Hz, 1H), 7,45 (t, $J = 8,8$ Hz, 2H), 7,12-7,06 (m, 1H), 6,98-6,96 (m, 1H), 3,70-3,60 (m, 1H), 1,36-1,32 (m, 3H), 1,20 (d, $J = 6,8$ Hz, 3H); ESI MS (m/z): 396,05 [$M+1$].
19	<i>tert</i> -butil(metil)((2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)- λ^6 -sulfanona	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, $\text{DMSO-}d_6$) δ 9,47 (s, 2H), 9,21 (s, 1H), 8,99 (d, $J = 0,7$ Hz, 1H), 7,58 (dt, $J = 9,2$; 0,9 Hz, 1H), 7,18 (q, $J = 0,9$ Hz, 1H),

		7,04 (dd, J = 9,3; 2,0 Hz, 1H), 3,01 (s, 3H), 1,44 (s, 9H); ESI MS (m/z): 330 [M+1].
20	bencil(metil)((2-(piridin-3-il)-2H-indazol-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,27 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,94 (d, J = 0,6 Hz, 1H), 8,60 (dd, J = 4,6; 1,5 Hz, 1H), 8,42 (dq, J = 8,3; 1,4 Hz, 1H), 7,63-7,58 (m, 2H), 7,43-7,35 (m, 5H), 7,22 (q, J = 0,9 Hz, 1H), 6,96 (dd, J = 9,2; 1,8 Hz, 1H), 4,78 (d, J = 14,1 Hz, 1H), 4,69 (d, J = 13,8 Hz, 1H), 3,02 (s, 3H); ESI MS (m/z): 363,05 [M+1].
21	metil(fenil)((2-(piridin-3-il)-2H-indazol-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,20 (d, J = 2,1 Hz, 1H), 8,84 (d, J = 0,6 Hz, 1H), 8,58 (dd, J = 4,7; 1,4 Hz, 1H), 8,35 (dq, J = 8,3; 1,4 Hz, 1H), 7,98-7,95 (m, 2H), 7,67-7,56 (m, 4H), 7,53-7,51 (m, 1H), 7,02 (dd, J = 9,2; 1,8 Hz, 1H), 6,99 (q,

		J = 1,0 Hz, 1H), 3,41 (s, 3H); ESI MS (m/z): 349,05 [M+1].
22	(3-fluorofenil)(metil)((2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,21 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,87 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 8,58 (dd, J = 4,7; 1,4 Hz, 1H), 8,35 (dq, J = 8,5; 1,4 Hz, 1H), 7,82-7,77 (m, 2H), 7,67 (td, J = 8,0; 5,6 Hz, 1H), 7,60-7,50 (m, 3H), 7,05-7,01 (m, 2H), 3,47 (s, 3H); ESI MS (m/z): 367,05 [M+1].
23	metil((2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)(p-tolil)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,20 (d, J = 2,1 Hz, 1H), 8,84 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 8,58 (dd, J = 4,6; 1,5 Hz, 1H), 8,35 (dq, J = 8,3; 1,4 Hz, 1H), 7,83 (d, J = 8,6 Hz, 2H), 7,59-7,56 (m, 1H), 7,52 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 7,41-7,35 (m, 2H), 7,32-7,09 (m, 1H), 7,05-7,00 (m, 1H), 6,97 (q, J = 0,9 Hz, 1H), 3,37 (s, 3H), 2,36

		(d, J = 17,1 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 363,05 [M+1].
24	etil(fenil)((2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,20 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,84 (s, 1H), 8,57 (d, J = 3,7 Hz, 1H), 8,35 (d, J = 8,3 Hz, 1H), 7,90 (d, J = 7,0 Hz, 2H), 7,68-7,51 (m, 5H), 7,05 (dd, J = 9,2; 1,8 Hz, 1H), 7,00 (s, 1H), 3,56-3,46 (m, 2H), 1,17 (t, J = 7,3 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 363,05 [M+1].
25	<i>tert</i> -butil(metil)((2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,27 (d, J = 2,2 Hz, 1H), 8,92 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 8,60 (dd, J = 4,6; 1,5 Hz, 1H), 8,41 (dq, J = 8,3; 1,4 Hz, 1H), 7,61 (ddd, J = 8,3; 4,6; 0,7 Hz, 1H), 7,56 (dt, J = 9,1; 0,9 Hz, 1H), 7,18 (q, J = 0,9 Hz, 1H), 7,01 (dd, J = 9,0; 2,0 Hz, 1H), 3,00 (s, 3H), 1,44 (s, 9H) ESI MS (m/z): 363,05 [M+1].

26	(4-clorofenil)(metil)((2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,21 (d, J = 2,2 Hz, 1H), 8,85 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 8,58 (dd, J = 4,8; 1,3 Hz, 1H), 8,35 (dq, J = 8,4; 1,3 Hz, 1H), 7,96 (dt, J = 9,1; 2,2 Hz, 2H), 7,68 (dt, J = 9,1; 2,3 Hz, 2H), 7,60-7,52 (m, 2H), 7,03-6,98 (m, 2H), 3,44 (s, 3H); ESI MS (m/z): 382,95 [M+1].
27	metil(pentil)((2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,27 (d, J = 2,2 Hz, 1H), 8,92 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 8,60 (dd, J = 4,8; 1,3 Hz, 1H), 8,41 (dq, J = 8,3; 1,4 Hz, 1H), 7,61 (ddd, J = 8,3; 4,8; 0,6 Hz, 1H), 7,57 (dt, J = 9,2; 0,9 Hz, 1H), 7,16 (q, J = 1,0 Hz, 1H), 6,97 (dd, J = 9,2; 2,1 Hz, 1H), 3,34 (dd, J = 9,9; 6,0 Hz, 2H), 3,13 (s, 3H), 1,80-1,72 (m, 2H), 1,39-1,24 (m, 4H), 0,85 (t, J = 7,2 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 342,6 [M+1].

28	diisopropil((2-(piridina-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,26-9,20 (m, 1H), 8,89 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 8,59 (dd, J = 4,8, 1,3 Hz, 1H), 8,40 (dq, J = 8,3, 1,4 Hz, 1H), 7,60 (ddd, J = 8,3, 4,6, 0,7 Hz, 1H), 7,54-7,52 (m, 1H), 7,20 (q, J = 0,9 Hz, 1H), 7,09 (dd, J = 9,2, 2,1 Hz, 1H), 3,66-3,55 (m, 2H), 1,34 (d, J = 6,6 Hz, 6H), 1,27 (d, J = 6,8 Hz, 6H); ESI MS (m/z): 342,55 [M+1].
29	etil(isopropil)((2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,26 (d, J = 2,2 Hz, 1H), 8,90 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 8,60 (dd, J = 4,6, 1,5 Hz, 1H), 8,40 (dq, J = 8,4, 1,3 Hz, 1H), 7,60 (ddd, J = 8,4, 4,8, 0,7 Hz, 1H), 7,57-7,54 (m, 1H), 7,18 (q, J = 1,0 Hz, 1H), 7,03 (dd, J = 9,0, 2,0 Hz, 1H), 3,57-3,50 (m, 1H), 3,27 (t, J = 7,3 Hz, 2H), 1,37 (d, J = 6,8 Hz, 3H), 1,30

		(d, J = 6,8 Hz, 3H), 1,24 (t, J = 7,5 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 328,55 [M+1].
30	metil(piridina-3-il)((2-(piridina-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,21 (d, J = 2,2 Hz, 1H), 9,09 (dd, J = 2,3, 0,6 Hz, 1H), 8,87 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 8,80 (dd, J = 4,9, 1,5 Hz, 1H), 8,58 (dd, J = 4,6, 1,5 Hz, 1H), 8,34 (tdd, J = 8,1, 2,5, 1,6 Hz, 2H), 7,64 (ddd, J = 8,1, 4,8, 0,9 Hz, 1H), 7,60-7,53 (m, 2H), 7,05-7,02 (m, 2H), 3,53 (s, 3H) ESI MS (m/z): 349,6 [M+1].
31	diisopropil((2-(pirimidina-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,46 (s, 2H), 9,20 (s, 1H), 8,95 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 7,56-7,54 (m, 1H), 7,56-7,10 (m, 2H), 7,20 (q, J = 0,9 Hz, 1H), 7,11 (dd, J = 9,3, 2,0 Hz, 1H), 3,65-3,58 (m, 2H), 1,30 (dd, J = 27,0, 6,7 Hz,

		12H); ESI MS (m/z): 343,65 [M+1].
32	etil(isopropil)((2-(pirimidina-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,47 (s, 2H), 9,21 (t, J = 4,8 Hz, 1H), 8,97 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 7,59-7,56 (m, 1H), 7,18 (q, J = 0,9 Hz, 1H), 7,05 (dd, J = 9,2, 2,1 Hz, 1H), 3,58-3,51 (m, 1H), 3,28 (t, J = 7,3 Hz, 2H), 1,37 (d, J = 6,8 Hz, 3H), 1,30 (d, J = 6,8 Hz, 3H), 1,24 (t, J = 7,3 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 329,6 [M+1].
33	metil(pentil)((2-(pirimidina-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,47 (s, 2H), 9,21 (s, 1H), 8,99 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 7,59 (dt, J = 9,2, 0,9 Hz, 1H), 7,16 (q, J = 1,0 Hz, 1H), 7,00 (dd, J = 9,0, 2,0 Hz, 1H), 3,36 (dd, J = 10,0, 6,1 Hz, 2H), 3,15 (s, 3H), 1,80-1,72 (m, 2H), 1,38-1,26 (m, 4H), 0,84 (t, J = 7,1 Hz,

		3H); ESI MS (m/z): 343,6 [M+1].
34	etil(fenil)((2-(pirimidina-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,40 (s, 2H), 9,19 (s, 1H), 8,90 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 7,92-7,89 (m, 2H), 7,69-7,59 (m, 3H), 7,55 (dt, J = 9,2, 0,9 Hz, 1H), 7,07 (dd, J = 9,3, 2,0 Hz, 1H), 6,99 (q, J = 0,9 Hz, 1H), 3,57-3,47 (m, 2H), 1,17 (t, J = 7,3 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 363,6 [M+1].
35	metil((2-(pirimidina-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)(p-tolil)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,41 (s, 2H), 9,19 (s, 1H), 8,90 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 7,83 (d, J = 8,3 Hz, 2H), 7,55-7,52 (m, 1H), 7,40 (d, J = 8,1 Hz, 2H), 7,03 (dd, J = 9,3, 2,0 Hz, 1H), 6,96 (q, J = 0,9 Hz, 1H), 3,38 (s, 3H), 2,34 (s, 3H); ESI MS (m/z): 363,6 [M+1].

36	(3-fluorofenil)(metil)((2-(pirimidina-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,41 (s, 2H), 9,19 (s, 1H), 8,93 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 7,82-7,77 (m, 2H), 7,69-7,64 (m, 1H), 7,57-7,52 (m, 2H), 7,06-7,00 (m, 2H), 3,48 (s, 3H) ESI MS (m/z): 367,6 [M+1].
37	(4-clorofenil)(metil)((2-(pirimidina-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,41 (s, 2H), 9,19 (s, 1H), 8,92 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 7,96 (dt, J = 9,1, 2,3 Hz, 2H), 7,69 (dt, J = 9,1, 2,3 Hz, 2H), 7,57-7,54 (m, 1H), 7,03 (dd, J = 9,3, 2,0 Hz, 1H), 6,98 (q, J = 0,9 Hz, 1H), 3,45 (s, 3H); ESI MS (m/z): 383,7 [M+1].
38	(4-fluorofenil)(isopropil)((2-(piridina-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,20 (d, J = 2,2 Hz, 1H), 8,84 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 8,58 (dd, J = 4,6, 1,5 Hz, 1H), 8,35 (dq, J = 8,5, 1,3 Hz, 1H), 7,93-7,88

		(m, 2H), 7,57 (ddd, J = 8,3, 4,6, 0,7 Hz, 1H), 7,54-7,52 (m, 1H), 7,48-7,42 (m, 2H), 7,06 (dd, J = 9,0, 2,0 Hz, 1H), 6,99 (q, J = 0,9 Hz, 1H), 3,67-3,60 (m, 1H), 1,35 (d, J = 6,8 Hz, 3H), 1,19 (d, J = 6,6 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 395,25 [M+1].
39	metil(piridin-3-il)((2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,43 (s, 2H), 9,21 (s, 1H), 9,10 (d, J = 1,7 Hz, 1H), 8,94 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 8,82 (dd, J = 4,9, 1,5 Hz, 1H), 8,35 (dt, J = 8,1, 2,0 Hz, 1H), 7,66 (dd, J = 7,7, 4,5 Hz, 1H), 7,58 (d, J = 9,3 Hz, 1H), 7,09-7,05 (m, 2H), 3,55 (s, 3H); ESI MS (m/z): 351,05 [M+1].
40	((2-(5-fluoropiridina-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)(metil)(piridina-3-il)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,13 (d, J = 1,2 Hz, 1H), 9,09 (dd, J = 2,4, 0,7 Hz, 1H), 8,90 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 8,80 (dd, J = 4,8,

		1,6 Hz, 1H), 8,61 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,37-8,32 (m, 2H), 7,64 (ddd, J = 8,1, 4,8, 0,9 Hz, 1H), 7,56-7,53 (m, 1H), 7,06-7,01 (m, 2H), 3,53 (s, 3H); ESI MS (m/z): 368,10 [M+1].
41	etil((2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)(isopropil)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,19 (s, 1H), 8,95 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 8,63 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,41 (dt, J = 10,0, 2,3 Hz, 1H), 7,55 (d, J = 9,0 Hz, 1H), 7,16 (q, J = 0,9 Hz, 1H), 7,04 (dd, J = 9,0, 2,0 Hz, 1H), 3,54 (td, J = 13,7, 6,8 Hz, 1H), 3,28 (t, J = 7,3 Hz, 2H), 1,37 (dd, J = 15,2, 8,3 Hz, 3H), 1,32-1,28 (m, 3H), 1,26-1,19 (m, 3H); ESI MS (m/z): 347,10 [M+1].
42	((2-(5-fluoropiridina-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)(metil)(pentil)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,20 (d, J = 1,2 Hz, 1H), 8,96 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 8,63 (d, J = 2,9 Hz, 1H), 8,42 (dt,

		J = 10,0, 2,3 Hz, 1H), 7,57 (dt, J = 9,1, 0,9 Hz, 1H), 7,14 (q, J = 0,9 Hz, 1H), 6,99 (dd, J = 9,2, 2,1 Hz, 1H), 3,35 (dd, J = 9,8, 6,1 Hz, 2H), 3,14 (s, 3H), 1,80-1,72 (m, 2H), 1,38-1,26 (m, 4H), 0,84 (t, J = 7,1 Hz, 3H);ESI MS (m/z): 361,10 [M+1].
43	dietil((2-(piridazina-4-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,99 (q, J = 1,2 Hz, 1H), 9,36 (dd, J = 5,9, 1,0 Hz, 1H), 9,11 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 8,26 (q, J = 2,9 Hz, 1H), 7,58 (d, J = 9,3 Hz, 1H), 7,14 (q, J = 0,9 Hz, 1H), 7,04 (dd, J = 9,2, 2,1 Hz, 1H), 3,35 (d, J = 7,3 Hz, 3H), 3,30 (s, 1H), 1,25 (q, J = 7,5 Hz, 6H);ESI MS (m/z): 316,05 [M+1].
44	bencil(metil)((2-(piridazina-4-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 10,00 (dd, J = 2,9, 1,0 Hz, 1H), 9,36 (dd, J = 5,7,

		0,9 Hz, 1H), 9,13 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 8,27 (q, J = 2,9 Hz, 1H), 7,60 (d, J = 9,3 Hz, 1H), 7,43-7,36 (m, 5H), 7,18 (q, J = 0,9 Hz, 1H), 6,99 (dd, J = 9,2, 2,1 Hz, 1H), 4,80 (d, J = 13,7 Hz, 1H), 4,72 (d, J = 13,7 Hz, 1H), 3,04 (s, 3H); ESI MS (m/z): 364,10 [M+1].
45	metil(fenil)((2-(piridazina-4-il)-2H-indazol-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,92 (dd, J = 2,9, 1,0 Hz, 1H), 9,33 (dd, J = 5,9, 1,0 Hz, 1H), 9,04 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 8,20 (q, J = 2,9 Hz, 1H), 7,96 (dt, J = 6,6, 1,7 Hz, 2H), 7,68-7,59 (m, 3H), 7,54 (d, J = 9,3 Hz, 1H), 7,06 (dd, J = 9,3, 2,0 Hz, 1H), 6,94 (q, J = 0,9 Hz, 1H), 3,43 (s, 3H); ESI MS (m/z): 350,15 [M+1].
46	(4-fluorofenil)(isopropil)((2-(piridazina-4-il)-2H-indazol-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,92 (dd, J = 2,9, 1,0 Hz, 1H),

		9,33 (dd, J = 5,9, 1,0 Hz, 1H), 9,03 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 8,20 (q, J = 2,9 Hz, 1H), 7,92-7,87 (m, 2H), 7,55 (d, J = 9,3 Hz, 1H), 7,48-7,41 (m, 2H), 7,10 (dd, J = 9,2, 2,1 Hz, 1H), 6,94 (q, J = 0,9 Hz, 1H), 3,69-3,63 (m, 1H), 1,36-1,32 (m, 3H), 1,21-1,17 (m, 3H); ESI MS (m/z): 396,20 [M+1].
47	metil(pentil)((2-(piridazina-4-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,99 (q, J = 1,2 Hz, 1H), 9,36 (dd, J = 5,9, 1,0 Hz, 1H), 9,11 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 8,27 (q, J = 2,9 Hz, 1H), 7,60-7,57 (m, 1H), 7,13 (q, J = 1,0 Hz, 1H), 7,01 (dd, J = 9,3, 2,0 Hz, 1H), 3,37 (dd, J = 10,1, 5,7 Hz, 2H), 3,16 (s, 3H), 1,79-1,72 (m, 2H), 1,38-1,26 (m, 4H), 0,84 (t, J = 7,1 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 344,20 [M+1].

48	etil(isopropil)((2-(piridazina-4-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)- λ^6 -sulfanona	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, $\text{DMSO-}d_6$) δ 9,99 (dd, $J = 2,9, 1,0$ Hz, 1H), 9,36 (dd, $J = 5,9, 1,0$ Hz, 1H), 9,10 (d, $J = 1,0$ Hz, 1H), 8,26 (q, $J = 2,9$ Hz, 1H), 7,57 (d, $J = 9,3$ Hz, 1H), 7,15 (q, $J = 1,0$ Hz, 1H), 7,07 (dd, $J = 9,3, 2,0$ Hz, 1H), 3,59-3,52 (m, 1H), 3,33-3,29 (m, 2H), 1,37 (d, $J = 6,8$ Hz, 3H), 1,30 (d, $J = 6,8$ Hz, 3H), 1,24 (t, $J = 7,3$ Hz, 3H); ESI MS (m/z): 330,20 [M+1].
49	metil((2-(piridazina-4-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)(piridina-3-il)- λ^6 -sulfanona	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, $\text{DMSO-}d_6$) δ 9,93 (dd, $J = 2,9, 1,0$ Hz, 1H), 9,34 (dd, $J = 5,9, 1,0$ Hz, 1H), 9,09 (dd, $J = 2,3, 0,6$ Hz, 1H), 9,06 (d, $J = 1,0$ Hz, 1H), 8,81 (dd, $J = 4,8, 1,6$ Hz, 1H), 8,34 (ddd, $J = 8,1, 2,3, 1,6$ Hz, 1H), 8,21 (q, $J = 2,9$ Hz, 1H), 7,65 (ddd, $J = 8,1, 4,9, 0,7$ Hz, 1H), 7,57 (d,

		J = 9,0 Hz, 1H), 7,07 (dd, J = 9,3, 2,0 Hz, 1H), 6,99 (q, J = 0,9 Hz, 1H), 3,54 (s, 3H); ESI MS (m/z): 351,10 [M+1].
50	(4-clorofenil)(metil)((2-(piridazina-4-il)-2H-indazol-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,93 (dd, J = 2,9, 1,0 Hz, 1H), 9,34 (dd, J = 5,9, 1,0 Hz, 1H), 9,05 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 8,21 (q, J = 2,9 Hz, 1H), 7,96 (dt, J = 9,0, 2,3 Hz, 2H), 7,69 (dt, J = 9,0, 2,3 Hz, 2H), 7,55 (d, J = 9,3 Hz, 1H), 7,05 (dd, J = 9,3, 2,0 Hz, 1H), 6,94 (q, J = 0,9 Hz, 1H), 3,46 (s, 3H) ESI MS (m/z): 384,15 [M+1].
51	((2-(5-fluoropiridina-3-il)-2H-indazol-5-il)imino)(metil)(p-tolil)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,13 (d, J = 1,5 Hz, 1H), 8,88 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 8,61 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,35 (dt, J = 10,1, 2,3 Hz, 1H), 7,83 (dd, J = 6,6, 1,7 Hz, 2H), 7,52 (dt,

		J = 9,2, 0,9 Hz, 1H), 7,40 (d, J = 7,9 Hz, 2H), 7,03 (dd, J = 9,2, 2,1 Hz, 1H), 6,95 (q, J = 1,0 Hz, 1H), 3,38 (s, 3H), 2,34 (s, 3H); ESI MS (m/z): 380,9 [M+1].
52	metil((2-(piridazina-4-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)(p-tolil)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,93 (dd, J = 2,9, 1,0 Hz, 1H), 9,33 (dd, J = 5,9, 1,0 Hz, 1H), 9,03 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 8,20 (q, J = 2,9 Hz, 1H), 7,83 (d, J = 8,3 Hz, 2H), 7,54 (d, J = 9,3 Hz, 1H), 7,40 (d, J = 7,8 Hz, 2H), 7,05 (dd, J = 9,3, 2,0 Hz, 1H), 6,92 (q, J = 0,9 Hz, 1H), 3,39 (s, 3H), 2,34 (s, 3H) ESI MS (m/z): 364,3 [M+1].
53	etil((2-(5-fluoropiridina-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)(fenil)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,12 (s, 1H), 8,88 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 8,61 (d, J = 2,2 Hz, 1H), 8,35 (dt, J = 10,2, 2,3 Hz, 1H), 7,92-7,89 (m, 2H), 7,68-7,59 (m,

		3H), 7,53 (d, J = 9,3 Hz, 1H), 7,06 (dd, J = 9,2, 2,1 Hz, 1H), 6,97 (q, J = 0,9 Hz, 1H), 3,56-3,47 (m, 2H), 1,19-1,15 (m, 3H); ESI MS (m/z): 380,9 [M+1].
54	etil(metil)((2-(piridazina-4-il)-2H-indazol-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 10,00 (q, J = 1,2 Hz, 1H), 9,36 (dd, J = 5,9, 1,0 Hz, 1H), 9,11 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 8,27 (q, J = 2,9 Hz, 1H), 7,59 (d, J = 9,0 Hz, 1H), 7,14 (q, J = 1,0 Hz, 1H), 7,02 (dd, J = 9,3, 2,0 Hz, 1H), 3,39 (q, J = 7,4 Hz, 2H), 3,14 (s, 3H), 1,29 (t, J = 7,5 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 301,9 [M+1].
55	(4-clorofenil)((2-(5-fluoropiridina-3-il)-2H-indazol-5-il)imino)(metil)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,13 (s, 1H), 8,90 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 8,61 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,36 (dt, J = 10,0, 2,3 Hz, 1H), 7,96 (dt, J = 9,0, 2,3 Hz, 2H), 7,69 (dt, J = 9,1, 2,2 Hz,

		2H), 7,54 (d, J = 9,0 Hz, 1H), 7,02 (dd, J = 9,2, 2,0 Hz, 1H), 6,96 (q, J = 0,9 Hz, 1H), 3,45 (s, 3H); ESI MS (m/z): 400,9 [M+1].
56	1-óxido de 1-((2-(piridazina-4-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)tetrahidro-1 <i>H</i> -λ ⁶ -tiofeno	¹ H-NMR (400 MHz, CLOROFORMO-D) δ 9,85 (d, J = 2,2 Hz, 1H), 9,30 (t, J = 5,9 Hz, 1H), 8,38 (s, 1H), 8,03-8,00 (m, 1H), 7,63 (d, J = 9,0 Hz, 1H), 7,24 (s, 1H), 7,14 (dd, J = 9,3, 2,0 Hz, 1H), 3,53-3,46 (m, 2H), 3,26-3,19 (m, 2H), 2,39-2,29 (m, 5H), 1,33-1,25 (m, 3H); ESI MS (m/z): 313,9 [M+1].
57	(3-fluorofenil)(metil)((2-(piridazina-4-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, CLOROFORMO-D) δ 9,78 (q, J = 1,2 Hz, 1H), 9,26 (dd, J = 5,9, 1,0 Hz, 1H), 8,29 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 7,93 (q, J = 2,9 Hz, 1H), 7,78 (dq, J = 7,8, 0,9 Hz, 1H), 7,72-7,69 (m, 1H), 7,59-7,50 (m, 2H), 7,29 (tdd,

		J = 8,3, 2,5, 0,9 Hz, 1H), 7,16 (dd, J = 9,3, 2,0 Hz, 1H), 7,12 (q, J = 0,9 Hz, 1H), 3,30 (s, 3H); ESI MS (m/z): 368 [M+1].
58	(3-fluorofenil)((2-(5-fluoropiridina-3-il)-2H-indazol-5-il)imino)(metil)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, CLOROFORMO-D) δ 8,92-8,19 (m, 2H), 8,91 (d, J = 1,5 Hz, 1H), 8,46 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,20 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 8,02 (dt, J = 9,4, 2,4 Hz, 1H), 7,79 (dq, J = 7,8, 0,9 Hz, 1H), 7,72 (dt, J = 7,8, 2,1 Hz, 1H), 7,59 (dt, J = 9,0, 1,0 Hz, 1H), 7,52 (td, J = 8,1, 5,1 Hz, 1H), 7,31-7,27 (m, 1H), 7,17-7,14 (m, 2H), 3,30 (s, 3H); ESI MS (m/z): 384,9 [M+1].
59	fenil((2-(piridina-3-il)-2H-indazol-5-il)imino)(3,3,3-trifluoropropil)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, CLOROFORMO-D) δ 9,09 (d, J = 2,2 Hz, 1H), 8,60 (dd, J = 4,6, 1,5 Hz, 1H), 8,21-8,18 (m, 2H), 7,98-7,96 (m, 2H), 7,66-7,55 (m, 4H),

		7,46-7,42 (m, 1H), 7,18-7,14 (m, 2H), 3,61-3,55 (m, 1H), 3,49-3,41 (m, 1H), 2,78-2,64 (m, 2H); ESI MS (m/z): 431 [M+1].
60	(4-metoxifenil)((2-(piridina-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)(3,3,3-trifluoropropil)- λ^6 -sulfanona	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, $\text{ClO}_2\text{FORMO-D}$) δ 9,09 (d, $J = 2,2$ Hz, 1H), 8,60 (dd, $J = 4,6, 1,5$ Hz, 1H), 8,19 (ddd, $J = 8,6, 2,9, 1,3$ Hz, 2H), 8,00 (dd, $J = 7,8, 1,7$ Hz, 1H), 7,57-7,52 (m, 2H), 7,43 (ddd, $J = 8,3, 4,9, 0,7$ Hz, 1H), 7,15 (q, $J = 0,9$ Hz, 1H), 7,09-7,05 (m, 2H), 7,01-6,99 (m, 1H), 3,96 (s, 3H), 3,89-3,72 (m, 2H), 2,86-2,75 (m, 1H), 2,62-2,51 (m, 1H) ESI MS (m/z): 461 [M+1].
61	(4-fluorofenil)((2-(piridina-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)(3,3,3-trifluoropropil)- λ^6 -sulfanona	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, $\text{DMSO-}d_6$) δ 9,21 (d, $J = 2,4$ Hz, 1H), 8,88 (d, $J = 0,7$ Hz, 1H), 8,59 (dd, $J = 4,8, 1,3$ Hz, 1H),

		8,36 (dq, J = 8,3, 1,4 Hz, 1H), 8,06-8,02 (m, 2H), 7,60-7,55 (m, 2H), 7,50-7,44 (m, 2H), 7,08-7,04 (m, 2H), 3,90-3,76 (m, 2H), 2,82-2,72 (m, 2H); ESI MS (m/z): 449 [M+1].
62	fenil((2-(pirimidina-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)(3,3,3-trifluoropropil)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, CLOROFORMO-D) δ 9,25 (s, 2H), 9,19 (s, 1H), 8,18 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 7,98-7,95 (m, 2H), 7,67-7,55 (m, 4H), 7,19-7,15 (m, 2H), 3,63-3,41 (m, 2H), 2,83-2,61 (m, 2H); ESI MS (m/z): 432 [M+1].
63	(4-metoxifenil)((2-(pirimidina-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)(3,3,3-trifluoropropil)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, CLOROFORMO-D) δ 9,25 (s, 2H), 9,19 (s, 1H), 8,17 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 8,00 (dd, J = 8,1, 1,7 Hz, 1H), 7,57-7,52 (m, 2H), 7,13-7,06 (m, 3H), 7,01-6,99 (m, 1H), 3,96 (s, 3H), 3,89-3,71 (m, 2H), 2,82-2,77 (m, 1H), 2,61-2,55 (m, 1H);

		ESI MS (m/z): 462,2 [M+1].
64	(4-fluorofenil)((2-(pirimidina-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)(3,3,3-trifluoropropil)- λ^6 -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,42 (s, 2H), 9,20 (s, 1H), 8,94 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 8,04 (dd, J = 8,9, 5,3 Hz, 2H), 7,58 (d, J = 9,0 Hz, 1H), 7,47 (t, J = 8,9 Hz, 2H), 7,09 (dd, J = 9,0, 2,0 Hz, 1H), 7,04 (d, J = 1,2 Hz, 1H), 3,88-3,81 (m, 2H), 2,81-2,73 (m, 2H); ESI MS (m/z): 450 [M+1].
65	((2-(5-fluoropiridina-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)(fenil)(3,3,3-trifluoropropil)- λ^6 -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, CLOROFORMO-D) δ 8,91 (d, J = 1,7 Hz, 1H), 8,46 (d, J = 2,2 Hz, 1H), 8,18 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 8,03-7,95 (m, 3H), 7,66-7,55 (m, 4H), 7,16 (dd, J = 8,8, 2,0 Hz, 2H), 3,62-3,41 (m, 2H), 2,82-2,60 (m, 2H); ESI MS (m/z): 449 [M+1].
66	((2-(5-fluoropiridina-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)(4-	¹ H-NMR (400 MHz, CLOROFORMO-D) δ 8,91 (d, J = 1,5 Hz, 1H),

	metoxifenil)(3,3,3-trifluoropropil)- λ^6 -sulfanona	8,46 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,18 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 8,03-7,99 (m, 2H), 7,57-7,52 (m, 2H), 7,12 (q, J = 0,9 Hz, 1H), 7,09-7,05 (m, 2H), 7,00 (d, J = 8,3 Hz, 1H), 3,95 (d, J = 10,5 Hz, 3H), 3,89-3,71 (m, 2H), 2,82-2,52 (m, 2H); ESI MS (m/z): 478,9 [M+1].
67	(4-fluorofenil)((2-(5-fluoropiridina-3-il)-2H-indazol-5-il)imino)(3,3,3-trifluoropropil)- λ^6 -sulfanona	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CLOROFORMO-D) δ 8,91 (t, J = 0,8 Hz, 1H), 8,47 (d, J = 2,2 Hz, 1H), 8,19 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 8,04-7,95 (m, 3H), 7,61-7,59 (m, 1H), 7,26-7,21 (m, 2H), 7,15-7,12 (m, 2H), 3,63-3,55 (m, 1H), 3,48-3,40 (m, 1H), 2,83-2,61 (m, 2H) ESI MS (m/z): 466,9 [M+1].
68	fenil((2-(piridazin-4-il)-2H-indazol-5-il)imino)(3,3,3-trifluoropropil)- λ^6 -sulfanona	$^1\text{H-NMR}$ (400 Mhz; CLOROFORMO-D) δ 9,77 (dd, J = 2,9; 1,0 Hz; 1H); 9,26 (dd, J = 5,9; 1,0 Hz; 1H);

		8,27 (d, J = 0,7 Hz; 1H); 7,98-7,92 (m, 3H); 7,67-7,63 (m, 1H); 7,60-7,56 (m, 3H); 7,17 (dd, J = 9,3; 2,2 Hz; 1H); 7,10 (q, J = 0,9 Hz; 1H); 3,63-3,41 (m, 2H); 2,83-2,60 (m, 2H); ESI MS (m/z): 432,2 [M+1].
69	(4-metoxifenil)((2-(piridazin-4-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)(3,3,3-trifluoropropil)- λ^6 -sulfanona	¹ H-NMR (400 Mhz; CLOROFORMO-D) δ 9,78 (q, J = 1,3 Hz; 1H); 9,26 (dd, J = 5,6; 1,0 Hz; 1H); 8,29 (d, J = 0,7 Hz; 1H); 8,00-7,93 (m, 3H); 7,59 (dt, J = 9,2; 0,9 Hz; 1H); 7,25-7,22 (m, 2H); 7,15 (dd, J = 9,3; 2,0 Hz; 1H); 7,09 (q, J = 1,0 Hz; 1H); 3,63-3,40 (m, 2H); 2,84-2,61 (m, 2H); ESI MS (m/z): 462,3 [M+1].
70	(4-fluorofenil)((2-(piridazin-4-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)(3,3,3-trifluoropropil)- λ^6 -sulfanona	¹ H-NMR (400 Mhz; CLOROFORMO-D) δ 9,78 (q, J = 1,3 Hz; 1H); 9,26 (dd, J = 5,6; 1,0 Hz; 1H); 8,29 (d, J = 0,7 Hz; 1H); 8,00-

		7,93 (m, 3H); 7,59 (dt, J = 9,2; 0,9 Hz; 1H); 7,25-7,22 (m, 2H); 7,15 (dd, J = 9,3; 2,0 Hz; 1H); 7,09 (q, J = 1,0 Hz; 1H); 3,63-3,40 (m, 2H); 2,84-2,61 (m, 2H); ESI MS(m/z): 450,3 [M+1].
71	etil(isopropil)((2-(piridin-3-il)-2H-indazol-4-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 Mhz; DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,34 (d, J = 2,4 Hz; 1H); 9,02 (s, 1H); 8,61 (dd, J = 4,8; 1,3 Hz; 1H); 8,51-8,48 (m, 1H); 7,61-7,58 (m, 1H); 7,17-7,08 (m, 2H); 6,61 (d, J = 6,4 Hz; 1H); 3,64-3,57 (m, 1H); 3,40-3,34 (m, 2H); 1,44 (d, J = 6,6 Hz; 3H); 1,36 (d, J = 6,8 Hz; 3H); 1,27 (t, J = 7,3 Hz; 3H) ESI MS (m/z): 329,3 [M+1].
72	dimetil((2-(piridazin-3-il)-2H-indazol-4-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 Mhz; DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,32 (d, J = 2,4 Hz; 1H); 8,99 (d, J = 0,7 Hz; 1H); 8,60 (dd, J = 4,8; 1,3 Hz; 1H); 8,50-8,47 (m, 1H); 7,61-

		7,58 (m, 1H); 7,20-7,12 (m, 2H); 6,58 (dd, J = 6,8; 0,7 Hz; 1H); 3,32 (s, 6H); ESI MS (m/z): 287,1 [M+1].
73	dietil((2-(piridin-3-il)-2H-indazol-4-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 Mhz; DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,33 (d, J = 2,7 Hz; 1H); 9,01 (s, 1H); 8,60 (dd, J = 4,8; 1,3 Hz; 1H); 8,51-8,48 (m, 1H); 7,61-7,58 (m, 1H); 7,18-7,10 (m, 2H); 6,59 (d, J = 6,8 Hz; 1H); 3,39 (q, J = 7,4 Hz; 4H); 1,30 (t, J = 7,3 Hz; 6H) ESI MS (m/z): 315,15 [M+1].
74	isopropil(metil)((2-(piridin-3-il)-2H-indazol-4-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 Mhz; CLOROFORMO-D) δ 9,19 (d, J = 2,2 Hz; 1H); 8,63 (dd, J = 4,9; 1,5 Hz; 1H); 8,59 (d, J = 1,0 Hz; 1H); 8,30-8,27 (m, 1H); 7,48-7,45 (m, 1H); 7,37 (d, J = 8,8 Hz; 1H); 7,21 (dd, J = 8,8; 7,1 Hz; 1H); 6,79-6,77 (m, 1H); 3,55-3,48 (m, 1H); 3,02 (s,

		3H); 1,58 (d, J = 6,8 Hz; 3H); 1,54 (d, J = 6,8 Hz; 3H); ESI MS (m/z): 315,3 [M+1].
75	((2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-4-il)imino)diisobutil- λ^6 -sulfanona	¹ H-NMR (400 Mhz; CLOROFORMO-D) δ 9,01 (d, J = 1,5 Hz; 1H); 8,56 (d, J = 1,0 Hz; 1H); 8,48 (d, J = 2,4 Hz; 1H); 8,10 (dt, J = 9,3; 2,3 Hz; 1H); 7,32-7,29 (m, 1H); 7,20 (dd, J = 8,8; 7,1 Hz; 1H); 6,74 (dd, J = 7,3; 0,5 Hz; 1H); 3,25 (dd, J = 14,2; 6,1 Hz; 2H); 3,08 (td, J = 13,8; 6,6 Hz; 2H); 2,49-2,39 (m, 2H); 1,16-1,11 (m, 12H); ESI MS (m/z): 389,4 [M+1].
76	dipropil((2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-4-il)imino)- λ^6 -sulfanona	¹ H-NMR (400 Mhz; CLOROFORMO-D) δ 9,35 (s, 2H); 9,22 (s, 1H); 8,59 (d, J = 1,0 Hz; 1H); 7,35 (d, J = 8,8 Hz; 1H); 7,21 (dd, J = 8,8; 7,1 Hz; 1H); 6,76 (dd, J = 7,1; 0,5 Hz; 1H); 3,30-3,16 (m, 4H); 1,97-

		1,88 (m, 4H); 1,07 (q, J = 7,3 Hz; 6H) ESI MS (m/z): 344,3 [M+1].
77	((2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-4-il)imino)dipropil-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 Mhz; CLOROFORMO-D) δ 9,02 (d, J = 1,7 Hz; 1H); 8,59 (d, J = 1,0 Hz; 1H); 8,49 (d, J = 2,7 Hz; 1H); 8,11 (dt, J = 9,3; 2,3 Hz; 1H); 7,34 (d, J = 8,6 Hz; 1H); 7,20 (dd, J = 8,8; 7,1 Hz; 1H); 6,76-6,74 (m, 1H); 3,30-3,16 (m, 4H); 2,96 (s, 1H); 2,88 (d, J = 0,5 Hz; 1H); 1,98-1,88 (m, 4H); 1,08 (t, J = 7,5 Hz; 6H); ESI MS (m/z): 361 [M+1].
78	dipropil((2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-4-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 Mhz; DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,33 (d, J = 2,7 Hz; 1H); 8,98 (s, 1H); 8,61 (dd, J = 4,6; 1,5 Hz; 1H); 8,50-8,47 (m, 1H); 7,60 (dd, J = 8,1; 4,6 Hz; 1H); 7,17-7,09 (m, 2H); 6,58 (d, J = 6,1 Hz; 1H); 3,42-3,33 (m, 4H); 1,81

		(dt, J = 23,6; 7,4 Hz; 4H); 0,98 (t, J = 7,5 Hz; 6H); ESI MS (m/z): 343,3 [M+1].
79	diisobutil((2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 Mhz; DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,27 (d, J = 2,4 Hz; 1H); 8,92 (s, 1H); 8,60 (d, J = 3,4 Hz; 1H); 8,41 (d, J = 9,5 Hz; 1H); 7,62-7,55 (m, 4H); 7,16 (s, 1H); 6,98 (dd, J = 9,0; 2,0 Hz; 1H); 3,24-3,17 (m, 4H); 2,29 (t, J = 6,6 Hz; 2H); 1,09-1,01 (m, 12H); ESI MS (m/z): 371,1 [M+1].
80	((2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)diisobutil-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 Mhz; DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,19 (s, 1H); 8,97 (s, 1H); 8,63 (d, J = 2,7 Hz; 1H); 8,41 (dt, J = 10,1; 2,3 Hz; 1H); 7,56 (d, J = 9,3 Hz; 1H); 7,14 (d, J = 1,2 Hz; 1H); 7,00 (dd, J = 9,0; 2,0 Hz; 1H); 3,27-3,18 (m, 4H); 2,32-2,24 (m, 2H); 1,09-1,01 (m, 12H); ESI MS (m/z): 389,2 [M+1].

81	1-óxido de 1-((2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-4-il)imino)tetrahidro-1 <i>H</i> -λ ⁶ -tiofeno	¹ H-NMR (400 Mhz; DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,54 (s, 2H); 9,21 (s, 1H); 9,13 (s, 1H); 7,22-7,16 (m, 2H); 6,52 (dd, J = 6,4; 1,2 Hz; 1H); 3,48-3,33 (m, 4H); 2,32-2,10 (m, 4H); ESI MS (m/z): 314 [M+1].
82	dimetil((2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-4-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 Mhz; DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,53 (s, 2H); 9,21 (s, 1H); 9,09 (d, J = 0,7 Hz; 1H); 7,19-7,15 (m, 2H); 6,60 (dd, J = 6,5; 1,3 Hz; 1H); 3,33 (s, 6H); ESI MS (m/z): 287,9 [M+1].
83	dietil((2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-4-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 Mhz; DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,54 (s, 2H); 9,21 (s, 1H); 9,11 (d, J = 0,7 Hz; 1H); 7,19-7,12 (m, 2H); 6,61 (dd, J = 6,6; 1,0 Hz; 1H); 3,40 (q, J = 7,4 Hz; 4H); 1,31 (t, J = 7,3 Hz; 6H) ESI MS (m/z): 316,1 [M+1].

84	isopropil(metil)((2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-4-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 Mhz; DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,54 (d, J = 3,7 Hz; 2H); 9,21 (s, 1H); 9,11 (d, J = 0,5 Hz; 1H); 7,19-7,13 (m, 2H); 6,62 (dd, J = 6,1; 1,5 Hz; 1H); 3,63-3,56 (m, 1H); 3,15 (s, 3H); 1,48 (d, J = 6,6 Hz; 3H); 1,42 (d, J = 6,8 Hz; 3H); ESI MS (m/z): 315,9 [M+1].
85	etil(isopropil)((2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-4-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 Mhz; DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,55 (s, 2H); 9,21 (s, 1H); 9,12 (d, J = 0,7 Hz; 1H); 7,18-7,11 (m, 2H); 6,62 (dd, J = 6,5; 1,3 Hz; 1H); 3,65-3,58 (m, 1H); 3,41-3,34 (m, 2H); 1,45 (d, J = 6,8 Hz; 3H); 1,36 (d, J = 6,8 Hz; 3H); 1,28 (t, J = 7,5 Hz; 3H); ESI MS (m/z): 330 [M+1].
86	1-óxido de 1-((2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-4-il)imino)tetrahidro-1 <i>H</i> -λ ⁶ -tiofeno	¹ H-NMR (400 Mhz; DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,26 (d, J = 1,2 Hz; 1H); 9,10 (d, J = 0,5 Hz; 1H); 8,63-8,63 (m, 1H); 8,53 (dt,

		J = 10,0; 2,3 Hz; 1H); 7,20-7,15 (m, 2H); 6,51 (dd, J = 6,0; 1,8 Hz; 1H); 3,47-3,34 (m, 4H); 2,31-2,10 (m, 4H); ESI MS (m/z): 331 [M+1].
87	((2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-4-il)imino)dimetil-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 Mhz; DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,25 (t, J = 1,3 Hz; 1H); 9,06 (d, J = 0,7 Hz; 1H); 8,63-8,63 (m, 1H); 8,52 (dt, J = 10,0; 2,3 Hz; 1H); 7,20-7,14 (m, 2H); 6,59 (dd, J = 6,2; 1,6 Hz; 1H); 3,32 (s, 6H); ESI MS (m/z): 305 [M+1].
88	1-óxido de 1-((2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-4-il)imino)tetrahidro-1 <i>H</i> -λ ⁶ -tiofeno	¹ H-NMR (400 Mhz; DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,33 (d, J = 2,2 Hz; 1H); 9,03 (d, J = 0,7 Hz; 1H); 8,60 (dd, J = 4,6; 1,5 Hz; 1H); 8,49 (dq, J = 8,3; 1,4 Hz; 1H); 7,60 (ddd, J = 8,4; 4,8; 0,7 Hz; 1H); 7,21-7,13 (m, 2H); 6,51 (dd, J = 6,7; 0,9 Hz; 1H); 3,47-3,41 (m, 2H); 3,36-3,33 (m, 2H); 2,29-2,21 (m, 2H); 2,20-2,14 (m,

		2H); 1,90 (s, 1H); 1,22 (s, 1H); ESI MS (m/z): 389,2 [M+1].
89	dietil((2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-4-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 Mhz; DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,27 (d, J = 1,5 Hz; 1H); 9,08 (d, J = 1,0 Hz; 1H); 8,63-8,63 (m, 1H); 8,53 (dt, J = 10,0; 2,3 Hz; 1H); 7,17-7,11 (m, 2H); 6,59 (dd, J = 6,5; 1,3 Hz; 1H); 3,39 (q, J = 7,4 Hz; 4H); 1,31 (t, J = 7,3 Hz; 6H); ESI MS (m/z): 333 [M+1].
90	((2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-4-il)imino)(isopropil)(metil)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 Mhz; DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,27 (t, J = 1,3 Hz; 1H); 9,08 (s, 1H); 8,64-8,63 (m, 1H); 8,54 (dt, J = 10,1; 2,4 Hz; 1H); 7,17-7,12 (m, 2H); 6,61 (dd, J = 5,7; 2,1 Hz; 1H); 3,62-3,55 (m, 1H); 3,14 (s, 3H); 1,48 (d, J = 6,8 Hz; 3H); 1,42 (d, J = 6,8 Hz; 3H); ESI MS (m/z): 333 [M+1].

91	etil((2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-4-il)imino)(isopropil)- λ^6 -sulfanona	$^1\text{H-NMR}$ (400 Mhz; DMSO- d_6) δ 9,27 (q, $J = 1,0$ Hz; 1H); 9,09 (d, $J = 0,7$ Hz; 1H); 8,63-8,63 (m, 1H); 8,54 (dt, $J = 10,1$; 2,4 Hz; 1H); 7,16-7,10 (m, 2H); 6,61 (dd, $J = 6,2$; 1,6 Hz; 1H); 3,64-3,58 (m, 1H); 3,41-3,35 (m, 2H); 1,45 (d, $J = 6,8$ Hz; 3H); 1,36 (d, $J = 6,8$ Hz; 3H); 1,28 (t, $J = 7,5$ Hz; 3H); ESI MS (m/z): 347,2 [M+1].
99	isopropil((2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)(3,3,3-trifluoropropil)- λ^6 -sulfanona	$^1\text{H-NMR}$ (400 Mhz; DMSO- d_6) δ 9,27 (d, $J = 2,4$ Hz; 1H); 8,94 (d, $J = 0,6$ Hz; 1H); 8,60 (dd, $J = 4,6$; 1,5 Hz; 1H); 8,41 (dq, $J = 8,3$; 1,4 Hz; 1H); 7,62-7,58 (m, 2H); 7,21 (q, $J = 0,9$ Hz; 1H); 7,04 (dd, $J = 9,2$; 2,1 Hz; 1H); 3,70-3,63 (m, 1H); 3,52-3,48 (m, 2H); 2,85-2,73 (m, 2H); 1,40 (d, $J = 6,7$ Hz; 3H); 1,34 (d,

		J = 6,7 Hz; 3H); ESI MS (m/z): 397 [M+1].
100	((2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)(isopropil)(3,3,3-trifluoropropil)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 Mhz; DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,20 (s, 1H); 8,99 (d, J = 0,9 Hz; 1H); 8,64 (d, J = 2,8 Hz; 1H); 8,43 (dt, J = 10,1; 2,4 Hz; 1H); 7,59 (d, J = 9,5 Hz; 1H); 7,20 (q, J = 0,9 Hz; 1H); 7,06 (dd, J = 9,2; 1,8 Hz; 1H); 3,71-3,61 (m, 1H); 3,53-3,49 (m, 2H); 2,85-2,72 (m, 2H); 1,40 (d, J = 6,7 Hz; 3H); 1,34 (d, J = 7,0 Hz; 3H); ESI MS (m/z): 415 [M+1].
101	isopropil((2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)(3,3,3-trifluoropropil)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 Mhz; DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,47 (s, 2H); 9,22 (s, 1H); 9,00 (d, J = 0,9 Hz; 1H); 7,61 (dd, J = 9,2; 0,9 Hz; 1H); 7,22 (q, J = 0,9 Hz; 1H); 7,06 (dd, J = 9,2; 2,1 Hz; 1H); 3,71-3,64 (m, 1H); 3,53-3,49 (m, 2H); 2,85-2,73 (m, 2H); 1,40 (d, J = 6,7 Hz; 3H); 1,34 (d, J = 6,7 Hz; 3H);

		ESI MS (m/z): 398 [M+1].
102	isopropil((2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-4-il)imino)(3,3,3-trifluoropropil)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 Mhz; DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,34 (d, J = 2,1 Hz; 1H); 9,07 (d, J = 0,9 Hz; 1H); 8,62 (dd, J = 4,7; 1,4 Hz; 1H); 8,49 (dq, J = 8,3; 1,4 Hz; 1H); 7,61 (ddd, J = 8,3; 4,7; 0,7 Hz; 1H); 7,21 (d, J = 8,6 Hz; 1H); 7,13 (dd, J = 8,6; 7,0 Hz; 1H); 6,63-6,61 (m, 1H); 3,78-3,71 (m, 1H); 3,58 (q, J = 5,2 Hz; 2H); 2,92-2,79 (m, 2H); 1,47 (d, J = 6,7 Hz; 3H); 1,39 (d, J = 6,7 Hz; 3H); ESI MS (m/z): 397 [M+1].
103	isopropil((2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-4-il)imino)(3,3,3-trifluoropropil)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 Mhz; DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,55 (d, J = 3,1 Hz; 2H); 9,23 (s, 1H); 9,16 (d, J = 0,9 Hz; 1H); 7,22 (dd, J = 7,9; 0,9 Hz; 1H); 7,15 (dd, J = 8,7; 6,9 Hz; 1H); 6,64 (dd, J = 7,0; 0,6 Hz; 1H); 3,79-3,72

		(m, 1H); 3,61-3,57 (m, 2H); 2,91-2,79 (m, 2H); 1,48 (d, J = 6,7 Hz; 3H); 1,39 (d, J = 6,7 Hz; 3H) ESI MS (m/z): 398 [M+1].
104	((2-(5-fluoropiridin-3-il)-2H-indazol-4-il)imino)(isopropil)(3,3,3-trifluoropropil)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 Mhz; DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,27 (s, 1H); 9,13 (d, J = 0,9 Hz; 1H); 8,65 (d, J = 2,8 Hz; 1H); 8,53 (dt, J = 10,2; 2,4 Hz; 1H); 7,20 (d, J = 8,6 Hz; 1H); 7,14 (dd, J = 8,7; 6,9 Hz; 1H); 6,62 (dd, J = 6,9; 0,8 Hz; 1H); 3,78-3,71 (m, 1H); 3,61-3,57 (m, 2H); 2,91-2,79 (m, 2H); 1,48 (d, J = 6,7 Hz; 3H); 1,39 (d, J = 7,0 Hz; 3H); ESI MS (m/z): 415 [M+1].
108	etil((7-fluoro-2-(piridin-3-il)-2H-indazol-4-il)imino)(isopropil)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 Mhz; DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,35 (d, J = 2,2 Hz; 1H); 9,12 (d, J = 2,7 Hz; 1H); 8,65 (dd, J = 4,8; 1,3 Hz; 1H); 8,52 (dq, J = 8,3; 1,4 Hz; 1H); 7,62 (ddd,

		J = 8,3; 4,6; 0,7 Hz; 1H); 6,91 (dd, J = 11,7; 7,8 Hz; 1H); 6,48 (dd, J = 7,9; 3,3 Hz; 1H); 3,62-3,55 (m, 1H); 2,97-2,87 (m, 1H); 1,43 (d, J = 6,6 Hz; 3H); 1,35 (d, J = 6,8 Hz; 3H); 1,26 (t, J = 7,5 Hz; 3H); 1,22-1,17 (m, 4H); ESI MS (m/z): 347 [M+1].
109	etil((7-fluoro-2-(piridin-3-il)-2H-indazol-4-il)imino)(metil)- λ^6 -sulfanona	$^1\text{H-NMR}$ (400 Mhz; DMSO- d_6) δ 9,33 (d, J = 2,2 Hz; 1H); 9,11 (d, J = 2,7 Hz; 1H); 8,64 (dd, J = 4,6; 1,5 Hz; 1H); 8,51 (dq, J = 8,3; 1,4 Hz; 1H); 7,62 (ddd, J = 8,4; 4,8; 0,7 Hz; 1H); 6,93 (dd, J = 11,9; 7,9 Hz; 1H); 6,46 (dd, J = 7,9; 3,3 Hz; 1H); 3,42 (q, J = 7,3 Hz; 2H); 3,19 (s, 3H); 1,35 (t, J = 7,3 Hz; 3H) ESI MS (m/z): 319 [M+1].

136	etil(propil)((2-(piridin-3-il)-2H-indazol-4-il)imino)- λ^6 -sulfanona	$^1\text{H-NMR}$ (400 Mhz; DMSO- d_6) δ 9,33 (d, J = 2,2 Hz; 1H); 8,99 (d, J = 0,7 Hz; 1H); 8,61 (dd, J = 4,6; 1,5 Hz; 1H); 8,49 (dq, J = 8,3; 1,4 Hz; 1H); 7,60 (ddd, J = 8,3; 4,6; 0,7 Hz; 1H); 7,17 (d, J = 8,6 Hz; 1H); 7,11 (dd, J = 8,7; 7,0 Hz; 1H); 6,59 (dd, J = 6,8; 1,0 Hz; 1H); 3,42-3,33 (m, 4H); 1,81 (dt, J = 23,6; 7,4 Hz; 2H); 1,34-1,29 (m, 4H); 1,26-1,22 (m, 3H); 0,99 (t, J = 7,3 Hz; 3H); 0,84 (t, J = 6,7 Hz; 1H); ESI MS(m/z): 328,55 [M+1].
137	etil(propil)((2-(piridin-3-il)-2H-indazol-5-il)imino)- λ^6 -sulfanona	$^1\text{H-NMR}$ (400 Mhz; DMSO- d_6) δ 9,26 (d, J = 2,4 Hz; 1H); 8,91 (s, 1H); 8,60 (dd, J = 4,8; 1,3 Hz; 1H); 8,40 (dq, J = 8,4; 1,3 Hz; 1H); 7,62-7,55 (m, 2H); 7,17 (d, J = 1,5 Hz; 1H); 6,99 (dd, J = 9,0; 2,0 Hz; 1H); 3,33 (d, J = 7,3 Hz; 1H);

		3,29-3,25 (m, 3H); 1,75 (q, J = 7,8 Hz; 2H); 1,28-1,15 (m, 5H); 0,97 (t, J = 7,5 Hz; 3H); ESI MS(m/z): 328,95 [M+1].
138	etil((2-(5-fluoropiridin-3-il)-2H-indazol-4-il)imino)(propil)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 Mhz; DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,27 (s, 1H); 9,07 (d, J = 0,5 Hz; 1H); 8,63 (d, J = 2,4 Hz; 1H); 8,54 (dt, J = 10,2; 2,3 Hz; 1H); 7,17-7,11 (m, 2H); 6,59 (dd, J = 6,2; 1,6 Hz; 1H); 3,43-3,34 (m, 4H); 1,81 (dt, J = 23,5; 7,3 Hz; 2H); 1,31 (t, J = 7,5 Hz; 3H); 0,99 (t, J = 7,5 Hz; 3H); ESI MS(m/z): 346,55 [M+1].
139	((2-(5-fluoropiridin-3-il)-2H-pirazolo[3,4-n]piridin-5-il)imino)dipropil-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 Mhz; DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,21 (s, 1H); 9,00 (s, 1H); 8,67 (d, J = 2,4 Hz; 1H); 8,46 (dt, J = 10,1; 2,4 Hz; 1H); 8,33 (d, J = 2,4 Hz; 1H); 7,55 (d, J = 2,4 Hz; 1H); 3,37-3,33 (m, 4H); 1,77 (dt, J = 23,8;

		7,3 Hz; 4H); 0,97 (t, J = 7,3 Hz; 6H) ESI MS (m/z): 361,55 [M+1].
140	(3-fluoropiridin-2-il)((2-(5-fluoropiridin-3-il)-2H-pirazolo[3,4-b]piridin-5-il)imino)(metil)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 Mhz; DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,17 (d, J = 1,2 Hz; 1H); 9,00 (s, 1H); 8,66 (d, J = 2,4 Hz; 1H); 8,58 (td, J = 3,0; 1,4 Hz; 1H); 8,43 (dt, J = 9,9; 2,3 Hz; 1H); 8,34 (d, J = 2,7 Hz; 1H); 8,03-7,98 (m, 1H); 7,81-7,77 (m, 1H); 7,49 (d, J = 2,4 Hz; 1H); 3,66 (s, 3H); ESI MS (m/z): 386,4 [M+1].
141	((2-(5-fluoropiridin-3-il)-2H-pirazolo[3,4-b]piridin-5-il)imino)(metil)(piridin-3-il)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 Mhz; DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,15-9,13 (m, 2H); 8,94 (s, 1H); 8,83 (dd, J = 4,9; 1,5 Hz; 1H); 8,66 (d, J = 2,4 Hz; 1H); 8,42-8,36 (m, 3H); 7,66 (ddd, J = 8,2; 4,8; 0,7 Hz; 1H); 7,40 (d, J = 2,7 Hz; 1H); 3,61 (s, 3H); ESI MS(m/z): 368,45 [M+1].

142	(2-cloropiridin-3-il)((2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -pirazolo[3,4- <i>b</i>]piridin-5-il)imino)(metil)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 Mhz; DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,14 (s, 1H); 8,94 (s, 1H); 8,65 (td, J = 4,7; 2,0 Hz; 2H); 8,60 (dd, J = 7,8; 2,0 Hz; 1H); 8,42-8,39 (m, 2H); 7,71 (dd, J = 7,8; 4,6 Hz; 1H); 7,38 (d, J = 2,4 Hz; 1H); 3,71 (s, 3H); ESI Ms(m/z): 402,4 [M+1].
143	(5-fluoropiridin-3-il)((2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -pirazolo[3,4- <i>b</i>]piridin-5-il)imino)(metil)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 Mhz; DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,16 (s, 1H); 8,95 (s, 1H); 8,85-8,81 (m, 1H); 8,68-8,66 (m, 1H); 8,42 (dt, J = 10,0; 2,3 Hz; 1H); 8,33 (d, J = 2,7 Hz; 1H); 8,29 (q, J = 4,3 Hz; 1H); 8,03 (td, J = 8,6; 2,9 Hz; 1H); 7,43 (d, J = 2,4 Hz; 1H); 3,56 (s, 3H); ESI MS(m/z): 386,45 [M+1].
144	(5-cloropiridin-3-il)((2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -pirazolo[3,4- <i>b</i>]piridin-5-il)imino)(metil)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 Mhz; DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,16 (s, 1H); 8,95 (s, 1H); 8,85-8,81 (m, 1H); 8,68-8,66 (m, 1H); 8,42 (dt, J = 10,0; 2,3 Hz; 1H);

		8,33 (d, J = 2,7 Hz; 1H); 8,29 (q, J = 4,3 Hz; 1H); 8,03 (td, J = 8,6; 2,9 Hz; 1H); 7,43 (d, J = 2,4 Hz; 1H); 3,56 (s, 3H); ESI MS(m/z): 402,45 [M+1].
145	((2-(5-fluoropiridin-3-il)-2H- pirazolo[3,4-b]piridin-5- il)imino)(metil)(6- (trifluorometil)piridin-3-il)-λ ⁶ - sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,33 (d, J = 2,0 Hz, 1H), 9,15 (s, 1H), 8,96 (d, J = 3,9 Hz, 1H), 8,67 (dd, J = 6,8, 2,4 Hz, 2H), 8,44-8,39 (m, 2H), 8,18 (d, J = 7,6 Hz, 1H), 7,47 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 3,69 (s, 3H); ESI MS(m/z):437,05 [M + 1].
146	dimetil((2-(piridin-3-il)-2H- pirazolo[3,4-b]piridin-5- il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,29 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,98 (s, 1H), 8,64 (dd, J = 4,8, 1,3 Hz, 1H), 8,45 (dq, J = 8,3, 1,4 Hz, 1H), 8,31 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 7,65-7,62 (m, 1H), 7,57 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 3,29 (s, 6H); ESI MS(m/z):287,5 [M+1].

147	etil(metil)((2-(piridin-3-il)-2H-pirazolo[3,4-b]piridin-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,29 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,97 (s, 1H), 8,64 (dd, J = 4,8, 1,3 Hz, 1H), 8,44 (dq, J = 8,4, 1,3 Hz, 1H), 8,32 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 7,65-7,62 (m, 1H), 7,57 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 3,48-3,41 (m, 2H), 3,20 (s, 3H), 1,31 (t, J = 7,3 Hz, 3H); ESI MS(m/z):301,5 [M + 1].
148	etil(isopropil)((2-(piridin-3-il)-2H-pirazolo[3,4-b]piridin-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,28 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,96 (s, 1H), 8,64 (dd, J = 4,6, 1,5 Hz, 1H), 8,43 (dq, J = 8,4, 1,3 Hz, 1H), 8,34 (dd, J = 11,7, 2,7 Hz, 1H), 7,64 (dd, J = 8,3, 4,9 Hz, 1H), 7,59-7,57 (m, 1H), 3,66-3,56 (m, 1H), 3,40-3,33 (m, 2H), 1,39 (d, J = 6,6 Hz, 3H), 1,32 (d, J = 6,8 Hz, 3H), 1,25 (q, J = 7,1 Hz, 3H); ESI MS(m/z):329,55 [M + 1].

149	diisopropil((2-(piridin-3-il)-2H-pirazolo[3,4-b]piridin-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,28 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,96 (s, 1H), 8,64 (dd, J = 4,8, 1,3 Hz, 1H), 8,44 (dq, J = 8,3, 1,4 Hz, 1H), 8,32 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 7,63 (dd, J = 8,1, 4,4 Hz, 1H), 7,57 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 3,34 (dd, J = 9,7, 6,0 Hz, 4H), 1,77 (dt, J = 23,6, 7,4 Hz, 4H), 0,97 (t, J = 7,5 Hz, 6H) ESI MS(m/z):343,55 [M + 1].
150	diisobutil((2-(piridin-3-il)-2H-pirazolo[3,4-b]piridin-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,28 (d, J = 2,1 Hz, 1H), 8,97 (d, J = 4,0 Hz, 1H), 8,64 (dd, J = 4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,44 (dq, J = 8,3, 1,4 Hz, 1H), 8,32 (d, J = 2,8 Hz, 1H), 7,65-7,62 (m, 1H), 7,56 (d, J = 2,8 Hz, 1H), 3,31-3,24 (m, 4H), 2,36-2,26 (m, 2H), 1,21-0,98 (m,

		12H); ESI MS(m/z):371,65 [M + 1].
151	(3-metoxipiridin-2-il)(metil)((2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -pirazolo[3,4- <i>b</i>]piridin-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,25 (d, <i>J</i> = 2,4 Hz, 1H), 8,93 (s, 1H), 8,62 (dd, <i>J</i> = 4,8, 1,3 Hz, 1H), 8,40 (dq, <i>J</i> = 8,4, 1,3 Hz, 1H), 8,33 (d, <i>J</i> = 2,7 Hz, 1H), 8,23 (dd, <i>J</i> = 4,4, 1,2 Hz, 1H), 7,74 (dd, <i>J</i> = 8,6, 1,2 Hz, 1H), 7,66-7,60 (m, 2H), 7,43 (d, <i>J</i> = 2,4 Hz, 1H), 3,81 (s, 3H), 3,56 (s, 3H); ESI MS(m/z):380,45 [M + 1].
152	(3-fluoropiridin-2-il)(metil)((2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -pirazolo[3,4- <i>b</i>]piridin-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,24 (d, <i>J</i> = 2,4 Hz, 1H), 8,97 (s, 1H), 8,63 (dd, <i>J</i> = 4,6, 1,2 Hz, 1H), 8,58 (d, <i>J</i> = 4,4 Hz, 1H), 8,40 (dq, <i>J</i> = 8,4, 1,3 Hz, 1H), 8,32 (d, <i>J</i> = 2,7 Hz, 1H), 8,01 (t, <i>J</i> = 9,4 Hz, 1H), 7,81-7,77 (m, 1H), 7,65-7,60 (m, 1H), 7,50 (d, <i>J</i> = 2,7 Hz, 1H), 3,66 (s,

		3H); ESI MS(m/z):368,45 [M + 1].
153	(2-cloropiridin-3-il)(metil)((2- piridin-3-il)-2 <i>H</i> -pirazolo[3,4- b]piridin-5-il)imino)-λ ⁶ - sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,19 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,88 (t, J = 3,8 Hz, 1H), 8,62- 8,59 (m, 2H), 8,56 (dd, J = 7,6, 1,8 Hz, 1H), 8,37-8,34 (m, 2H), 7,68 (dd, J = 7,8, 4,7 Hz, 1H), 7,58 (ddd, J = 8,4, 4,7, 0,6 Hz, 1H), 7,36 (d, J = 2,8 Hz, 1H), 3,68 (s, 3H); ESI MS(m/z):384,5 [M + 1].
154	(5-cloropiridin-3-il)(metil)((2- piridin-3-il)-2 <i>H</i> -pirazolo[3,4- b]piridin-5-il)imino)-λ ⁶ - sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,24 (dd, J = 7,3, 2,8 Hz, 1H), 9,07 (d, J = 1,8 Hz, 1H), 8,93-8,88 (m, 2H), 8,64- 8,61 (m, 1H), 8,52 (t, J = 2,1 Hz, 1H), 8,41- 8,37 (m, 2H), 7,64-7,60 (m, 1H), 7,46 (d, J = 2,8 Hz, 1H), 3,65 (d, J = 8,3 Hz, 3H) ESI MS(m/z):384,45 [M + 1].

155	1-óxido de 1-((2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -pirazolo[3,4- <i>b</i>]piridin-5-il)imino)tetrahidro-1 <i>H</i> -λ ⁶ -tiofeno	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,29 (d, <i>J</i> = 2,4 Hz, 1H), 8,98 (d, <i>J</i> = 4,0 Hz, 1H), 8,64 (dd, <i>J</i> = 4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,45 (dq, <i>J</i> = 8,4, 1,3 Hz, 1H), 8,33 (d, <i>J</i> = 2,8 Hz, 1H), 7,66-7,62 (m, 1H), 7,51 (d, <i>J</i> = 2,4 Hz, 1H), 3,50-3,41 (m, 2H), 3,34 (s, 1H), 3,29 (t, <i>J</i> = 7,0 Hz, 1H), 2,32-2,19 (m, 2H), 2,18-2,08 (m, 2H); ESI MS(<i>m/z</i>):313,5 [<i>M</i> + 1].
156	isopropil(metil)((2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -pirazolo[3,4- <i>b</i>]piridin-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,29 (d, <i>J</i> = 2,4 Hz, 1H), 8,97 (s, 1H), 8,64 (dd, <i>J</i> = 4,8, 1,3 Hz, 1H), 8,44 (dq, <i>J</i> = 8,4, 1,3 Hz, 1H), 8,33 (d, <i>J</i> = 2,7 Hz, 1H), 7,64 (dd, <i>J</i> = 8,6, 5,1 Hz, 1H), 7,59 (d, <i>J</i> = 2,4 Hz, 1H), 3,58 (t, <i>J</i> = 6,8 Hz, 1H), 3,12 (s, 3H), 1,41 (d, <i>J</i> = 6,8 Hz, 3H), 1,37 (d, <i>J</i> = 6,8 Hz, 3H)

		ESI MS(m/z):315,5 [M + 1].
157	metil((2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -pirazolo[3,4- <i>b</i>]piridin-5-il)imino)(6-(trifluorometil)piridin-3-il)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,33 (d, J = 2,1 Hz, 1H), 9,22 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,91 (d, J = 4,0 Hz, 1H), 8,68-8,62 (m, 2H), 8,42 (d, J = 2,8 Hz, 1H), 8,39 (dq, J = 8,3, 1,4 Hz, 1H), 8,18 (d, J = 8,3 Hz, 1H), 7,63-7,60 (m, 1H), 7,48 (d, J = 2,8 Hz, 1H), 3,67 (d, J = 14,4 Hz, 3H); ESI MS(m/z):418,5 [M + 1].
158	metil(piridin-2-il)((2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -pirazolo[3,4- <i>b</i>]piridin-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,23 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,91 (s, 1H), 8,78 (d, J = 3,9 Hz, 1H), 8,62 (dd, J = 4,6, 1,2 Hz, 1H), 8,39 (dq, J = 8,3, 1,4 Hz, 1H), 8,30 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,18 (d, J = 7,8 Hz, 1H), 8,11 (td, J = 7,7, 1,7 Hz, 1H), 7,68 (ddd, J = 7,5, 4,7, 1,2 Hz, 1H), 7,61 (dd, J = 8,1, 4,6 Hz, 1H), 7,43 (d, J = 2,7 Hz, 1H),

		3,55 (s, 3H); ESI MS(m/z): 350,5 [M+1].
159	(5-fluoropiridin-3-il)(metil)((2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -pirazolo[3,4- <i>b</i>]piridin-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,23 (d, <i>J</i> = 2,2 Hz, 1H), 8,91 (s, 1H), 8,82 (d, <i>J</i> = 2,8 Hz, 1H), 8,63 (dd, <i>J</i> = 4,8, 1,3 Hz, 1H), 8,39 (dq, <i>J</i> = 8,3, 1,4 Hz, 1H), 8,31 (d, <i>J</i> = 2,4 Hz, 1H), 8,27 (q, <i>J</i> = 4,4 Hz, 1H), 8,03 (td, <i>J</i> = 8,7, 2,9 Hz, 1H), 7,62 (ddd, <i>J</i> = 8,3, 4,8, 0,6 Hz, 1H), 7,44 (d, <i>J</i> = 2,7 Hz, 1H), 5,75 (s, 1H), 3,56 (s, 2H); ESI MS(m/z):368,45 [M + 1].
160	1-óxido de 1-((2-(5-cloropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)tetrahidro-1 <i>H</i> -λ ⁶ -tiofeno	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,26 (d, <i>J</i> = 2,0 Hz, 1H), 8,99 (d, <i>J</i> = 0,7 Hz, 1H), 8,66 (d, <i>J</i> = 2,0 Hz, 1H), 8,60 (t, <i>J</i> = 2,2 Hz, 1H), 7,58 (d, <i>J</i> = 9,0 Hz, 1H), 7,08 (q, <i>J</i> = 0,9 Hz, 1H), 7,00 (dd, <i>J</i> = 9,2, 2,1 Hz, 1H), 3,41-3,35 (m, 2H), 3,28-3,21 (m, 2H), 2,24-2,18

		(m, 2H), 2,14-2,06 (m, 2H) ESI MS(m/z):368,45 [M + 1].
161	1-óxido de 1-((2-(2-metilpiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)tetrahidro-1 <i>H</i> -λ ⁶ -tiofeno	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,60 (dd, J = 4,8, 1,6 Hz, 1H), 8,48 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 7,91 (dd, J = 7,8, 1,5 Hz, 1H), 7,57 (d, J = 9,0 Hz, 1H), 7,46 (dd, J = 7,7, 4,8 Hz, 1H), 7,14 (d, J = 1,2 Hz, 1H), 6,98 (dd, J = 9,2, 2,1 Hz, 1H), 3,41-3,34 (m, 2H), 3,25-3,18 (m, 2H), 2,42 (s, 3H), 2,24-2,19 (m, 2H), 2,15-2,07 (m, 3H); ESI MS(m/z):326,95 [M + 1].
162	1-óxido de 1-((2-(4-metilpiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)tetrahidro-1 <i>H</i> -λ ⁶ -tiofeno	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,65 (s, 1H), 8,56 (d, J = 4,9 Hz, 1H), 8,50 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 7,57 (d, J = 9,3 Hz, 1H), 7,51 (d, J = 5,1 Hz, 1H), 7,15 (d, J = 1,5 Hz, 1H), 6,98 (dd, J = 9,2, 2,1 Hz, 1H), 3,41-3,34

		(m, 2H), 3,25-3,18 (m, 2H), 2,29 (s, 3H), 2,24-2,18 (m, 2H), 2,15-2,08 (m, 2H); ESI MS(m/z):326,95 [M + 1].
163	1-óxido de 1-((2-(6-metilpiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)tetrahidro-1 <i>H</i> -λ ⁶ -tiofeno	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,11 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,87 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 8,28 (dd, J = 8,6, 2,7 Hz, 1H), 7,58 (d, J = 9,0 Hz, 1H), 7,45 (d, J = 8,3 Hz, 1H), 7,10 (t, J = 1,0 Hz, 1H), 6,97 (dd, J = 9,2, 2,1 Hz, 1H), 3,41-3,34 (m, 2H), 3,26-3,16 (m, 2H), 2,54 (s, 3H), 2,27-2,05 (m, 4H); ESI MS(m/z):327,05 [M + 1].
164	1-óxido de 1-((2-(5-metilpiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)tetrahidro-1 <i>H</i> -λ ⁶ -tiofeno	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,06 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,90 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 8,45 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 8,27-8,26 (m, 1H), 7,58 (dt, J = 9,1, 0,9 Hz, 1H), 7,10 (q, J = 0,9 Hz, 1H), 6,98 (dd, J = 9,2, 2,1 Hz, 1H), 3,41-3,34

		(m, 2H), 3,26-3,20 (m, 2H), 2,42 (d, J = 0,5 Hz, 3H), 2,26-2,07 (m, 4H); ESI MS(m/z):326,65 [M + 1].
165	((2-(5-cloropiridin-3-il)-2H-indazol-5-il)imino)dimetil-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,26 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,98 (d, J = 0,6 Hz, 1H), 8,66 (d, J = 2,1 Hz, 1H), 8,60 (t, J = 2,3 Hz, 1H), 7,57 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 7,14 (q, J = 0,9 Hz, 1H), 6,98 (dd, J = 9,2, 2,1 Hz, 1H), 3,23 (s, 6H); ESI MS(m/z):320,9 [M + 1].
166	dimetil((2-(5-(trifluorometil)piridin-3-il)-2H-indazol-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,60 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 9,10 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 9,00 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 8,78 (t, J = 1,8 Hz, 1H), 7,59 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 7,15 (t, J = 0,9 Hz, 1H), 7,00 (dd, J = 9,3, 2,0 Hz, 1H), 3,24 (s, 6H); ESI MS(m/z):354,85 [M + 1].

167	((2-(5-metoxipiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)dimetil- λ^6 -sulfanona	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, $\text{DMSO-}d_6$) δ 8,96 (d, $J = 0,9$ Hz, 1H), 8,87 (d, $J = 2,1$ Hz, 1H), 8,33 (d, $J = 2,4$ Hz, 1H), 7,99 (t, $J = 2,3$ Hz, 1H), 7,59-7,56 (m, 1H), 7,15-7,14 (m, 1H), 6,97 (dd, $J = 9,2, 2,1$ Hz, 1H), 3,94 (s, 3H), 3,23 (s, 6H); ESI MS(m/z):316,5 [M + 1].
168	dimetil((2-(5-metilpiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)- λ^6 -sulfanona	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, $\text{DMSO-}d_6$) δ 9,06 (d, $J = 2,4$ Hz, 1H), 8,90 (d, $J = 0,7$ Hz, 1H), 8,45 (d, $J = 1,0$ Hz, 1H), 8,27-8,26 (m, 1H), 7,56 (dt, $J = 9,1, 0,9$ Hz, 1H), 7,16-7,15 (m, 1H), 6,96 (dd, $J = 9,2, 2,1$ Hz, 1H), 3,22 (s, 6H), 2,42 (d, $J = 0,5$ Hz, 3H); ESI MS(m/z):300,55 [M + 1].
169	1-óxido de 1-((2-(2,6-dimetilpiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)tetrahidro-1 <i>H</i> - λ^6 -tiofeno	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, $\text{DMSO-}d_6$) δ 8,43 (d, $J = 0,9$ Hz, 1H), 7,77 (d, $J = 7,9$ Hz, 1H), 7,56 (d, $J = 9,2$ Hz, 1H), 7,29 (d,

		J = 8,3 Hz, 1H), 7,14 (q, J = 0,9 Hz, 1H), 6,97 (dd, J = 9,0, 2,0 Hz, 1H), 3,41-3,34 (m, 2H), 3,24-3,18 (m, 2H), 2,53 (s, 3H), 2,35 (s, 3H), 2,25-2,19 (m, 2H), 2,16-2,05 (m, 2H); ESI MS(m/z):341 [M + 1].
170	1-óxido de 1-((2-(5-metoxipiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)tetrahidro-1 <i>H</i> -λ ⁶ -tiofeno	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,96 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 8,88 (d, J = 1,8 Hz, 1H), 8,33 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 7,99 (t, J = 2,4 Hz, 1H), 7,59 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 7,09 (q, J = 0,9 Hz, 1H), 6,98 (dd, J = 9,2, 1,8 Hz, 1H), 3,98-3,91 (m, 3H), 3,41-3,35 (m, 2H), 3,27-3,20 (m, 2H), 2,28-2,05 (m, 5H); ESI MS(m/z):342,95 [M + 1].
171	1-óxido de 1-((2-(5-(trifluorometil)piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)tetrahidro-1 <i>H</i> -λ ⁶ -tiofeno	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,60 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 9,10 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 9,00 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 8,79 (t, J = 1,8 Hz, 1H), 7,61 (d,

		J = 9,5 Hz, 1H), 7,09 (q, J = 0,9 Hz, 1H), 7,01 (dd, J = 9,2, 1,8 Hz, 1H), 3,42-3,35 (m, 2H), 3,29-3,22 (m, 2H), 2,26-2,06 (m, 4H); ESI MS(m/z):380,85 [M + 1].
173	dimetil((2-(2-metilpiridin-3-il)-2H-indazol-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,60 (dd, J = 4,9, 1,5 Hz, 1H), 8,48 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 7,91 (dd, J = 7,9, 1,5 Hz, 1H), 7,56 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 7,45 (q, J = 4,1 Hz, 1H), 7,19 (q, J = 0,9 Hz, 1H), 6,97 (dd, J = 9,2, 1,8 Hz, 1H), 3,22 (s, 6H), 2,43 (s, 3H); ESI MS(m/z):300,55 [M + 1].
174	dimetil((2-(6-metilpiridin-3-il)-2H-indazol-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,11 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,87 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 8,28 (dd, J = 8,3, 2,7 Hz, 1H), 7,56 (dt, J = 9,1, 0,9 Hz, 1H), 7,45 (d, J = 8,6 Hz, 1H), 7,15 (q, J = 0,9 Hz, 1H), 6,96 (dd, J = 9,2,

		2,1 Hz, 1H), 3,22 (s, 6H), 2,52 (d, J = 9,5 Hz, 3H); ESI MS(m/z):300,5 [M + 1].
175	dimetil((2-(4-metilpiridin-3-il)-2H-indazol-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,64 (s, 1H), 8,56 (d, J = 4,9 Hz, 1H), 8,49 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 7,57-7,55 (m, 1H), 7,51 (d, J = 4,9 Hz, 1H), 7,19 (q, J = 0,9 Hz, 1H), 6,97 (dd, J = 9,2, 2,1 Hz, 1H), 3,22 (s, 6H), 2,30 (d, J = 5,5 Hz, 3H) ESI MS(m/z):300,55 [M + 1].
176	((2-(2,6-dimetilpiridin-3-il)-2H-indazol-5-il)imino)dimetil-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,42 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 7,77 (d, J = 7,9 Hz, 1H), 7,55 (dt, J = 9,2, 0,9 Hz, 1H), 7,29 (d, J = 7,9 Hz, 1H), 7,18 (q, J = 0,9 Hz, 1H), 6,96 (dd, J = 9,2, 2,1 Hz, 1H), 3,21 (s, 6H), 2,53 (s, 3H), 2,36 (s, 3H); ESI MS(m/z):314,95 [M + 1].

177	((3-cloro-2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)dimetil- λ^6 -sulfanona	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, $\text{DMSO-}d_6$) δ 9,37 (s, 1H), 9,29 (s, 2H), 7,61 (dd, $J = 9,3, 0,8$ Hz, 1H), 7,05 (dd, $J = 9,2, 2,1$ Hz, 1H), 6,99 (q, $J = 0,9$ Hz, 1H), 3,28-3,22 (m, 6H); ESI MS(m/z):321,7 [$M + 1$].
178	((3-cloro-2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)(isopropil)(metil)- λ^6 -sulfanona	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, $\text{DMSO-}d_6$) δ 9,33 (d, $J = 32,7$ Hz, 2H), 7,61-7,59 (m, 1H), 7,08 (dd, $J = 9,2, 2,1$ Hz, 1H), 7,02 (q, $J = 0,9$ Hz, 1H), 3,56 (s, 1H), 3,08 (s, 3H), 1,40 (d, $J = 6,7$ Hz, 3H), 1,35 (d, $J = 7,0$ Hz, 3H); ESI MS(m/z):349,95 [$M + 1$].
179	1-óxido de 1-((3-cloro-2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)tetrahidro-1 <i>H</i> - λ^6 -tiofeno	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, $\text{DMSO-}d_6$) δ 9,37 (s, 1H), 9,29 (s, 2H), 7,62 (dd, $J = 9,2, 0,9$ Hz, 1H), 7,06 (dd, $J = 9,2, 1,8$ Hz, 1H), 6,93 (q, $J = 0,9$ Hz, 1H), 3,43-3,36 (m, 2H), 3,27 (t, $J = 7,0$ Hz, 1H), 2,28-

		2,19 (m, 2H), 2,15-2,08 (m, 2H); ESI MS(m/z):347,9 [M + 1].
180	((3-cloro-2-(pirimidin-5-il)-2H-indazol-5-il)imino)(metil)(propil)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,37 (s, 1H), 9,29 (s, 2H), 7,60 (dd, J = 9,2, 0,9 Hz, 1H), 7,06 (dd, J = 9,2, 2,1 Hz, 1H), 7,00 (q, J = 0,9 Hz, 1H), 3,37 (dd, J = 9,9, 6,0 Hz, 2H), 3,17 (s, 3H), 1,79 (dd, J = 16,8, 7,5 Hz, 2H), 0,98 (t, J = 7,3 Hz, 3H); ESI MS(m/z):349,9 [M + 1].
181	((3-cloro-2-(pirimidin-5-il)-2H-indazol-5-il)imino)diisobutil-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,37 (s, 1H), 9,30-9,26 (m, 2H), 7,59 (dd, J = 9,2, 0,6 Hz, 1H), 7,07 (dd, J = 9,2, 1,8 Hz, 1H), 7,00 (q, J = 0,9 Hz, 1H), 3,28-3,21 (m, 4H), 2,34-2,27 (m, 2H), 1,06-1,00 (m, 12H); ESI MS(m/z):406,05 [M + 1].

184	dipropil((2-(pirimidin-5-il)-2H-pirazolo[3,4-b]piridin-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,49 (s, 2H), 9,25 (s, 1H), 9,02 (s, 1H), 8,34 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 7,57 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 3,38-3,34 (m, 4H), 1,77 (dt, J = 23,6, 7,2 Hz, 4H), 0,97 (t, J = 7,5 Hz, 6H); ESI MS(m/z):345,05 [M + 1].
185	diisobutil((2-(pirimidin-5-il)-2H-pirazolo[3,4-b]piridin-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,51 (d, J = 10,0 Hz, 2H), 9,25 (t, J = 4,9 Hz, 1H), 9,02 (d, J = 4,6 Hz, 1H), 8,34 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 7,57 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 3,35 (d, J = 6,1 Hz, 1H), 3,28 (d, J = 7,8 Hz, 1H), 2,36-2,26 (m, 2H), 1,06-0,98 (m, 12H); ESI MS(m/z):373,05 [M + 1].
186	1-óxido de 1-((2-(pirimidin-5-il)-2H-pirazolo[3,4-b]piridin-5-il)imino)tetrahidro-1H-λ ⁶ -tiofeno	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,51 (s, 2H), 9,25 (s, 1H), 9,04 (s, 1H), 8,36 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 7,52 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 3,48-

		3,42 (m, 2H), 3,35 (d, J = 7,1 Hz, 1H), 3,29 (s, 1H), 2,26-2,10 (m, 4H); ESI MS(m/z):314,85[M + 1].
187	((2-(5-fluoropiridin-3-il)-2H-pirazolo[3,4-n]piridin-5-il)imino)dimetil-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,22 (s, 1H), 9,02 (s, 1H), 8,68 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,48 (dt, J = 10,1, 2,4 Hz, 1H), 8,32 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 7,55 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 3,30 (s, 6H) ESI MS (m/z):305,905 [M + 1].
188	1-óxido de 1-((2-(5-fluoropiridin-3-il)-2H-pirazolo[3,4-b]piridin-5-il)imino)tetrahidro-1H-λ ⁶ -tiofeno	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,22 (s, 1H), 9,02 (s, 1H), 8,68 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,48 (dt, J = 10,0, 2,3 Hz, 1H), 8,35 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 7,50 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 3,48-3,41 (m, 2H), 3,34 (d, J = 7,3 Hz, 1H), 3,28 (s, 1H), 2,26-2,20 (m, 2H), 2,17-2,11 (m, 2H); ESI MS(m/z):376,9 [M + 1].

189	((3-cloro-2-(piridin-3-il)-2H-indazol-5-il)imino)dipropil-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,92 (d, J = 2,1 Hz, 1H), 8,74 (dd, J = 4,9, 1,5 Hz, 1H), 8,20-8,17 (m, 1H), 7,67 (dd, J = 7,9, 4,6 Hz, 1H), 7,56 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 7,05 (dd, J = 9,3, 2,0 Hz, 1H), 6,99 (d, J = 1,2 Hz, 1H), 3,30-3,26 (m, 4H), 1,78-1,70 (m, 4H), 0,96 (t, J = 7,5 Hz, 6H); ESI MS(m/z): 320,8 [M+1].
190	((3-cloro-2-(piridin-3-il)-2H-indazol-5-il)imino)dimetil-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,95 (d, J = 2,0 Hz, 1H), 8,76 (dd, J = 4,6, 1,5 Hz, 1H), 8,22-8,19 (m, 1H), 7,68 (dd, J = 8,2, 4,8 Hz, 1H), 7,59 (dd, J = 9,2, 0,9 Hz, 1H), 7,03 (dd, J = 9,3, 2,0 Hz, 1H), 6,99 (t, J = 1,0 Hz, 1H), 3,25 (s, 6H) ESI MS (m/z):331,9 [M + 1].
191	1-óxido de 1-((3-cloro-2-(piridin-3-il)-2H-indazol-5-	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,95-8,95

	il)imino)tetrahidro-1 <i>H</i> -λ ⁶ -tiofeno	(m, 1H), 8,76 (dd, J = 4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,21 (dq, J = 8,3, 1,4 Hz, 1H), 7,68 (ddd, J = 8,3, 4,9, 0,6 Hz, 1H), 7,60 (dd, J = 9,3, 0,8 Hz, 1H), 7,04 (dd, J = 9,3, 2,0 Hz, 1H), 6,93 (q, J = 0,9 Hz, 1H), 3,39 (td, J = 13,1, 6,6 Hz, 2H), 3,26 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,28-2,19 (m, 2H), 2,15-2,08 (m, 2H); ESI Ms(m/z):346,85 [M+1].
192	((3-cloro-2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)dipropil-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,89 (t, J = 1,4 Hz, 1H), 8,82 (d, J = 3,1 Hz, 1H), 8,30 (dt, J = 9,5, 2,3 Hz, 1H), 7,57 (dd, J = 9,2, 0,9 Hz, 1H), 7,06 (dd, J = 9,3, 2,0 Hz, 1H), 6,99 (q, J = 0,9 Hz, 1H), 3,35 (s, 1H), 3,29 (s, 3H), 1,81-1,71 (m, 4H), 0,98 (q, J = 7,5 Hz, 6H); ESI MS(m/z):394,9[M + 1].

193	etil(isopropil)((2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -pirazolo[3,4- <i>b</i>]piridin-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,49 (s, 2H), 9,25 (s, 1H), 9,01 (s, 1H), 8,38 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 7,59 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 3,62 (t, J = 6,9 Hz, 1H), 3,37 (q, J = 7,3 Hz, 2H), 1,39 (d, J = 6,7 Hz, 3H), 1,32 (d, J = 6,7 Hz, 3H), 1,26 (t, J = 7,3 Hz, 3H); ESI MS(m/z):331,05[M + 1].
194	butil((3-cloro-2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)(etil)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,89 (d, J = 1,2 Hz, 1H), 8,82 (d, J = 2,8 Hz, 1H), 8,31 (dt, J = 9,4, 2,3 Hz, 1H), 7,58 (dd, J = 9,2, 0,9 Hz, 1H), 7,07 (dd, J = 9,2, 1,8 Hz, 1H), 6,99 (q, J = 0,9 Hz, 1H), 3,36 (t, J = 7,5 Hz, 3H), 3,30 (s, 1H), 1,76-1,68 (m, 2H), 1,39 (td, J = 14,7, 7,4 Hz, 2H), 1,29-1,22 (m, 3H), 0,88 (t, J = 7,3 Hz, 3H); ESI MS(m/z):394,9[M + 1].

195	butil((3-cloro-2-(piridin-3-il)-2H-indazol-5-il)imino)(etil)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,95 (d, J = 2,0 Hz, 1H), 8,75 (dd, J = 4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,20 (dq, J = 8,2, 1,3 Hz, 1H), 7,70-7,66 (m, 1H), 7,58-7,56 (m, 1H), 7,06 (dd, J = 9,2, 1,8 Hz, 1H), 7,00 (t, J = 0,9 Hz, 1H), 3,35 (d, J = 7,6 Hz, 2H), 3,27-3,23 (m, 2H), 1,76-1,68 (m, 2H), 1,39 (td, J = 14,8, 7,5 Hz, 2H), 1,26 (t, J = 7,5 Hz, 3H), 0,88 (t, J = 7,3 Hz, 3H); ESI MS(m/z):377,1[M + 1].
196	((3-cloro-2-(piridin-3-il)-2H-indazol-5-il)imino)(etil)(isopropil)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,95 (d, J = 2,1 Hz, 1H), 8,75 (dd, J = 4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,20 (dq, J = 8,2, 1,3 Hz, 1H), 7,68 (ddd, J = 8,3, 4,9, 0,6 Hz, 1H), 7,57 (dd, J = 9,2, 0,6 Hz, 1H), 7,09 (dd, J = 9,3, 2,0 Hz, 1H), 7,02 (q, J = 0,9 Hz, 1H),

		3,60-3,54 (m, 1H), 3,35-3,32 (m, 1H), 3,29 (d, J = 7,6 Hz, 1H), 1,38 (d, J = 6,7 Hz, 3H), 1,31 (d, J = 6,7 Hz, 3H), 1,25 (t, J = 7,5 Hz, 3H); ESI MS(m/z):363[M + 1].
197	((3-cloro-2-(piridin-3-il)-2H-indazol-5-il)imino)(metil)(propil)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,95 (d, J = 2,2 Hz, 1H), 8,75 (dd, J = 4,8, 1,3 Hz, 1H), 8,20 (dq, J = 8,3, 1,3 Hz, 1H), 7,68 (dd, J = 7,8, 5,1 Hz, 1H), 7,59-7,57 (m, 1H), 7,04 (dd, J = 9,2, 2,1 Hz, 1H), 7,00 (d, J = 1,2 Hz, 1H), 3,37 (dd, J = 9,8, 6,1 Hz, 2H), 3,16 (s, 3H), 1,82-1,74 (m, 2H), 1,00-0,91 (m, 3H); ESI MS(m/z):348,95[M + 1].
198	((3-cloro-2-(piridin-3-il)-2H-indazol-5-il)imino)(isopropil)(metil)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,95 (d, J = 2,1 Hz, 1H), 8,75 (dd, J = 4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,20 (dq, J = 8,3, 1,3 Hz, 1H), 7,72-7,66 (m, 1H), 7,58 (dd,

		J = 9,2, 0,9 Hz, 1H), 7,06 (dd, J = 9,2, 2,1 Hz, 1H), 7,01 (q, J = 0,9 Hz, 1H), 3,58-3,52 (m, 1H), 3,07 (s, 3H), 1,40 (d, J = 6,7 Hz, 3H), 1,35 (d, J = 7,0 Hz, 3H) ESI MS (m/z):348,95 [M + 1].
199	((3-cloro-2-(5-fluoropiridin-3-il)-2H-indazol-5-il)imino)(etil)(isopropil)-λ ⁶ -sulfanona	¹H-NMR (400 MHz, DMSO-<i>d</i>₆) δ 8,89 (s, 1H), 8,82 (d, J = 2,8 Hz, 1H), 8,30 (dt, J = 9,4, 2,3 Hz, 1H), 7,57 (dd, J = 9,2, 0,6 Hz, 1H), 7,11 (dd, J = 9,2, 1,8 Hz, 1H), 7,01 (q, J = 0,9 Hz, 1H), 3,61-3,54 (m, 1H), 3,33 (d, J = 7,3 Hz, 1H), 3,29 (s, 1H), 1,38 (d, J = 6,7 Hz, 3H), 1,34-1,29 (m, 3H), 1,27-1,21 (m, 3H) ESI MS (m/z):380,95 [M + 1].
200	((3-cloro-2-(5-fluoropiridin-3-il)-2H-indazol-5-	¹H-NMR (400 MHz, DMSO-<i>d</i>₆) δ 8,89 (d, J = 1,2 Hz, 1H), 8,82 (d,

	il)imino)(metil)(propil)-λ ⁶ -sulfanona	J = 2,4 Hz, 1H), 8,33-8,29 (m, 1H), 7,58 (dd, J = 9,3, 0,8 Hz, 1H), 7,05 (dd, J = 9,2, 1,8 Hz, 1H), 6,99 (q, J = 0,9 Hz, 1H), 3,37 (dd J = 9,6, 6,0 Hz, 2H), 3,17 (s, 3H), 1,79 (dd, J = 16,7, 7,5 Hz, 2H), 0,98 (t, J = 7,3 Hz, 3H); ESI MS(m/z):366,95[M + 1].
201	((3-cloro-2-(pirimidin-5-il)-2H-indazol-5-il)imino)dietil-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,37 (s, 1H), 9,29 (s, 2H), 7,59 (dd, J = 9,2, 0,6 Hz, 1H), 7,09 (dd, J = 9,2, 1,8 Hz, 1H), 7,00 (d, J = 1,2 Hz, 1H), 3,36 (t, J = 7,3 Hz, 4H), 1,25 (q, J = 7,4 Hz, 6H); ESI MS(m/z):349,9[M + 1].
202	((7-cloro-2-(5-fluoropiridin-3-il)-2H-indazol-4-il)imino)dimetil-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,25 (s, 1H), 9,18 (s, 1H), 8,68 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,52 (dt, J = 10,0, 2,2 Hz, 1H), 7,25 (d, J = 7,8 Hz,

		1H), 6,56 (d, J = 7,8 Hz, 1H), 3,34 (s, 6H) ESI MS (m/z):338,85 [M + 1].
203	((3-cloro-2-(piridazin-4-il)-2H-indazol-5-il)imino)(metil)(propil)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,79 (s, 1H), 9,49 (d, J = 5,2 Hz, 1H), 8,23 (s, 1H), 7,61 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 7,07 (d, J = 8,9 Hz, 1H), 6,97 (s, 1H), 3,38 (t, J = 7,5 Hz, 2H), 3,18 (s, 3H), 1,79 (d, J = 7,0 Hz, 2H), 0,98 (t, J = 7,2 Hz, 3H) ESI MS (m/z):349,95 [M + 1].
204	((3-cloro-2-(piridazin-4-il)-2H-indazol-5-il)imino)dietyl-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,79 (q, J = 1,2 Hz, 1H), 9,49 (dd, J = 5,7, 1,1 Hz, 1H), 8,23 (q, J = 2,8 Hz, 1H), 7,60 (dd, J = 9,3, 0,8 Hz, 1H), 7,10 (dd, J = 9,3, 2,0 Hz, 1H), 6,98 (q, J = 0,9 Hz, 1H), 3,36 (q, J = 7,4 Hz, 4H), 1,26 (t, J = 7,5 Hz, 6H);

		ESI MS(m/z):350[M + 1].
205	((3-cloro-2-(piridazin-4-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)(etil)(isopropil)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,79 (q, J = 1,2 Hz, 1H), 9,49 (dd, J = 5,8, 0,9 Hz, 1H), 8,23 (q, J = 2,8 Hz, 1H), 7,59 (dd, J = 9,3, 0,8 Hz, 1H), 7,14-7,10 (m, 1H), 7,00-6,98 (m, 1H), 3,58 (td, J = 13,7, 6,8 Hz, 1H), 3,35 (d, J = 7,3 Hz, 2H), 1,41-1,37 (m, 3H), 1,34-1,30 (m, 3H), 1,29-1,20 (m, 3H) ESI MS (m/z):363,9 [M + 1].
206	((7-cloro-2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-4-il)imino)(isopropil)(metil)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,27 (s, 1H), 9,20 (s, 1H), 8,68 (d, J = 2,8 Hz, 1H), 8,55 (dt, J = 10,0, 2,4 Hz, 1H), 7,23 (d, J = 7,9 Hz, 1H), 6,59 (d, J = 7,9 Hz, 1H), 3,60 (t, J = 6,9 Hz, 1H), 3,17 (s, 3H), 1,48 (d, J = 6,7 Hz, 3H), 1,42

		(d, J = 7,0 Hz, 3H); ESI MS(m/z):366,9[M + 1].
207	dietil((2-(2-metilpirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,34 (d, J = 7,9 Hz, 2H), 8,93 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 7,57 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 7,17 (d, J = 1,2 Hz, 1H), 7,01 (dd, J = 9,2, 2,1 Hz, 1H), 3,35-3,32 (m, 2H), 3,30-3,27 (m, 2H), 2,70 (s, 3H), 1,31-1,17 (m, 6H) ESI MS (m/z):329,95 [M + 1].
208	ciclohexil(metil)((2-(2-metilpirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,35 (d, J = 14,2 Hz, 2H), 8,93 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 7,58-7,55 (m, 1H), 7,17 (q, J = 1,0 Hz, 1H), 7,01 (dd, J = 9,2, 2,1 Hz, 1H), 3,03 (s, 3H), 2,76 (d, J = 7,6 Hz, 1H), 2,70 (s, 3H), 2,10-2,04 (m, 1H), 1,64 (d, J = 12,2 Hz, 2H), 1,58-1,39 (m, 2H), 1,36-1,09 (m, 6H) ESI MS (m/z):370,0 [M + 1].

209	isopropil(metil)((2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-7-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,29 (d, J = 2,2 Hz, 1H), 9,06 (s, 1H), 8,62 (dd, J = 4,6, 1,5 Hz, 1H), 8,43 (dq, J = 8,3, 1,4 Hz, 1H), 7,63 (ddd, J = 8,3, 4,6, 0,7 Hz, 1H), 7,24 (dd, J = 8,3, 0,7 Hz, 1H), 6,92 (dd, J = 8,3, 7,1 Hz, 1H), 6,83 (dd, J = 7,2, 0,9 Hz, 1H), 3,16 (d, J = 4,9 Hz, 4H), 1,46 (d, J = 6,8 Hz, 3H), 1,40 (d, J = 6,8 Hz, 3H); ESI MS(m/z):315,0[M + 1].
210	diisobutil((2-(2-metilpirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,33 (s, 2H), 8,93 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 7,56 (d, J = 9,3 Hz, 1H), 7,16 (q, J = 0,9 Hz, 1H), 7,00 (dd, J = 9,3, 2,0 Hz, 1H), 3,28-3,15 (m, 4H), 2,70 (s, 3H), 2,32-2,24 (m, 2H), 1,03 (dd, J = 8,4, 6,7 Hz, 12H)

		ESI MS (m/z):386,2 [M + 1].
211	(2-metoxietil)(metil)((2-(2-metilpirimidin-5-il)-2H-indazol-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,34 (s, 2H), 8,94 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 7,59 (dt, J = 9,2, 0,9 Hz, 1H), 7,16 (q, J = 0,9 Hz, 1H), 7,00 (dd, J = 9,3, 2,0 Hz, 1H), 3,74 (t, J = 5,6 Hz, 2H), 3,61 (t, J = 5,4 Hz, 2H), 3,28 (s, 3H), 3,17 (s, 3H), 2,70 (s, 3H) ESI MS (m/z):346,05 [M + 1].
212	3-(5-(((2-metoxietil)(metil)(oxo)-λ ⁶ -sulfanoilideno)amino)-2H-indazol-2-il)isonicotinonitrilo	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,26 (s, 1H), 8,87 (d, J = 5,1 Hz, 1H), 8,84 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 8,12 (dd, J = 5,0, 0,6 Hz, 1H), 7,61 (d, J = 9,3 Hz, 1H), 7,21 (d, J = 1,2 Hz, 1H), 7,03 (dd, J = 9,3, 2,0 Hz, 1H), 3,74 (t, J = 5,5 Hz, 2H), 3,64 (d, J = 5,4 Hz, 2H), 3,29 (s, 3H), 3,18 (s, 3H); ESI MS(m/z): 356,0 [M+1].

213	isopropil(metil)((2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -pirazolo[4,3- <i>b</i>]piridin-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,47 (s, 2H), 9,21 (s, 1H), 9,08 (d, J = 0,6 Hz, 1H), 7,96 (dd, J = 9,2, 0,9 Hz, 1H), 6,81 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 3,82 (t, J = 6,9 Hz, 1H), 3,36 (s, 3H), 1,39 (dd, J = 11,9, 7,0 Hz, 6H); ESI MS (m/z):317,00[M + 1].
214	butil(etil)((2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -pirazolo[4,3- <i>b</i>]piridin-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,27 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 9,01 (d, J = 0,6 Hz, 1H), 8,60 (dd, J = 4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,41 (dq, J = 8,5, 1,4 Hz, 1H), 7,94 (dd, J = 9,2, 0,6 Hz, 1H), 7,62-7,58 (m, 1H), 6,79 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 3,62-3,53 (m, 4H), 1,76-1,66 (m, 2H), 1,41 (q, J = 7,2 Hz, 2H), 1,28 (t, J = 7,3 Hz, 3H), 0,89 (t, J = 7,3 Hz, 3H); ESI MS (m/z):344,05[M + 1].

215	diisobutil((2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -pirazolo[4,3- <i>b</i>]piridin-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,28 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 9,02 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 8,59 (dd, J = 4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,42 (dq, J = 8,3, 1,4 Hz, 1H), 7,94 (dd, J = 9,2, 0,9 Hz, 1H), 7,61-7,58 (m, 1H), 6,79 (d, J = 9,5 Hz, 1H), 3,60 (dd, J = 13,9, 6,3 Hz, 2H), 3,42 (dd, J = 14,1, 6,4 Hz, 2H), 2,34-2,27 (m, 2H), 1,05-0,97 (m, 12H); ESI MS (m/z):356,10 [M + 1].
216	ciclohexil(metil)((2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -pirazolo[4,3- <i>b</i>]piridin-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,27 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 9,03 (d, J = 0,6 Hz, 1H), 8,60 (dd, J = 4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,42 (dq, J = 8,3, 1,4 Hz, 1H), 7,94 (dd, J = 9,3, 0,8 Hz, 1H), 7,62-7,59 (m, 1H), 6,78 (d, J = 9,5 Hz, 1H), 3,57-3,51 (m, 1H), 3,36 (s, 3H), 2,23 (d, J = 12,2 Hz, 1H), 2,14

		(d, J = 12,5 Hz, 1H), 1,87 (d, J = 7,9 Hz, 2H), 1,67 (d, J = 12,5 Hz, 1H), 1,58-1,47 (m, 2H), 1,35-1,27 (m, 2H), 1,24-1,16 (m, 1H); ESI MS (m/z):356,10 [M + 1].
217	((7-cloro-2-(piridin-3-il)-2H-indazol-4-il)imino)dimetil-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,32 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 9,11 (s, 1H), 8,64 (dd, J = 4,6, 1,2 Hz, 1H), 8,50 (dq, J = 8,3, 1,4 Hz, 1H), 7,64-7,60 (m, 1H), 7,24 (d, J = 7,8 Hz, 1H), 6,56 (d, J = 7,8 Hz, 1H), 3,33 (s, 6H); ESI MS(m/z):320,85[M + 1].
218	((7-cloro-2-(piridin-3-il)-2H-indazol-4-il)imino)(isopropil)(metil)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,34 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 9,12 (d, J = 11,7 Hz, 1H), 8,65 (dd, J = 4,6, 1,5 Hz, 1H), 8,51 (dq, J = 8,3, 1,4 Hz, 1H), 7,64-7,61 (m, 1H), 7,22 (d, J = 7,8 Hz, 1H), 6,59 (d, J = 7,6 Hz, 1H), 3,63-3,56 (m, 1H), 3,16 (s,

		3H), 1,47 (d, J = 6,8 Hz, 3H), 1,41 (d, J = 6,6 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 348,9 [M+1].
219	dietil((2-(pirimidin-5-il)-2H-pirazolo[4,3-b]piridin-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,46 (s, 2H), 9,21 (s, 1H), 9,07 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 7,96 (dd, J = 9,3, 1,0 Hz, 1H), 6,82 (d, J = 9,3 Hz, 1H), 3,58 (q, J = 7,3 Hz, 4H), 1,28 (t, J = 7,5 Hz, 6H); ESI MS (m/z):317,00 [M + 1].
220	butil(etil)((2-(pirimidin-5-il)-2H-pirazolo[4,3-b]piridin-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,47 (s, 2H), 9,21 (s, 1H), 9,07 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 7,96 (dd, J = 9,2, 0,9 Hz, 1H), 6,81 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 3,62-3,54 (m, 4H), 1,78-1,65 (m, 2H), 1,45-1,38 (m, 2H), 1,28 (t, J = 7,3 Hz, 3H), 0,89 (t, J = 7,3 Hz, 3H); ESI MS (m/z):345,10 [M + 1].
221	diisobutil((2-(pirimidin-5-il)-2H-pirazolo[4,3-b]piridin-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,47 (s, 2H), 9,20 (s, 1H), 9,07

		(d, J = 0,7 Hz, 1H), 7,96 (dd, J = 9,2, 0,9 Hz, 1H), 6,81 (d, J = 9,3 Hz, 1H), 3,61 (dd, J = 13,9, 6,4 Hz, 2H), 3,42 (dd, J = 13,9, 6,4 Hz, 2H), 2,36-2,26 (m, 2H), 1,08-1,02 (m, 12H) ESI MS (m/z): 373,15 [M+1].
222	metil(propil)((2-(pirimidin-5-il)-2H-pirazolo[4,3-b]piridin-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹H-NMR (400 MHz, DMSO-<i>d</i>₆) δ 9,43-9,51 (2H), 9,18-9,24 (1H), 9,05-9,12 (1H), 7,92-8,01 (1H), 6,75-6,85 (1H), 3,48-3,66 (2H), 3,35-3,43 (3H), 1,66-1,91 (2H), 0,93-1,07 (3H) ESI MS (m/z): 317,00 [M+1].
223	ciclohexil(metil)((2-(pirimidin-5-il)-2H-pirazolo[4,3-b]piridin-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹H-NMR (400 MHz, DMSO-<i>d</i>₆) δ 9,47 (s, 2H), 9,21 (s, 1H), 9,09 (d, J = 0,6 Hz, 1H), 7,96 (dd, J = 9,3, 0,8 Hz, 1H), 6,80 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 3,58-3,52 (m, 1H), 3,36 (s, 3H), 2,18 (dd,

		J = 34,4, 12,4 Hz, 2H), 1,86 (s, 2H), 1,67 (d, J = 11,9 Hz, 1H), 1,56-1,48 (m, 2H), 1,34-1,16 (m, 3H); ESI MS (m/z):357,10 [M + 1].
224	dimetil((2-(piridin-3-il)-2H-pirazolo[4,3-b]piridin-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,27 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 9,03 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 8,60 (dd, J = 4,6, 1,5 Hz, 1H), 8,41 (dq, J = 8,3, 1,4 Hz, 1H), 7,96 (dd, J = 9,3, 1,0 Hz, 1H), 7,61 (ddd, J = 8,4, 4,7, 0,6 Hz, 1H), 6,76 (d, J = 9,3 Hz, 1H), 3,43 (s, 6H); ESI MS (m/z):287,95 [M + 1].
229	dimetil((2-(piridin-3-il)-6-(trifluorometil)-2H-indazol-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,29 (d, J = 2,2 Hz, 1H), 9,08 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 8,66 (dd, J = 4,8, 1,3 Hz, 1H), 8,44 (dq, J = 8,3, 1,4 Hz, 1H), 8,08 (s, 1H), 7,65 (ddd, J = 8,3, 4,8, 0,6 Hz, 1H), 7,46 (s,

		1H), 3,22 (s, 6H); ESI MS(m/z):355,0 [M + 1].
232	dimetil((2-(piridin-3-il)-2H-pirazolo[3,4-c]piridin-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, CLOROFORMO-D) δ 9,19 (d, J = 2,8 Hz, 1H), 9,17 (s, 1H), 8,71 (dd, J = 4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,34 (d, J = 0,6 Hz, 1H), 8,29 (dq, J = 8,3, 1,3 Hz, 1H), 7,52 (q, J = 4,2 Hz, 1H), 7,01 (d, J = 1,2 Hz, 1H), 3,40 (s, 6H) ESI MS (m/z): 288,0 [M+1].
233	diisobutil((2-(piridin-3-il)-2H-indazol-7-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 9,28 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 9,04 (s, 1H), 8,62 (dd, J = 4,6, 1,2 Hz, 1H), 8,43-8,40 (m, 1H), 7,63 (dd, J = 8,4, 4,8 Hz, 1H), 7,22 (d, J = 8,3 Hz, 1H), 6,93-6,90 (m, 1H), 6,81 (d, J = 7,1 Hz, 1H), 3,39 (dd, J = 14,2, 6,1 Hz, 2H), 3,30-3,26 (m, 2H), 2,35 (d, J = 6,6 Hz, 2H), 1,05 (q, J = 6,5 Hz,

		12H); ESI MS(m/z):371,10 [M + 1].
234	(2-metoxietil)(metil)((2-(piridin-3-il)-6-(trifluorometil)-2H-indazol-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, CLOROFORMO-D) δ 9,17 (d, J = 2,2 Hz, 1H), 8,68 (d, J = 3,7 Hz, 1H), 8,32 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 8,25 (dq, J = 8,3, 1,3 Hz, 1H), 8,14 (s, 1H), 7,60 (s, 1H), 7,50 (q, J = 4,2 Hz, 1H), 3,97-3,92 (m, 1H), 3,88-3,81 (m, 1H), 3,45 (t, J = 5,0 Hz, 2H), 3,41-3,39 (m, 3H), 3,15 (s, 3H) ESI MS (m/z):399,10 [M + 1].
235	isopropil(metil)((2-(piridin-3-il)-2H-pirazolo[3,4-c]piridin-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, cloroformo-D) δ 9,19 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 9,15 (s, 1H), 8,70 (dd, J = 4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,31 (d, J = 0,6 Hz, 1H), 8,28 (dq, J = 8,3, 1,3 Hz, 1H), 7,51 (dd, J = 8,3, 4,9 Hz, 1H), 7,02 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 3,80-3,73 (m, 1H), 3,22 (s,

		3H), 1,57 (dd, J = 12,4, 5,3 Hz, 3H), 1,52 (d, J = 7,0 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 316,1 [M+1].
236	(2-metoxietil)(metil)((2-(piridin-3-il)-2H-pirazolo[4,3-b]piridin-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,27 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 9,04 (d, J = 0,6 Hz, 1H), 8,60 (dd, J = 4,6, 1,2 Hz, 1H), 8,41 (dq, J = 8,4, 1,3 Hz, 1H), 7,97 (dd, J = 9,2, 0,6 Hz, 1H), 7,60 (dd, J = 8,6, 4,9 Hz, 1H), 6,79 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 3,97-3,85 (m, 2H), 3,83-3,75 (m, 2H), 3,37 (s, 3H), 3,31 (s, 3H) ESI MS (m/z): 332,00 [M+1].
237	(2-metoxietil)(metil)((2-(pirimidin-5-il)-2H-pirazolo[4,3-b]piridin-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,47 (s, 2H), 9,21 (s, 1H), 9,09 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 7,99 (dd, J = 9,2, 0,6 Hz, 1H), 6,82 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 3,98-3,85 (m, 2H), 3,84-3,77 (m, 2H), 3,37 (s,

		3H), 3,31 (s, 3H); ESI MS (m/z): 333,00 [M+1].
238	isopropil(metil)((2-(piridin-3-il)-2H-pirazolo[4,3-b]piridin-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,27 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 9,03 (s, 1H), 8,60 (dd, J = 4,6, 1,2 Hz, 1H), 8,41 (dq, J = 8,4, 1,3 Hz, 1H), 7,95 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 7,60 (dd, J = 8,4, 4,7 Hz, 1H), 6,79 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 3,86-3,79 (m, 1H), 3,37 (d, J = 8,9 Hz, 3H), 1,41-1,31 (m, 6H); ESI MS (m/z): 316,00 [M+1].
239	metil(propil)((2-(piridin-3-il)-2H-pirazolo[4,3-b]piridin-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,27 (d, J = 2,8 Hz, 1H), 9,03 (d, J = 0,6 Hz, 1H), 8,60 (dd, J = 4,6, 1,2 Hz, 1H), 8,42 (dq, J = 8,3, 1,4 Hz, 1H), 7,95 (dd, J = 9,2, 0,6 Hz, 1H), 7,60 (q, J = 4,3 Hz, 1H), 6,77 (d, J = 9,5 Hz, 1H), 3,59-3,54 (m, 2H), 3,38 (s, 3H), 1,83-1,76 (m, 2H), 1,00 (t, J = 7,5 Hz,

		3H); ESI MS (m/z): 316,05 [M+1].
240	etil(isopropil)((2-(piridin-3-il)- 2 <i>H</i> -pirazolo[4,3- <i>b</i>]piridin-5- il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,27 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 9,01 (s, 1H), 8,59 (dd, J = 4,6, 1,2 Hz, 1H), 8,41 (dq, J = 8,3, 1,3 Hz, 1H), 7,94 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 7,60 (dd, J = 8,3, 4,9 Hz, 1H), 6,81 (d, J = 9,5 Hz, 1H), 3,94-3,87 (m, 1H), 3,69-3,59 (m, 2H), 1,37 (dd, J = 9,2, 7,0 Hz, 6H), 1,28 (t, J = 7,3 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 330,05 [M+1].
241	etil(isopropil)((2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -pirazolo[4,3- <i>b</i>]piridin-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,46 (s, 2H), 9,21 (s, 1H), 9,06 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 7,96 (dd, J = 9,2, 0,9 Hz, 1H), 6,83 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 3,90 (t, J = 6,9 Hz, 1H), 3,64 (qd, J = 7,2, 4,5 Hz, 2H), 1,37 (dd, J = 8,6, 6,7 Hz, 6H), 1,28 (t, J = 7,3 Hz, 3H);

		ESI MS (m/z): 331,00 [M+1].
242	dimetil((2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -pirazolo[3,4- <i>c</i>]piridin-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,54 (s, 2H), 9,29 (s, 1H), 9,10 (t, J = 1,1 Hz, 1H), 9,08 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 6,81 (d, J = 1,2 Hz, 1H), 3,36 (s, 6H); ESI MS (m/z): 288,9 [M+1].
243	((2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -pirazolo[3,4- <i>c</i>]piridin-5-il)imino)dimetil-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,25 (s, 1H), 9,07 (dd, J = 10,0, 1,0 Hz, 2H), 8,72 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,51 (dt, J = 9,9, 2,3 Hz, 1H), 6,79 (d, J = 1,5 Hz, 1H), 3,36 (s, 6H) ESI MS (m/z): 305,9 [M + 1].
244	((2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -pirazolo[3,4- <i>c</i>]piridin-5-il)imino)(isopropil)(metil)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,25 (s, 1H), 9,07 (dd, J = 5,1, 1,0 Hz, 2H), 8,72 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,53 (dt, J = 9,9, 2,3 Hz, 1H), 6,83 (d, J = 1,5 Hz, 1H), 3,70 (t, J = 6,8 Hz, 1H), 3,24 (s, 3H), 1,41 (d,

		J = 6,8 Hz, 3H), 1,36 (d, J = 6,8 Hz, 3H) ESI MS (m/z):334,15 [M + 1].
245	dietil((2-(5-fluoropiridin-3-il)-2H-pirazolo[3,4-c]piridin-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,25 (s, 1H), 9,06 (s, 2H), 8,72 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 8,52 (dt, J = 9,9, 2,3 Hz, 1H), 6,83 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 3,52-3,41 (m, 4H), 1,29-1,22 (m, 6H) ESI MS (m/z):334,15 [M + 1].
246	((2-(5-fluoropiridin-3-il)-2H-pirazolo[3,4-c]piridin-5-il)imino)(metil)(propil)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) ¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,25 (s, 1H), 9,08-9,06 (m, 2H), 8,72 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,52 (dt, J = 9,9, 2,3 Hz, 1H), 6,80 (d, J = 1,5 Hz, 1H), 3,49 (t, J = 7,9 Hz, 2H), 3,31 (s, 3H), 1,84-1,73 (m, 2H), 0,99 (t, J = 7,5 Hz, 3H); ESI MS(m/z): 334,15 [M+1].
247	1-óxido de 1-((2-(5-fluoropiridin-3-il)-2H-	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,26 (s,

	pirazolo[3,4-c]piridin-5-il)imino)tetrahidro-1 <i>H</i> -λ ⁶ -tiofeno	1H), 9,10-9,08 (m, 2H), 8,73 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,53 (dt, J = 9,8, 2,3 Hz, 1H), 6,85 (d, J = 1,5 Hz, 1H), 3,56-3,49 (m, 2H), 3,35 (d, J = 6,7 Hz, 1H), 3,30 (d, J = 7,3 Hz, 1H), 2,24-2,06 (m, 4H) ESI MS (m/z):331,9 [M + 1].
248	etil(metil)((2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -pirazolo[4,3-b]piridin-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,27 (d, J = 2,8 Hz, 1H), 9,03 (d, J = 0,6 Hz, 1H), 8,60 (dd, J = 4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,41 (dq, J = 8,3, 1,4 Hz, 1H), 7,95 (dd, J = 9,2, 0,6 Hz, 1H), 7,60 (dd, J = 8,4, 4,7 Hz, 1H), 6,78 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 3,60 (q, J = 7,4 Hz, 2H), 3,36 (s, 3H), 1,31 (t, J = 7,5 Hz, 3H) ESI MS (m/z):301,910 [M + 1].
249	dietil((2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -pirazolo[4,3-b]piridin-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,27 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 9,02 (d,

		J = 0,6 Hz, 1H), 8,60 (dd, J = 4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,41 (dq, J = 8,4, 1,3 Hz, 1H), 7,95 (dd, J = 9,3, 0,8 Hz, 1H), 7,60 (dd, J = 8,4, 4,7 Hz, 1H), 6,79 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 3,57 (q, J = 7,4 Hz, 4H), 1,28 (t, J = 7,3 Hz, 6H); ESI MS (m/z): 315,9 [M+1].
250	1-óxido de 1-((2-(piridin-3-il)-2H-pirazolo[4,3-b]piridin-5-il)imino)tetrahidro-1H-λ ⁶ -tiofeno	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,28 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 9,06 (d, J = 0,6 Hz, 1H), 8,60 (dd, J = 4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,43 (dq, J = 8,5, 1,4 Hz, 1H), 7,98 (dd, J = 9,2, 0,6 Hz, 1H), 7,61 (q, J = 4,3 Hz, 1H), 6,83 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 3,67-3,60 (m, 2H), 3,35 (q, J = 6,7 Hz, 2H), 2,24-2,19 (m, 2H), 2,15-2,10 (m, 2H); ESI MS (m/z): 313,9 [M+1].
251	isopropil(metil)((2-(pirimidin-5-il)-2H-pirazolo[3,4-c]piridin-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,54 (s, 2H), 9,29 (s, 1H), 9,10-

		9,09 (m, 2H), 6,84 (d, J = 1,5 Hz, 1H), 3,74-3,67 (m, 1H), 3,25 (s, 3H), 1,41 (d, J = 7,0 Hz, 3H), 1,36 (d, J = 6,7 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 317 [M+1].
252	metil(propil)((2-(pirimidin-5-il)-2H-pirazolo[3,4-c]piridin-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,54 (d, J = 3,1 Hz, 2H), 9,30 (d, J = 10,7 Hz, 1H), 9,09 (dd, J = 5,0, 1,1 Hz, 2H), 6,82 (d, J = 1,5 Hz, 1H), 3,51-3,46 (m, 2H), 3,29 (s, 3H), 1,84-1,73 (m, 2H), 1,01-0,96 (m, 3H); ESI MS (m/z): 317,05 [M+1].
253	dimetil((2-(pirimidin-5-il)-6-(trifluorometil)-2H-indazol-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,50 (s, 2H), 9,28 (s, 1H), 9,14 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 8,11 (s, 1H), 7,46 (s, 1H), 3,24 (d, J = 4,9 Hz, 6H); ESI MS (m/z): 355,85 [M+1].
254	isopropil(propil)((2-(piridin-3-il)-2H-pirazolo[4,3-b]piridin-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,27 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 9,02 (d,

		J = 0,9 Hz, 1H), 8,59 (dd, J = 4,6, 1,2 Hz, 1H), 8,41 (dq, J = 8,3, 1,4 Hz, 1H), 7,94 (dd, J = 9,2, 0,6 Hz, 1H), 7,60 (dd, J = 8,4, 4,7 Hz, 1H), 6,80 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 3,97-3,90 (m, 1H), 3,63-3,49 (m, 2H), 1,85-1,69 (m, 2H), 1,37 (dd, J = 8,9, 7,0 Hz, 6H), 0,99 (t, J = 7,3 Hz, 3H) ESI MS (m/z): 344,05 [M + 1].
255	diisopropil((2-(piridin-3-il)-2H-pirazolo[4,3-b]piridin-5-il)imino)-λ⁶-sulfanona	¹H-NMR (400 MHz, DMSO-<i>d</i>₆) δ 9,27 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 9,00 (d, J = 0,6 Hz, 1H), 8,59 (dd, J = 4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,42 (dq, J = 8,3, 1,4 Hz, 1H), 7,93 (dd, J = 9,2, 0,9 Hz, 1H), 7,60 (dd, J = 8,4, 4,7 Hz, 1H), 6,85 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 3,97-3,91 (m, 2H), 1,40 (q, J = 7,1 Hz, 12H); ESI MS (m/z): 344,05 [M+1].

256	isopropil(propil)((2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,26 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,91 (d, J = 0,6 Hz, 1H), 8,60 (dd, J = 4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,40 (dq, J = 8,4, 1,3 Hz, 1H), 7,62-7,59 (m, 1H), 7,55 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 7,17 (t, J = 0,9 Hz, 1H), 7,02 (dd, J = 9,2, 2,1 Hz, 1H), 3,56-3,49 (m, 1H), 3,28-3,21 (m, 2H), 1,78-1,69 (m, 2H), 1,37 (d, J = 7,0 Hz, 3H), 1,30 (d, J = 7,0 Hz, 3H), 0,96 (td, J = 7,3, 3,4 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 343,1 [M+1].
257	isopropil(propil)((2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,47 (s, 2H), 9,21 (s, 1H), 8,97 (s, 1H), 7,57 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 7,18 (d, J = 1,2 Hz, 1H), 7,04 (dd, J = 9,2, 2,1 Hz, 1H), 3,53 (t, J = 6,7 Hz, 1H), 3,25 (dd, J = 16,0, 7,5 Hz, 2H), 1,74 (q, J = 7,7 Hz, 2H), 1,37 (d,

		J = 6,7 Hz, 3H), 1,30 (d, J = 6,7 Hz, 3H), 0,95 (t, J = 7,5 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 344,1 [M+1].
258	((2-(5-fluoropiridin-3-il)-2H-indazol-5-il)imino)(isopropil)(propil)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,19 (s, 1H), 8,95 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 8,63 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,41 (dt, J = 10,2, 2,4 Hz, 1H), 7,55 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 7,16 (t, J = 0,9 Hz, 1H), 7,03 (dd, J = 9,2, 2,1 Hz, 1H), 3,56-3,49 (m, 1H), 3,25-3,21 (m, 2H), 1,79-1,69 (m, 2H), 1,36 (t, J = 6,7 Hz, 3H), 1,31 (t, J = 6,4 Hz, 3H), 0,97-0,93 (m, 3H); ESI MS (m/z): 360,95 [M+1].
259	((4-cloro-2-(pirimidin-5-il)-2H-indazol-5-il)imino)dietyl-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,54 (s, 2H), 9,24 (s, 1H), 9,14 (d, J = 0,6 Hz, 1H), 7,59 (dd, J = 9,2, 0,9 Hz, 1H), 7,38 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 3,34 (d, J = 7,3 Hz, 2H), 3,29 (d, J = 7,0 Hz, 2H), 1,29 (t, J = 7,3 Hz, 6H);

		ESI MS (m/z): 349,80 [M+1].
260	((4-cloro-2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)(etil)(isopropil)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,53 (s, 2H), 9,23 (s, 1H), 9,13 (s, 1H), 7,57 (d, J = 8,3 Hz, 1H), 7,41 (d, J = 9,0 Hz, 1H), 3,57-3,50 (m, 1H), 3,29-3,27 (m, 2H), 1,40 (d, J = 6,6 Hz, 3H), 1,32 (d, J = 6,8 Hz, 3H), 1,26 (t, J = 7,5 Hz, 3H) ESI MS (m/z): 363,90 [M+1].
261	((4-cloro-2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)(metil)(propil)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,54 (s, 2H), 9,24 (s, 1H), 9,15 (s, 1H), 7,60 (d, J = 9,0 Hz, 1H), 7,36 (d, J = 9,3 Hz, 1H), 3,36 (dd, J = 9,7, 6,2 Hz, 2H), 3,16 (s, 3H), 1,87-1,79 (m, 2H), 0,99 (t, J = 7,5 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 349,80 [M+1].
262	((4-cloro-2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)(2-	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,54 (s, 2H), 9,24 (s, 1H), 9,17

	metoxietil)(metil)- λ^6 -sulfanona	(d, J = 0,7 Hz, 1H), 7,61 (dd, J = 9,2, 0,9 Hz, 1H), 7,36 (d, J = 9,0 Hz, 1H), 3,85-3,80 (m, 1H), 3,77-3,72 (m, 1H), 3,69-3,56 (m, 2H), 3,29 (s, 3H), 3,19 (s, 3H); ESI MS (m/z): 366,00 [M+1].
263	((4-cloro-2-(pirimidin-5-il)-2H-indazol-5-il)imino)dimetil- λ^6 -sulfanona	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9,54 (s, 2H), 9,24 (s, 1H), 9,16 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 7,61 (dd, J = 8,9, 0,9 Hz, 1H), 7,34 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 3,25 (s, 6H); ESI MS (m/z): 321,80 [M+1].
264	dietil((2-(piridin-3-il)-6-(trifluorometil)-2H-indazol-5-il)imino)- λ^6 -sulfanona	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) d 9,28 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 9,05 (s, 1H), 8,66 (dd, J = 4,8, 1,3 Hz, 1H), 8,45-8,42 (m, 1H), 8,08 (s, 1H), 7,65 (dd, J = 8,4, 5,0 Hz, 1H), 7,45 (s, 1H), 3,35 (q, J = 7,4 Hz, 4H), 1,26 (t, J = 7,5 Hz, 6H); ESI MS (m/z): 382,85 [M+1].

265	etil(isopropil)((2-(piridin-3-il)-6-(trifluorometil)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,28 (d, J = 2,2 Hz, 1H), 9,04 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 8,66 (dd, J = 4,8, 1,3 Hz, 1H), 8,43 (dq, J = 8,4, 1,3 Hz, 1H), 8,08 (s, 1H), 7,65 (q, J = 4,6 Hz, 1H), 7,46 (s, 1H), 3,57 (q, J = 6,8 Hz, 1H), 3,36 (dd, J = 15,4, 7,3 Hz, 2H), 1,36 (q, J = 6,7 Hz, 6H), 1,27-1,21 (m, 3H) ESI MS (m/z): 397,05 [M + 1].
266	etil(isopropil)((2-(pirimidin-5-il)-6-(trifluorometil)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,49 (s, 2H), 9,27 (s, 1H), 9,10 (s, 1H), 8,10 (s, 1H), 7,46 (s, 1H), 3,62-3,55 (m, 1H), 3,37 (q, J = 7,5 Hz, 2H), 1,36 (q, J = 6,7 Hz, 6H), 1,27-1,22 (m, 4H); ESI MS (m/z): 397,95 [M+1].
267	(3-fluorofenil)(metil)((2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -pirazolo[4,3- <i>b</i>]piridin-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,31 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 9,21 (s, 1H), 8,64 (dd, J = 4,6,

		1,2 Hz, 1H), 8,45 (dq, J = 8,4, 1,3 Hz, 1H), 8,14 (d, J = 8,9 Hz, 1H), 7,69 (dd, J = 7,9, 2,8 Hz, 1H), 7,64 (dd, J = 7,9, 5,2 Hz, 3H), 7,49-7,47 (m, 1H), 6,91 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 3,38-3,39 (3H); ESI MS (m/z): 367,95 [M+1].
268	etil((2-(5-fluoropiridin-3-il)-6-(trifluorometil)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)(isopropil)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,21 (s, 1H), 9,08 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 8,70 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,46 (dt, J = 10,0, 2,3 Hz, 1H), 8,08 (s, 1H), 7,44 (s, 1H), 3,58 (t, J = 6,7 Hz, 1H), 3,36 (t, J = 7,6 Hz, 2H), 1,36 (q, J = 6,7 Hz, 6H), 1,23 (t, J = 7,5 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 415 [M+1].
269	dietil((2-(5-fluoropiridin-3-il)-6-(trifluorometil)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,21 (s, 1H), 9,09 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 8,70 (d, J = 2,2 Hz, 1H), 8,46 (dt, J = 9,9, 2,3 Hz, 1H), 8,08 (s, 1H), 7,43 (s, 1H), 3,36

		(q, J = 7,3 Hz, 4H), 1,26 (t, J = 7,3 Hz, 6H); ESI MS (m/z): 401,05 [M+1].
270	((2-(5-fluoropiridin-3-il)-6-(trifluorometil)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)dimetil-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,22 (s, 1H), 9,12 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 8,71 (d, J = 2,2 Hz, 1H), 8,47 (dt, J = 9,9, 2,3 Hz, 1H), 8,09 (s, 1H), 7,44 (s, 1H), 3,23 (s, 6H); ESI MS (m/z): 373 [M+1].
271	dipropil((2-(piridin-3-il)-7-(trifluorometil)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,26 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 9,13 (s, 1H), 8,66 (dd, J = 4,6, 1,5 Hz, 1H), 8,42 (dq, J = 8,3, 1,4 Hz, 1H), 7,65 (dd, J = 8,3, 5,4 Hz, 1H), 7,46 (s, 1H), 7,33 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 3,33 (d, J = 6,1 Hz, 2H), 3,30 (s, 2H), 1,80-1,72 (m, 4H), 0,97 (t, J = 7,5 Hz, 6H); ESI MS (m/z): 411 [M+1].
272	dimetil((2-(piridin-3-il)-7-(trifluorometil)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,27 (d, J = 2,2 Hz, 1H), 9,14 (s,

		1H), 8,66 (dd, J = 4,8, 1,3 Hz, 1H), 8,43 (dq, J = 8,3, 1,4 Hz, 1H), 7,65 (dd, J = 8,3, 4,6 Hz, 1H), 7,47 (d, J = 1,2 Hz, 1H), 7,31 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 3,27 (s, 6H); ESI MS (m/z): 354,85 [M+1].
273	dimetil((3-metil-2-(piridin-3-il)-2H-indazol-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,89 (s, 1H), 8,70 (d, J = 4,6 Hz, 1H), 8,12 (dt, J = 8,2, 1,2 Hz, 1H), 7,64 (dd, J = 7,5, 4,7 Hz, 1H), 7,47 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 7,10 (s, 1H), 6,96 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 3,21 (dd, J = 17,3, 16,0 Hz, 6H), 2,59 (s, 3H) ESI MS (m/z):301,05 [M + 1].
274	dipropil((2-(piridin-3-il)-6-(trifluorometil)-2H-indazol-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,28 (d, J = 2,2 Hz, 1H), 9,05 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 8,66 (dd, J = 4,6, 1,5 Hz, 1H), 8,44 (dq, J = 8,3, 1,4 Hz, 1H), 8,08 (s,

		1H), 7,66-7,63 (m, 1H), 7,45 (s, 1H), 3,33 (d, J = 7,6 Hz, 2H), 3,28 (s, 2H), 1,81-1,71 (m, 4H), 0,96 (t, J = 7,5 Hz, 6H); ESI MS (m/z): 410,95 [M+1].
275	((2-(5-fluoropiridin-3-il)-6-(trifluorometil)-2H-indazol-5-il)imino)dipropil-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,21 (s, 1H), 9,09 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 8,70 (d, J = 2,2 Hz, 1H), 8,46 (dt, J = 10,0, 2,3 Hz, 1H), 8,08 (s, 1H), 7,43 (s, 1H), 3,33 (s, 2H), 3,28 (d, J = 7,1 Hz, 2H), 1,81-1,71 (m, 4H), 0,96 (t, J = 7,3 Hz, 6H) ESI MS (m/z): 428,95 [M + 1].
276	etil(isopropil)((3-metil-2-(piridin-3-il)-2H-indazol-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,90 (s, 1H), 8,70 (d, J = 4,6 Hz, 1H), 8,13 (d, J = 6,7 Hz, 1H), 7,64 (dd, J = 7,6, 4,3 Hz, 1H), 7,46 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 7,11 (s, 1H), 7,03 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 3,56-3,49 (m, 1H),

		3,26 (t, J = 7,3 Hz, 2H), 2,62 (d, J = 30,3 Hz, 3H), 1,38-1,22 (m, 9H); ESI MS (m/z): 343,15 [M+1].
277	isopropil((3-metil-2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)(propil) -λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,89 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,69 (dd, J = 4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,14-8,11 (m, 1H), 7,63 (dd, J = 8,1, 4,7 Hz, 1H), 7,45 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 7,11 (d, J = 1,2 Hz, 1H), 7,02 (dd, J = 9,2, 1,8 Hz, 1H), 3,54-3,47 (m, 1H), 3,26-3,19 (m, 2H), 2,58 (s, 3H), 1,74 (dt, J = 23,1, 7,4 Hz, 2H), 1,37 (d, J = 6,7 Hz, 3H), 1,31 (d, J = 7,0 Hz, 3H), 0,97 (t, J = 7,2 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 357,05[M+1].
278	dipropil((2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -pirazolo[3,4- <i>c</i>]piridin-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,53 (s, 2H), 9,29 (s, 1H), 9,08-9,07 (m, 2H), 6,83 (d, J = 1,2 Hz, 1H), 3,48-3,41 (m, 4H), 1,84-1,68 (m,

		4H), 0,98 (t, J = 7,5 Hz, 6H) ESI MS (m/z):345,15 [M + 1].
279	((2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -pirazolo[3,4- <i>c</i>]piridin-5-il)imino)dipropil-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,25 (s, 1H), 9,07-9,05 (m, 2H), 8,72 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,52 (dt, J = 9,9, 2,4 Hz, 1H), 6,81 (d, J = 1,2 Hz, 1H), 3,48-3,40 (m, 4H), 1,84-1,68 (m, 4H), 0,98 (t, J = 7,3 Hz, 6H); ESI MS (m/z): 362,1 [M+1].
280	diisopropil((3-metil-2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,89 (d, J = 2,1 Hz, 1H), 8,69 (dd, J = 4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,13 (dq, J = 8,1, 1,4 Hz, 1H), 7,65-7,61 (m, 1H), 7,43 (dd, J = 9,0, 0,8 Hz, 1H), 7,12-7,08 (m, 2H), 3,62-3,56 (m, 2H), 2,57 (s, 3H), 1,34 (d, J = 7,0 Hz, 6H), 1,27 (d, J = 6,7 Hz, 6H); ESI Ms (m/z): 357,05 [M+1].

281	((3-metil-2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)dipropil-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,89 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,70 (dd, J = 4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,13 (dq, J = 8,3, 1,4 Hz, 1H), 7,65-7,62 (m, 1H), 7,46 (dd, J = 9,2, 0,6 Hz, 1H), 7,09 (t, J = 0,9 Hz, 1H), 6,99 (dd, J = 9,2, 1,8 Hz, 1H), 3,28-3,24 (m, 4H), 2,58 (s, 3H), 1,79-1,71 (m, 4H), 0,96 (t, J = 7,3 Hz, 6H) ESI MS (m/z):357,10 [M + 1].
282	dietil((3-metil-2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,89 (d, J = 2,1 Hz, 1H), 8,70 (dd, J = 4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,14-8,11 (m, 1H), 7,64 (dd, J = 8,1, 4,7 Hz, 1H), 7,46 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 7,11 (d, J = 1,2 Hz, 1H), 7,00 (dd, J = 9,0, 2,0 Hz, 1H), 3,34-3,25 (m, 4H), 2,58 (s, 3H), 1,26 (t, J = 7,5 Hz, 6H); ESI Ms (m/z): 328,9 [M+1].

283	isopropil(metil)((3-metil-2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,89 (d, J = 2,1 Hz, 1H), 8,70 (dd, J = 4,6, 1,5 Hz, 1H), 8,13 (dq, J = 8,1, 1,4 Hz, 1H), 7,64 (dd, J = 8,1, 4,7 Hz, 1H), 7,47 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 7,11 (d, J = 1,2 Hz, 1H), 7,00 (dd, J = 9,0, 2,0 Hz, 1H), 3,50 (t, J = 6,9 Hz, 1H), 3,02 (s, 3H), 2,59 (s, 3H), 1,37 (dd, J = 19,7, 6,9 Hz, 6H); ESI MS (m/z): 328,9 [M+1].
284	etil(metil)((3-metil-2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,89 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,70 (dd, J = 4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,13 (dq, J = 8,1, 1,4 Hz, 1H), 7,64 (dd, J = 8,3, 4,9 Hz, 1H), 7,48-7,46 (m, 1H), 7,10 (d, J = 1,2 Hz, 1H), 6,98 (dd, J = 9,2, 1,8 Hz, 1H), 3,35 (q, J = 7,2 Hz, 2H), 3,10 (s, 3H), 2,59 (s, 3H), 1,29 (t, J = 7,3 Hz, 3H)

		ESI MS (m/z):315,0 [M + 1].
285	dipropil((2-(piridin-3-il)-2H-pirazolo[3,4-c]piridin-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,32 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 9,05 (t, J = 1,2 Hz, 1H), 9,01 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 8,68 (dd, J = 4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,48 (dq, J = 8,4, 1,3 Hz, 1H), 7,65 (q, J = 4,3 Hz, 1H), 6,82 (d, J = 1,5 Hz, 1H), 3,44 (t, J = 7,9 Hz, 4H), 1,82-1,70 (m, 4H), 0,98 (t, J = 7,5 Hz, 6H); ESI Ms (m/z): 344,05 [M+1].
286	metil(propil)((2-(piridin-3-il)-2H-pirazolo[3,4-c]piridin-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,32 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 9,06 (t, J = 1,1 Hz, 1H), 9,01 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 8,68 (dd, J = 4,6, 1,5 Hz, 1H), 8,49 (dq, J = 8,4, 1,3 Hz, 1H), 7,67-7,63 (m, 1H), 6,81 (d, J = 1,5 Hz, 1H), 3,51-3,45 (m, 2H), 3,28 (s, 3H), 1,84-1,73 (m, 2H), 0,99 (t, J = 7,5 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 316 [M+1].

287	sec-butil(isopropil)((2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -pirazolo[4,3- <i>b</i>]piridin-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,27 (d, <i>J</i> = 2,4 Hz, 1H), 9,00 (s, 1H), 8,59 (dd, <i>J</i> = 4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,42 (dq, <i>J</i> = 8,4, 1,3 Hz, 1H), 7,92 (dd, <i>J</i> = 9,2, 0,6 Hz, 1H), 7,60 (dd, <i>J</i> = 8,3, 4,9 Hz, 1H), 6,84 (dd, <i>J</i> = 9,2, 0,6 Hz, 1H), 3,87 (td, <i>J</i> = 13,0, 6,4 Hz, 1H), 3,78-3,71 (m, 1H), 2,15-2,05 (m, 1H), 1,68-1,53 (m, 1H), 1,43-1,37 (m, 9H), 0,98 (q, <i>J</i> = 7,1 Hz, 3H) ESI MS (<i>m/z</i>):357,95 [M + 1].
288	(ciclopropilmetil)(isopropil)((2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -pirazolo[4,3- <i>b</i>]piridin-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,27 (d, <i>J</i> = 2,1 Hz, 1H), 9,02 (d, <i>J</i> = 0,6 Hz, 1H), 8,60 (dd, <i>J</i> = 4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,41 (dq, <i>J</i> = 8,3, 1,4 Hz, 1H), 7,94 (dd, <i>J</i> = 9,2, 0,6 Hz, 1H), 7,62-7,58 (m, 1H), 6,81 (d, <i>J</i> = 9,2 Hz, 1H), 3,82 (t, <i>J</i> = 6,9 Hz, 1H), 3,70 (dq, <i>J</i> = 25,9, 7,2 Hz, 2H), 1,39 (dd, <i>J</i> =

		8,4, 6,9 Hz, 6H), 1,07-1,05 (m, 1H), 0,62-0,54 (m, 2H), 0,40-0,31 (m, 2H) ESI MS (m/z):355,95 [M + 1].
289	(ciclobutilmetil)(isopropil)((2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -pirazolo[4,3- <i>b</i>]piridin-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,27 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 9,02 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 8,59 (dd, J = 4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,41 (dq, J = 8,4, 1,3 Hz, 1H), 7,93 (dd, J = 9,2, 0,9 Hz, 1H), 7,60 (ddd, J = 8,4, 4,7, 0,6 Hz, 1H), 6,78 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 3,85-3,67 (m, 3H), 2,12-2,02 (m, 2H), 1,90-1,73 (m, 5H), 1,35 (dd, J = 6,7, 4,9 Hz, 6H); ESI MS (m/z): 370 [M+1].
290	1-óxido de 1-((2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -pirazolo[4,3- <i>b</i>]piridin-5-il)imino)hexahidro-λ ⁶ -tiopirano	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,26 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 9,01 (d, J = 0,6 Hz, 1H), 8,60 (dd, J = 4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,40 (dq, J = 8,5, 1,4 Hz, 1H), 7,96 (dd, J = 9,2, 0,9 Hz, 1H), 7,61 (dd, J = 8,4,

		4,7 Hz, 1H), 6,81 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 3,75-3,71 (m, 2H), 3,49-3,43 (m, 2H), 1,99-1,81 (m, 2H), 1,63-1,58 (m, 2H), 1,25-1,22 (m, 2H); ESI MS (m/z): 327,9 [M+1].
291	sec-butil(isopropil)((2-(piridin-3-il)-2H-indazol-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,25 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,89 (d, J = 0,6 Hz, 1H), 8,59 (dd, J = 4,6, 1,5 Hz, 1H), 8,40 (dq, J = 8,3, 1,4 Hz, 1H), 7,60 (dd, J = 8,1, 5,0 Hz, 1H), 7,53 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 7,18 (t, J = 2,0 Hz, 1H), 7,07 (dt, J = 9,2, 2,4 Hz, 1H), 3,37 (qd, J = 6,8, 3,2 Hz, 1H), 3,27-3,17 (m, 1H), 1,35-1,32 (m, 5H), 1,27 (t, J = 7,0 Hz, 3H), 1,20-1,17 (m, 3H), 0,98-0,90 (m, 3H); ESI MS (m/z): 356,95 [M+1].
292	1-óxido de 1-((2-(piridin-3-il)-2H-indazol-5-il)imino)hexahidro-λ ⁶ -tiopirano	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,26 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,91 (d, J = 0,6 Hz, 1H), 8,60 (dd, J

		= 4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,41 (dq, J = 8,4, 1,3 Hz, 1H), 7,62-7,60 (m, 1H), 7,58 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 7,17 (d, J = 1,2 Hz, 1H), 7,03 (dd, J = 9,2, 1,8 Hz, 1H), 3,38 (t, J = 6,7 Hz, 2H), 3,27-3,19 (m, 2H), 1,90 (q, J = 5,5 Hz, 4H), 1,64-1,55 (m, 2H); ESI MS (m/z): 326,9 [M+1].
293	<i>tert</i> -butil((2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)(metil)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,20 (d, J = 1,2 Hz, 1H), 8,97 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 8,63 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 8,42 (dt, J = 10,2, 2,3 Hz, 1H), 7,56 (d, J = 9,0 Hz, 1H), 7,16 (q, J = 0,9 Hz, 1H), 7,03 (dd, J = 9,2, 2,1 Hz, 1H), 3,01 (s, 3H), 1,43 (s, 9H) ESI MS (m/z):346,9 [M + 1].
294	isopentil(isopropil)((2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,47 (s, 2H), 9,21 (s, 1H), 8,97 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 7,57 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 7,18 (t, J = 1,1 Hz, 1H), 7,05

		(dd, J = 9,2, 1,8 Hz, 1H), 3,54 (t, J = 6,7 Hz, 1H), 3,26-3,23 (m, 2H), 1,65- 1,52 (m,3H), 1,37 (d, J = 6,7 Hz, 3H), 1,21 (q, J = 3,3 Hz, 3H), 0,84 (dd, J = 7,8, 6,3 Hz, 6H) ESI MS (m/z):371,95 [M + 1].
295	etil(metil)((2-(piridin-3-il)-7-(trifluorometil)-2H-indazol-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,27 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 9,14 (s, 1H), 8,66 (dd, J = 4,6, 1,5 Hz, 1H), 8,42 (dq, J = 8,3, 1,4 Hz, 1H), 7,65 (dd, J = 8,3, 5,4 Hz, 1H), 7,47 (s, 1H), 7,33 (s, 1H), 3,41 (q, J = 7,3 Hz, 2H), 3,17 (s, 3H), 1,31 (t, J = 7,3 Hz, 3H); ESI Ms (m/z): 369 [M+1].
296	dietil((2-(piridin-3-il)-7-(trifluorometil)-2H-indazol-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,26 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 9,13 (s, 1H), 8,66 (dd, J = 4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,42 (dq, J = 8,3, 1,4 Hz, 1H), 7,66-7,63 (m, 1H), 7,47 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 7,35 (t, J

		= 0,9 Hz, 1H), 3,36 (q, J = 7,4 Hz, 4H), 1,27 (t, J = 7,5 Hz, 6H); ESI Ms (m/z): 383 [M+1].
297	etil(metil)((2-(piridin-5-il)-6-(trifluorometil)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,50 (s, 2H), 9,28 (s, 1H), 9,13 (s, 1H), 8,11 (s, 1H), 7,46 (s, 1H), 3,40 (q, J = 7,4 Hz, 2H), 3,14 (s, 3H), 1,30 (t, J = 7,3 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 369,9 [M+1].
298	etil(metil)((2-(piridin-3-il)-6-(trifluorometil)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,29 (d, J = 2,2 Hz, 1H), 9,07 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 8,66 (dd, J = 4,6, 1,5 Hz, 1H), 8,44 (dq, J = 8,5, 1,3 Hz, 1H), 8,09 (s, 1H), 7,67-7,63 (m, 1H), 7,46 (s, 1H), 3,39 (q, J = 7,3 Hz, 2H), 3,13 (s, 3H), 1,31 (t, J = 7,3 Hz, 3H); ESI Ms (m/z): 368,85 [M+1].
299	4-óxido de 4-((2-(piridin-3-il)-6-(trifluorometil)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)-1,4λ ⁶ -oxatiano	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,29 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 9,08 (d, J = 0,6 Hz, 1H), 8,67 (dd, J

		= 4,6, 1,5 Hz, 1H), 8,44 (dq, J = 8,3, 1,4 Hz, 1H), 8,13 (s, 1H), 7,65 (dd, J = 8,4, 4,7 Hz, 1H), 7,47 (s, 1H), 4,11-4,07 (m, 2H), 3,84 (t, J = 10,4 Hz, 2H), 3,63 (d, J = 13,1 Hz, 2H), 3,49-3,42 (m, 2H); ESI MS (m/z): 396,9 [M+1].
300	etil((2-(5-fluoropiridin-3-il)-6-(trifluorometil)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)(metil)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,22 (s, 1H), 9,11 (s, 1H), 8,70 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,47 (dt, J = 10,0, 2,3 Hz, 1H), 8,09 (s, 1H), 7,44 (s, 1H), 3,40 (q, J = 7,3 Hz, 2H), 3,14 (s, 3H), 1,30 (t, J = 7,3 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 386,85 [M+1].
301	((2-(5-fluoropiridin-3-il)-6-(trifluorometil)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)(2-metoxietil)(metil)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,22 (s, 1H), 9,12 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 8,71 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,47 (dt, J = 9,9, 2,4 Hz, 1H), 8,10 (s, 1H), 7,45 (s, 1H), 3,80-3,62 (m, 4H), 3,27 (s, 3H),

		3,18 (s, 3H); ESI Ms (m/z): 416,9 [M+1].
302	4-óxido de 4-((2-(5-fluoropiridin-3-il)-6-(trifluoroetil)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)-1,4λ ⁶ -oxatiano	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,22 (s, 1H), 9,12 (s, 1H), 8,71 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,49-8,45 (m, 1H), 8,13 (s, 1H), 7,45 (s, 1H), 4,11-4,08 (m, 2H), 3,84 (t, J = 10,4 Hz, 2H), 3,64 (d, J = 13,7 Hz, 2H), 3,50-3,43 (m, 2H); ESI MS (m/z): 414,9 [M+1].
303	1-óxido de 1-((2-(5-fluoropiridin-3-il)-6-(trifluoroetil)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)tetrahidro-1 <i>H</i> -λ ⁶ -tiofeno	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,22 (s, 1H), 9,13 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 8,71 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,47 (dt, J = 10,0, 2,3 Hz, 1H), 8,10 (s, 1H), 7,36 (s, 1H), 3,37 (q, J = 6,6 Hz, 2H), 3,29-3,24 (m, 2H), 2,26-2,19 (m, 2H), 2,11-2,05 (m, 2H) ESI MS (m/z):398,9 [M + 1].
304	1-óxido de 1-((3-metil-2-(piridin-3 il)-2 <i>H</i> -indazol-5-	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,90 (d, J = 2,1 Hz, 1H), 8,70 (d, J =

	il)imino)tetrahidro-1 <i>H</i> -λ ⁶ -tiofeno	3,7 Hz, 1H), 8,13 (dq, J = 8,3, 1,3 Hz, 1H), 7,64 (dd, J = 8,3, 4,9 Hz, 1H), 7,49 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 7,06 (d, J = 1,2 Hz, 1H), 6,97 (dd, J = 9,0, 2,0 Hz, 1H), 3,36 (q, J = 6,5 Hz, 2H), 3,26-3,20 (m, 2H), 2,60 (s, 3H), 2,24-2,10 (m, 4H) ESI MS (m/z):327,00 [M + 1].
305	dipropil((2-(pirimidin-5-il)-6-(trifluorometil)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,50 (s, 2H), 9,27 (s, 1H), 9,11 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 8,10 (s, 1H), 7,45 (s, 1H), 3,34-3,32 (m, 4H), 1,79-1,71 (m, 4H), 0,96 (t, J = 7,3 Hz, 6H) ESI MS (m/z):411,9 [M + 1].
306	((2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -pirazolo[4,3- <i>n</i>]piridin-5-il)imino)dimetil-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,20 (s, 1H), 9,07 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 8,63 (d, J = 2,2 Hz, 1H), 8,41 (dt, J = 10,2, 2,3 Hz, 1H), 7,96 (dd, J = 9,2, 0,9 Hz, 1H), 6,78

		(d, J = 9,0 Hz, 1H), 3,44 (s, 6H); ESI MS (m/z): 305,75 [M+1].
307	etil((2-(5-fluoropiridin-3-il)-2H-pirazolo[4,3-n]piridin-5-il)imino)(metil)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,20 (s, 1H), 9,06 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 8,63 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,41 (dt, J = 10,0, 2,3 Hz, 1H), 7,95 (dd, J = 9,2, 0,9 Hz, 1H), 6,79 (d, J = 9,3 Hz, 1H), 3,60 (q, J = 7,4 Hz, 2H), 3,36 (s, 3H), 1,31 (t, J = 7,5 Hz, 3H); p ESI MS (m/z): 319,80 [M+1].
308	dietil((2-(5-fluoropiridin-3-il)-2H-pirazolo[4,3-n]piridin-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,19 (s, 1H), 9,05 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 8,63 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,41 (dt, J = 10,0, 2,3 Hz, 1H), 7,95 (dd, J = 9,2, 0,9 Hz, 1H), 6,81 (d, J = 9,3 Hz, 1H), 3,58 (q, J = 7,3 Hz, 4H), 1,28 (t, J = 7,3 Hz, 6H) ESI MS (m/z): 333,85[M+1].
309	((2-(5-fluoropiridin-3-il)-2H-pirazolo[4,3-n]piridin-5-	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,20 (s,

	il)imino)(metil)(propil)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H), 9,07 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 8,63 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,41 (dt, J = 10,2, 2,3 Hz, 1H), 7,95 (dd, J = 9,2, 0,9 Hz, 1H), 6,78 (d, J = 9,0 Hz, 1H), 3,61-3,53 (m, 2H), 3,38 (s, 3H), 1,85-1,73 (m, 2H), 1,00 (t, J = 7,5 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 333,80 [M+1].
310	((2-(5-fluoropiridin-3-il)-2H-pirazolo[4,3-n]piridin-5-il)imino)dipropil-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,20 (s, 1H), 9,07 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 8,63 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 8,42 (dt, J = 10,3, 2,3 Hz, 1H), 7,94 (dd, J = 9,2, 0,9 Hz, 1H), 6,79 (d, J = 9,3 Hz, 1H), 3,59-3,50 (m, 4H), 1,85-1,69 (m, 4H), 0,99 (t, J = 7,5 Hz, 6H); ESI MS (m/z): 362,20 [M+1].
311	((2-(5-fluoropiridin-3-il)-2H-pirazolo[4,3-n]piridin-5-il)imino)(isopropil)(metil)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,19 (s, 1H), 9,07 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 8,63 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,41 (dt, J = 10,2, 2,3 Hz, 1H), 7,94 (dd, J

		= 9,2, 0,9 Hz, 1H), 6,80 (d, J = 9,0 Hz, 1H), 3,37 (d, J = 8,8 Hz, 3H), 1,45-1,37 (m, 6H); ESI MS (m/z): 333,80 [M+1].
312	etil((2-(5-fluoropiridin-3-il)-2H-pirazolo[4,3-n]piridin-5-il)imino)(isopropil)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,19 (s, 1H), 9,06 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 8,63 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,41 (dt, J = 10,3, 2,3 Hz, 1H), 7,94 (d, J = 9,0 Hz, 1H), 6,82 (d, J = 9,3 Hz, 1H), 3,93-3,87 (m, 1H), 3,69-3,59 (m, 2H), 1,37 (dd, J = 9,3, 6,8 Hz, 6H), 1,28 (t, J = 7,3 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 348,00 [M+1].
313	<i>tTert</i> -butil((2-(5-fluoropiridin-3-il)-2H-pirazolo[4,3-n]piridin-5-il)imino)(metil)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,20 (s, 1H), 9,08 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 8,63 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,42 (dt, J = 10,2, 2,4 Hz, 1H), 7,95-7,92 (m, 1H), 6,80 (d, J = 9,3 Hz, 1H), 3,46 (s, 3H), 1,46 (s, 9H); ESI MS (m/z): 347,85 [M+1].

314	etil(metil)((2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -pirazolo[4,3- <i>b</i>]piridin-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,47 (s, 2H), 9,21 (s, 1H), 9,08 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 7,97 (dd, J = 9,2, 0,9 Hz, 1H), 6,80 (d, J = 9,3 Hz, 1H), 3,61 (q, J = 7,3 Hz, 2H), 3,37 (s, 3H), 1,31 (t, J = 7,3 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 302,80 [M+1].
315	isopropil(propil)((2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -pirazolo[4,3- <i>b</i>]piridin-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,47 (s, 2H), 9,20 (d, J = 4,9 Hz, 1H), 9,08 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 7,96 (d, J = 9,3 Hz, 1H), 6,83 (d, J = 9,3 Hz, 1H), 3,97-3,90 (m, 1H), 3,63-3,50 (m, 2H), 1,87-1,68 (m, 2H), 1,37 (dd, J = 8,6, 6,8 Hz, 6H), 0,99 (t, J = 7,5 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 344,85 [M+1].
316	diisopropil((2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -pirazolo[4,3- <i>b</i>]piridin-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,47 (s, 2H), 9,20 (s, 1H), 9,05 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 7,94 (dd, J = 9,2, 0,9 Hz, 1H), 6,87 (d, J = 9,3 Hz, 1H), 3,97-3,91 (m, 2H), 1,40

		(dd, J = 16,4, 6,8 Hz, 12H); ESI MS (m/z): 344,85 [M+1].
317	<i>t</i> Tert-butil(metil)((2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -pirazolo[4,3- <i>b</i>]piridin-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,48 (s, 2H), 9,21 (s, 1H), 9,10 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 7,96 (dd, J = 9,2, 0,9 Hz, 1H), 6,81 (d, J = 9,3 Hz, 1H), 3,46 (s, 3H), 1,46 (s, 9H) ESI MS (m/z): 330,85[M+1].
318	((2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -pirazolo[4,3- <i>b</i>]piridin-5-il)imino)(2-metoxietil)(metil)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,20 (s, 1H), 9,08 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 8,64 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,42 (dt, J = 10,2, 2,3 Hz, 1H), 7,97 (dd, J = 9,2, 0,9 Hz, 1H), 6,81 (d, J = 9,0 Hz, 1H), 3,99-3,83 (m, 2H), 3,82-3,75 (m, 2H), 3,37 (s, 3H), 3,33 (s, 3H); ESI MS (m/z):349,80[M+1].
493	(ciclobutilmetil)(isopropil)((2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,26 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,91 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 8,60 (dd, J = 4,7, 1,4 Hz, 1H),

		8,41 (dq, J = 8,3, 1,4 Hz, 1H), 7,60 (dd, J = 8,1, 5,0 Hz, 1H), 7,55 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 7,16 (d, J = 1,2 Hz, 1H), 7,00 (dd, J = 9,2, 1,8 Hz, 1H), 3,45-3,35 (m, 3H), 2,81-2,77 (m, 1H), 2,04 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 1,84-1,72 (m, 5H), 1,33 (dd, J = 26,6, 6,7 Hz, 7H) ESI MS (m/z): 368,95 [M+1]
494	sec-butil(isopropil)((2-(pirimidin-5-il)-2H-indazol-5-il)imino)-λ⁶-sulfanona	¹H-NMR (400 MHz, DMSO-<i>d</i>₆) δ 9,46 (d, J = 2,1 Hz, 2H), 9,20 (s, 1H), 8,95 (d, J = 0,6 Hz, 1H), 7,55 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 7,19 (t, J = 2,0 Hz, 1H), 7,10 (dt, J = 9,3, 2,4 Hz, 1H), 3,65-3,59 (m, 1H), 3,38 (tt, J = 10,2, 3,5 Hz, 1H), 2,07-2,00 (m, 1H), 1,35-1,32 (m, 5H), 1,29-1,22 (m, 5H), 0,94 (dt, J = 16,5, 7,5 Hz, 3H)

		ESI MS (m/z): 357,9 [M+1]
495	(ciclobutilmetil)(isopropil)((2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,47 (s, 2H), 9,21 (s, 1H), 8,97 (s, 1H), 7,57 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 7,16 (d, J = 1,2 Hz, 1H), 7,02 (dd, J = 9,2, 1,8 Hz, 1H), 3,42 (dt, J = 18,8, 6,7 Hz, 3H), 2,79 (s, 1H), 2,05 (d, J = 7,6 Hz, 2H), 1,84-1,73 (m, 4H), 1,33 (dd, J = 26,6, 6,7 Hz, 6H); ESI MS (m/z): 369,9 [M+1].
496	sec-butil((2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)(isopropil)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,18 (s, 1H), 8,93 (s, 1H), 8,62 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,40 (dt, J = 10,2, 2,4 Hz, 1H), 7,53 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 7,17 (t, J = 2,0 Hz, 1H), 7,09 (dt, J = 9,2, 2,3 Hz, 1H), 3,65-3,58 (m, 1H), 3,38 (qd, J = 6,8, 3,4 Hz, 1H), 2,06-2,00 (m, 1H), 1,56-1,37 (m, 1H), 1,35-1,32

		(m, 4H), 1,27 (t, J = 7,0 Hz, 5H), 0,94 (dt, J = 16,2, 7,5 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 375,1 [M+1]
497	((2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)(isopentil)(isopropil)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,19 (s, 1H), 8,95 (d, J = 0,6 Hz, 1H), 8,62 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,41 (dt, J = 10,1, 2,3 Hz, 1H), 7,55 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 7,16 (d, J = 1,2 Hz, 1H), 7,04 (dd, J = 9,2, 2,1 Hz, 1H), 3,58-3,51 (m, 1H), 3,26-3,22 (m, 2H), 1,63-1,59 (m, 2H), 1,34 (dd, J = 26,9, 6,7 Hz, 6H), 0,84 (dd, J = 7,8, 6,3 Hz, 6H); ESI MS (m/z): 389,1 [M+1]
498	(ciclobutilmetil)((2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)(isopropil)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,19 (s, 1H), 8,95 (s, 1H), 8,62 (d, J = 2,8 Hz, 1H), 8,41 (dt, J = 10,1, 2,3 Hz, 1H), 7,55 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 7,14 (d, J = 1,2 Hz, 1H), 7,01 (dd, J = 9,3,

		2,0 Hz, 1H), 3,41 (dt, J = 19,4, 6,7 Hz, 3H), 2,79 (t, J = 8,1 Hz, 1H), 2,04 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 1,84-1,72 (m, 4H), 1,39-1,29 (m, 6H) ESI MS (m/z): 386,95 [M+1].
499	1-óxido de 1-((2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)hexahidro- λ^6 -tiopirano	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,19 (s, 1H), 8,96 (d, J = 0,6 Hz, 1H), 8,63 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,42 (dt, J = 10,1, 2,3 Hz, 1H), 7,58 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 7,15 (d, J = 1,2 Hz, 1H), 7,04 (dd, J = 9,2, 2,1 Hz, 1H), 3,40-3,37 (m, 2H), 3,27-3,20 (m, 2H), 1,93-1,88 (m, 4H), 1,66-1,54 (m, 2H); ESI MS (m/z): 344,95 [M+1].
500	1-óxido de 1-((2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -pirazolo[3,4- <i>c</i>]piridin-5-il)imino)tetrahidro-1 <i>H</i> - λ^6 -tiofeno	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,33 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 9,09 (t, J = 1,1 Hz, 1H), 9,04 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 8,68 (dd, J = 4,6, 1,2 Hz, 1H), 8,50 (dq, J = 8,4,

		1,3 Hz, 1H), 7,66 (dd, J = 8,3, 4,9 Hz, 1H), 6,85 (d, J = 1,5 Hz, 1H), 3,56-3,49 (m, 2H), 3,34 (d, J = 6,7 Hz, 1H), 3,30 (d, J = 6,7 Hz, 1H), 2,23-2,16 (m, 2H), 2,14-2,07 (m, 2H); ESI MS (m/z): 314,1 [M+1].
501	4-óxido de 4-((2-(piridin-3-il)-2H-pirazolo[3,4-c]piridin-5-il)imino)-1,4 λ ⁶ -oxatiano	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,33 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 9,05 (s, 2H), 8,68 (dd, J = 4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,49 (dq, J = 8,3, 1,4 Hz, 1H), 7,66 (dd, J = 8,4, 4,7 Hz, 1H), 6,90 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 4,07 (qd, J = 6,3, 3,2 Hz, 2H), 3,99-3,93 (m, 2H), 3,72 (dt, J = 14,6, 3,1 Hz, 2H), 3,55-3,49 (m, 2H); ESI MS (m/z): 330,05 [M+1]
502	dietil((2-(piridin-3-il)-2H-pirazolo[3,4-c]piridin-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,32 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 9,03 (d, J = 13,0 Hz, 2H), 8,68 (d, J = 3,7 Hz, 1H), 8,49

		(d, J = 8,3 Hz, 1H), 7,65 (dd, J = 8,3, 4,6 Hz, 1H), 6,83 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 3,52-3,41 (m, 4H), 1,27 (t, J = 7,3 Hz, 6H); ESI MS (m/z): 315,9 [M+1]
503	1-óxido de 1-((2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -pirazolo[3,4- <i>c</i>]piridin-5-il)imino)tetrahidro-1 <i>H</i> -λ ⁶ -tiofeno	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,54 (s, 2H), 9,29 (d, J = 4,9 Hz, 1H), 9,12 (t, J = 1,1 Hz, 1H), 9,10 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 6,87 (d, J = 1,5 Hz, 1H), 3,56-3,49 (m, 2H), 3,35 (d, J = 6,6 Hz, 1H), 3,29 (s, 1H), 2,24-2,16 (m, 2H), 2,14-2,05 (m, 2H) ESI MS (m/z): 314,95 [M+1]
504	4-óxido de 4-((2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)-1,4 λ ⁶ -oxatiano	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,26 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,91 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 8,60 (dd, J = 4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,41 (dq, J = 8,3, 1,4 Hz, 1H), 7,60 (dd, J = 8,1, 5,0 Hz, 1H), 7,55 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 7,16 (d, J = 1,2 Hz, 1H),

		7,00 (dd, J = 9,2, 1,8 Hz, 1H), 4,1-4,05 (m, 2H), 3,98-3,90 (m, 2H), 3,52-3,45 (m, 2H), 3,41-3,32 (m, 2H); ESI MS (m/z): 329 [M+1]
505	isopropil((2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)(piridin-4-ilmetil)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,27 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,93 (d, J = 0,6 Hz, 1H), 8,60 (dd, J = 4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,53 (dd, J = 4,3, 1,5 Hz, 2H), 8,42 (dq, J = 8,4, 1,3 Hz, 1H), 7,61 (q, J = 4,3 Hz, 1H), 7,56 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 7,40-7,38 (m, 2H), 7,19 (t, J = 0,9 Hz, 1H), 6,99 (dd, J = 9,3, 2,0 Hz, 1H), 4,73 (q, J = 13,6 Hz, 1H), 3,37 (t, J = 6,7 Hz, 1H), 2,53 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 1,40 (d, J = 6,7 Hz, 3H), 1,34 (d, J = 7,0 Hz, 3H) ESI MS (m/z): 392,05 [M+1].

506	isopropil(piridin-2-ilmetil)((2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,28 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,95 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 8,58 (ddd, J = 17,7, 4,6, 1,2 Hz, 2H), 8,42 (t, J = 1,4 Hz, 1H), 7,76 (d, J = 1,8 Hz, 1H), 7,61 (q, J = 4,4 Hz, 1H), 7,56 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 7,36-7,30 (m, 2H), 7,24 (d, J = 1,2 Hz, 1H), 6,95 (dd, J = 9,2, 2,1 Hz, 1H), 4,78 (dd, J = 31,5, 14,1 Hz, 2H), 3,50 (s, 1H), 1,43 (d, J = 6,7 Hz, 3H), 1,38 (d, J = 7,0 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 392 [M+1]
507	etil((2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)(piridin-4-il)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,20 (d, J = 2,1 Hz, 1H), 8,87-8,86 (m, 3H), 8,58 (dd, J = 4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,35 (dq, J = 8,3, 1,4 Hz, 1H), 7,86 (dd, J = 4,3, 1,5 Hz, 2H), 7,60-7,54 (m, 2H), 7,05-7,02 (m, 2H), 3,63 (td,

		J = 7,6, 7,0 Hz, 2H), 1,20 (t, J = 7,3 Hz, 3H); ESI MS (m/z):364,05 [M+1]
508	4-óxido de 4-((2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)-1,4 λ ⁶ -oxatiano	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,47 (s, 2H), 9,21 (s, 1H), 8,97 (d, J = 0,6 Hz, 1H), 7,57 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 7,19 (d, J = 1,2 Hz, 1H), 7,06 (dd, J = 9,2, 2,1 Hz, 1H), 4,1-4,02 (m, 2H), 3,98-3,88 (m, 2H), 3,52-3,45 (m, 2H), 3,44-3,34 (m, 2H). ESI MS (m/z): 330 [M+1].
509	(3-metoxifenil)(metil)((2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,47-9,41 (m, 2H), 9,18 (d, J = 10,1 Hz, 1H), 8,91 (s, 1H), 7,56-7,44 (m, 4H), 7,38-7,19 (m, 1H), 7,09-7,00 (m, 2H), 3,79-3,76 (m, 3H), 3,42 (s, 3H) ESI MS (m/z): 379,95 [M+1]

510	metil(piridin-2-il)((2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,28 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,95 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 8,58 (ddd, J = 17,7, 4,6, 1,2 Hz, 1H), 8,42 (t, J = 1,4 Hz, 1H), 7,76 (d, J = 1,8 Hz, 1H), 7,61 (q, J = 4,4 Hz, 1H), 7,56 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 7,36-7,30 (m, 2H), 7,24 (d, J = 1,2 Hz, 1H), 6,95 (dd, J = 9,2, 2,1 Hz, 1H), 3,50 (s, 3H) ESI MS (m/z): 350,9 [M+1]
511	etil(piridin-4-il)((2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,20 (d, J = 2,1 Hz, 1H), 8,87-8,86 (m, 2H), 8,58 (dd, J = 4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,35 (dq, J = 8,3, 1,4 Hz, 1H), 7,86 (dd, J = 4,3, 1,5 Hz, 2H), 7,60-7,54 (m, 2H), 7,05-7,02 (m, 2H), 3,63 (td, J = 7,6, 7,0 Hz, 2H), 1,20 (t, J = 7,3 Hz, 3H);

		ESI MS (m/z):364,95 [M+1]
512	(ciclopropilmetil)(isopropil)((2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,47 (s, 2H), 9,21 (s, 1H), 8,97 (d, J = 0,6 Hz, 1H), 7,57 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 7,19 (d, J = 1,2 Hz, 1H), 7,06 (dd, J = 9,2, 2,1 Hz, 1H), 3,57 (t, J = 6,9 Hz, 1H), 3,28 (d, J = 6,7 Hz, 2H), 1,39 (d, J = 6,7 Hz, 3H), 1,33 (d, J = 7,0 Hz, 3H), 1,04 (s, 1H), 0,56-0,54 (m, 2H), 0,30 (dd, J = 4,9, 3,1 Hz, 2H); ESI MS (m/z):356 [M+1].
513	((2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)(3-metoxifenil)(metil)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,13 (s, 1H), 8,89 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 8,61 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,35 (dt, J = 10,1, 2,3 Hz, 1H), 7,54-7,51 (m, 3H), 7,44 (t, J = 1,4 Hz, 1H), 7,21 (td, J = 4,7, 2,6 Hz, 1H), 7,04 (dd, J = 9,2, 2,1 Hz, 1H), 6,98 (q, J = 0,9 Hz, 1H), 3,80 (d,

		J = 5,5 Hz, 3H), 3,42 (s, 3H); ESI MS (m/z): 396,95 [M+1]
514	(2-metoxietil)(metil)((2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -pirazolo[3,4- <i>c</i>]piridin-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,32 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 9,04 (dd, J = 12,1, 0,8 Hz, 2H), 8,68 (dd, J = 4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,49 (dq, J = 8,3, 1,4 Hz, 1H), 7,65 (dd, J = 8,3, 4,9 Hz, 1H), 6,84 (d, J = 1,5 Hz, 1H), 3,86-3,74 (m, 4H), 3,28 (d, J = 1,5 Hz, 6H) ESI MS (m/z): 331,9 [M+1]
515	1-óxido de 1-((3-metil-2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)hexahidro-λ ⁶ -tiopirano	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,89 (d, J = 2,0 Hz, 1H), 8,70 (dd, J = 4,9, 1,5 Hz, 1H), 8,12 (dq, J = 8,1, 1,3 Hz, 1H), 7,66-7,62 (m, 1H), 7,48 (dd, J = 9,0, 0,7 Hz, 1H), 7,10 (d, J = 1,2 Hz, 1H), 7,02 (dd, J = 9,0, 2,0 Hz, 1H), 3,38-3,34

		(m, 2H), 3,25-3,18 (m, 2H), 2,59 (s, 3H), 1,91-1,87 (m, 4H), 1,65-1,54 (m, 2H); ESI MS (m/z): 341,0 [M+1]
516	4-óxido de 4-((2-(5-fluoropiridin-3-il)-2H-pirazolo[3,4-c]piridin-5-il)imino)-1,4 λ ⁶ -oxatiano	¹ H-NMR (400 MHz, CLOROFORMO-D) δ 9,11 (s, 1H), 9,05-8,98 (m, 1H), 8,58 (dd, J = 6,4, 2,4 Hz, 1H), 8,35 (d, J = 0,6 Hz, 1H), 8,11 (dt, J = 9,0, 2,4 Hz, 1H), 7,01 (s, 1H), 4,27-4,15 (m, 4H), 3,77 (dt, J = 14,7, 2,8 Hz, 2H), 3,54-3,48 (m, 2H) ESI MS (m/z): 347,9 [M+1]
517	etil((2-(5-fluoropiridin-3-il)-3-metil-2H-indazol-5-il)imino)(isopropil)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 8,83 (d, J = 1,5 Hz, 1H), 8,74 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 8,20 (dt, J = 9,5, 2,3 Hz, 1H), 7,46 (dd, J = 9,0, 0,7 Hz, 1H), 7,11 (q, J = 0,9 Hz, 1H), 7,04 (dd, J = 9,2, 2,1 Hz, 1H), 3,56-3,49 (m, 2H), 3,33-3,24 (m, 2H), 2,62 (s,

		3H), 1,37 (d, J = 6,8 Hz, 2H), 1,31 (d, J = 6,8 Hz, 3H), 1,24 (t, J = 7,3 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 360,95 [M+1]
518	1-óxido de 1-((2-(5-fluoropiridin-3-il)-3-metil-2H-indazol-5-il)imino)tetrahidro-1H-λ ⁶ -tiofeno	¹ H-NMR (400 MHz, CLOROFORMO-D) δ 8,73 (s, 1H), 8,59 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 7,78 (dt, J = 8,7, 2,3 Hz, 1H), 7,60 (dd, J = 9,0, 0,7 Hz, 1H), 7,25 (d, J = 1,5 Hz, 1H), 7,15 (dd, J = 9,3, 2,0 Hz, 1H), 3,62-3,53 (m, 2H), 3,25-3,18 (m, 2H), 2,69 (s, 3H), 2,42-2,28 (m, 4H); ESI MS (m/z): 344,9 [M+1].
519	1-óxido de 1-((2-(5-fluoropiridin-3-il)-3-metil-2H-indazol-5-il)imino)hexahidro-λ ⁶ -tiopirano	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 8,82 (s, 1H), 8,75 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,20 (dt, J = 9,8, 2,3 Hz, 1H), 7,48 (d, J = 9,3 Hz, 1H), 7,10 (d, J = 1,2 Hz, 1H), 7,03 (dd, J = 9,0, 2,0 Hz, 1H), 3,42-3,33 (m, 2H), 3,26-

		3,19 (m, 2H), 2,63 (s, 3H), 1,92-1,88 (m, 4H), 1,64-1,57 (m, 2H); ESI MS (m/z): 358,9 [M+1]
520	dietil((2-(5-fluoropiridin-3-il)-3-metil-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)- λ^6 -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,83 (s, 1H), 8,75 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 8,20 (dt, J = 9,7, 2,3 Hz, 1H), 7,47 (dd, J = 9,2, 0,6 Hz, 1H), 7,10 (t, J = 1,0 Hz, 1H), 7,01 (dd, J = 9,2, 2,1 Hz, 1H), 3,35-3,32 (m, 1H), 3,31-3,25 (m, 3H), 2,62 (s, 3H), 1,25 (t, J = 7,5 Hz, 6H); ESI MS (m/z): 346,95 [M+1]
521	4-óxido de 4-((3-metil-2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)-1,4 λ^6 -oxatiano	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,89 (d, J = 2,0 Hz, 1H), 8,70 (dd, J = 4,6, 1,5 Hz, 1H), 8,12 (dq, J = 8,2, 1,3 Hz, 1H), 7,66-7,59 (m, 1H), 7,50 (dd, J = 9,2, 0,6 Hz, 1H), 7,16 (t, J = 1,0 Hz, 1H), 7,08-7,03 (m, 1H), 4,10-4,02 (m, 2H), 3,98-3,92 (m, 2H), 3,49-3,45 (m,

		2H), 3,40-3,34 (m, 2H), 2,60 (s, 3H) ESI MS (m/z): 342,95 [M+1]
522	((2-(5-fluoropiridin-3-il)-2H- pirazolo[4,3- <i>b</i>]piridin-5- il)imino)(isopropil)(2- metoxietil)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,19 (s, 1H), 9,07 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 8,63 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,41 (dt, J = 10,1, 2,3 Hz, 1H), 7,95 (dd, J = 9,0, 0,7 Hz, 1H), 6,83 (d, J = 9,0 Hz, 1H), 4,08-4,02 (m, 1H), 3,93- 3,86 (m, 1H), 3,82-3,73 (m, 2H), 3,72-3,63 (m, 1H), 3,25 (d, J = 12,2 Hz, 3H), 1,45- 1,37 (m, 6H) ESI MS (m/z): 378,1 [M+1]
523	(ciclopropilmetil)((2-(5- fluoropiridin-3-il)-2H- pirazolo[4,3- <i>b</i>]piridin-5- il)imino)(isopropil)-λ ⁶ - sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,19 (s, 1H), 9,06 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 8,63 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,40 (dt, J = 10,2, 2,3 Hz, 1H), 7,95-7,93 (m, 1H), 6,82 (q, J = 4,6 Hz, 1H), 3,85- 3,78 (m, 1H), 3,71 (dq,

		J = 25,5, 7,2 Hz, 2H), 1,39 (dd, J = 8,1, 6,8 Hz, 6H), 1,10-1,04 (m, 1H), 0,64-0,54 (m, 2H), 0,41-0,28 (m, 2H) ESI MS (m/z): 374,00 [M+1]
524	1-óxido de 1-((2-(5-fluoropiridin-3-il)-2H-pirazolo[4,3- <i>b</i>]piridin-5-il)imino)tetrahydro-1H-λ ⁶ -tiofeno	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,21 (s, 1H), 9,10 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 8,63 (d, J = 2,2 Hz, 1H), 8,43 (dt, J = 10,2, 2,3 Hz, 1H), 7,98 (dd, J = 9,3, 0,7 Hz, 1H), 6,84 (d, J = 9,0 Hz, 1H), 3,67-3,60 (m, 2H), 3,36 (q, J = 6,8 Hz, 2H), 2,26-2,19 (m, 2H), 2,15-2,06 (m, 2H); ESI MS (m/z): 331,85 [M+1]
525	1-óxido de 1-((2-(5-fluoropiridin-3-il)-2H-pirazolo[4,3- <i>b</i>]piridin-5-il)imino)hexahidro-λ ⁶ -tiopirano	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,19 (s, 1H), 9,04 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 8,63 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,40 (dt, J = 10,0, 2,3 Hz, 1H), 7,96 (dd, J = 9,2, 0,9 Hz, 1H), 6,83 (d, J = 9,3 Hz, 1H), 3,74 (d, J = 8,1 Hz, 2H),

		3,50-3,43 (m, 2H), 1,99-1,86 (m, 4H), 1,63-1,58 (m, 2H); ESI MS (m/z): 345,95 [M+1]
526	4-óxido de 4-((2-(5-fluoropiridin-3-il)-2H-pirazolo[4,3- <i>b</i>]piridin-5-il)imino)-1,4 λ ⁶ -oxatiano	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,20 (s, 1H), 9,08 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 8,64 (d, J = 2,2 Hz, 1H), 8,41 (dt, J = 10,1, 2,4 Hz, 1H), 8,00 (dd, J = 9,2, 0,9 Hz, 1H), 6,87 (d, J = 9,3 Hz, 1H), 4,11 (ddd, J = 12,6, 5,7, 3,3 Hz, 2H), 3,96-3,86 (m, 4H), 3,60-3,54 (m, 2H); ESI MS (m/z): 347,95 [M+1]
527	((2-(5-fluoropiridin-3-il)-2H-pirazolo[4,3- <i>b</i>]piridin-5-il)imino)(isopropil)(piridin-2-ilmetil)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,23 (s, 1H), 9,17 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 8,65 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 8,59-8,58 (m, 1H), 8,45 (dt, J = 10,2, 2,3 Hz, 1H), 7,96 (dd, J = 9,2, 0,9 Hz, 1H), 7,76 (td, J = 7,7, 1,8 Hz, 1H), 7,38-7,33 (m, 2H), 6,77 (d, J = 9,3 Hz, 1H), 5,26 (s, 2H), 3,66 (t,

		J = 6,8 Hz, 1H), 1,43 (dd, J = 15,6, 6,8 Hz, 6H); ESI MS (m/z): 410,95 [M+1]
528	((2-(5-fluoropiridin-3-il)-2H-pirazolo[4,3- <i>b</i>]piridin-5-il)imino)(isopropil)(piridin-3-ilmetil)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,21 (s, 1H), 9,12 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 8,64 (d, J = 2,2 Hz, 1H), 8,56-8,54 (m, 2H), 8,43 (dt, J = 10,0, 2,3 Hz, 1H), 7,98 (dd, J = 9,2, 0,9 Hz, 1H), 7,82 (d, J = 7,8 Hz, 1H), 7,42 (dd, J = 7,5, 4,5 Hz, 1H), 6,81 (d, J = 9,0 Hz, 1H), 5,13 (d, J = 13,7 Hz, 1H), 5,05 (d, J = 13,9 Hz, 1H), 3,77 (t, J = 6,8 Hz, 1H), 1,41 (dd, J = 18,6, 6,8 Hz, 6H) ESI MS (m/z): 411,0 [M+1]
529	((2-(5-fluoropiridin-3-il)-2H-pirazolo[4,3- <i>b</i>]piridin-5-il)imino)(isopropil)(piridin-4-ilmetil)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,22 (s, 1H), 9,13 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 8,64 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,58 (d, J = 6,1 Hz, 2H), 8,46-8,42 (m, 1H),

		7,99 (dd, J = 9,2, 0,9 Hz, 1H), 7,43-7,42 (m, 2H), 6,83 (d, J = 9,0 Hz, 1H), 5,15 (d, J = 13,4 Hz, 1H), 5,08 (d, J = 13,4 Hz, 1H), 3,69 (t, J = 6,8 Hz, 1H), 1,40 (dd, J = 14,8, 6,7 Hz, 6H); ESI MS (m/z): 411,00 [M+1]
530	((2-(5-fluoropiridin-3-il)-2H-pirazolo[4,3-b]piridin-5-il)imino)(3-metoxifenil)(metil)- λ^6 -sulfanona	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9,16 (s, 1H), 8,98 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 8,61 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,39 (dt, J = 10,2, 2,3 Hz, 1H), 7,98 (dd, J = 9,2, 0,9 Hz, 1H), 7,58-7,52 (m, 2H), 7,51 (t, J = 1,5 Hz, 1H), 7,25 (td, J = 4,7, 2,4 Hz, 1H), 6,93 (d, J = 9,3 Hz, 1H), 3,83-3,81 (m, 3H), 3,52 (s, 3H); ESI MS (m/z): 397,95 [M+1]
531	((2-(5-fluoropiridin-3-il)-2H-pirazolo[4,3-b]piridin-5-il)imino)(isopropil)(propil)- λ^6 -sulfanona	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9,19 (s, 1H), 9,05 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 8,63 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 8,41 (dt, J = 10,0,

		2,3 Hz, 1H), 7,94 (dd, J = 9,2, 0,9 Hz, 1H), 6,81 (d, J = 9,3 Hz, 1H), 3,96-3,89 (m, 1H), 3,64-3,49 (m, 2H), 1,84-1,69 (m, 2H), 1,37 (dd, J = 8,2, 7,0 Hz, 6H), 0,99 (t, J = 7,5 Hz, 3H) ESI MS (m/z): 362,00 [M+1]
532	(ciclobutilmetil)((2-(5-fluoropiridin-3-il)-2H-pirazolo[4,3- <i>b</i>]piridin-5-il)imino)(isopropil)(propil)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,20 (s, 1H), 9,06 (s, 1H), 8,63 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 8,41 (d, J = 10,3 Hz, 1H), 7,93 (d, J = 9,3 Hz, 1H), 6,79 (d, J = 9,0 Hz, 1H), 3,81-3,71 (m, 3H), 2,73-2,94 (1H), 1,96-2,20 (2H), 1,87-1,85 (m, 4H), 1,35 (dd, J = 6,8, 5,1 Hz, 6H); ESI MS (m/z): 388,00 [M+1]
533	4-óxido de 4-((2-(pirimidin-5-il)-2H-pirazolo[3,4- <i>c</i>]piridin-5-il)imino)-1,4 λ ⁶ -oxatiano	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,54 (s, 2H), 9,30 (s, 1H), 9,11 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 9,09 (t, J = 1,2 Hz, 1H), 6,92 (d, J = 1,5 Hz, 1H), 4,08

		(qd, J = 6,3, 3,2 Hz, 2H), 4,00-3,94 (m, 2H), 3,72 (dt, J = 14,8, 3,1 Hz, 2H), 3,56-3,50 (m, 2H) ESI MS (m/z): 330,9 [M+1].
534	((2-(5-fluoropiridin-3-il)-3-metil-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)(isopropil)(metil)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,83 (s, 1H), 8,75 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 8,21 (dt, J = 9,8, 2,3 Hz, 1H), 7,47 (d, J = 8,6 Hz, 1H), 7,11 (d, J = 1,2 Hz, 1H), 7,01 (dd, J = 9,0, 2,0 Hz, 1H), 3,54-3,47 (m, 1H), 3,01 (s, 3H), 2,63 (s, 3H), 1,40 (d, J = 6,8 Hz, 3H), 1,35 (d, J = 6,8 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 346,90 [M+1].
535	((2-(5-fluoropiridin-3-il)-3-metil-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)(metil)(propil)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,83 (t, J = 1,3 Hz, 1H), 8,75 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 8,21 (dt, J = 9,5, 2,3 Hz, 1H), 7,47 (dd, J = 9,0, 0,7 Hz, 1H), 7,09 (q, J = 0,9 Hz, 1H), 6,98 (dd, J = 9,0, 2,0 Hz, 1H),

		3,40-3,33 (m, 2H), 3,12 (s, 3H), 2,64 (s, 3H), 1,83-1,74 (m, 2H), 0,98 (t, J = 7,3 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 346,90 [M+1].
536	((2-(5-fluoropiridin-3-il)-3-metil-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)dimetil-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,83 (d, J = 1,2 Hz, 1H), 8,75 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 8,21 (dt, J = 9,6, 2,3 Hz, 1H), 7,48 (dd, J = 9,2, 0,6 Hz, 1H), 7,09 (q, J = 0,9 Hz, 1H), 6,97 (dd, J = 9,0, 2,0 Hz, 1H), 3,22 (s, 6H), 2,63 (s, 3H); ESI MS (m/z): 318,90 [M+1].
537	<i>tert</i> -butil(metil)((2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -pirazolo[4,3- <i>b</i>]piridin-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,28 (d, J = 2,8 Hz, 1H), 9,05 (d, J = 0,6 Hz, 1H), 8,60 (dd, J = 4,6, 1,2 Hz, 1H), 8,42 (dq, J = 8,3, 1,3 Hz, 1H), 7,95-7,92 (m, 1H), 7,61 (dd, J = 8,4, 4,7 Hz, 1H), 6,78 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 3,45 (s, 3H), 1,44 (d,

		J = 14,4 Hz, 9H); ESI MS (m/z): 330,1 [M + 1].
538	((6-cloropiridin-3-il)metil)(isopropil)((2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -pirazolo[4,3- <i>b</i>]piridin-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,29 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 9,06 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 8,61 (dd, J = 4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,45-8,41 (m, 2H), 7,99 (dd, J = 9,2, 0,6 Hz, 1H), 7,91 (dd, J = 8,3, 2,4 Hz, 1H), 7,63-7,60 (m, 1H), 7,58 (d, J = 8,3 Hz, 1H), 6,80 (d, J = 9,5 Hz, 1H), 5,11 (d, J = 13,8 Hz, 1H), 5,03 (d, J = 13,8 Hz, 1H), 3,85-3,79 (m, 1H), 1,41 (dd, J = 12,4, 6,9 Hz, 6H) ESI MS (m/z): 427 [M + 1].
539	((2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)(isopropil)(piridin-4-ilmetil)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,20 (s, 1H), 8,96 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 8,63 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,53 (dd, J = 4,5, 1,6 Hz, 2H), 8,42 (dt, J = 10,0, 2,3 Hz, 1H), 7,55 (d, J = 9,3 Hz, 1H),

		7,39 (dd, J = 4,5, 1,6 Hz, 2H), 7,17 (q, J = 0,9 Hz, 1H), 7,00 (dd, J = 9,3, 2,0 Hz, 1H), 4,73 (dd, J = 26,2, 13,7 Hz, 2H), 3,40-3,33 (m, 1H), 1,40 (d, J = 6,6 Hz, 3H), 1,34 (d, J = 6,8 Hz, 3H) ESI MS (m/z): 410 [M + 1].
540	((2-(5-fluoropiridin-3-il)-2H-indazol-5-il)imino)(isopropil)(piridin-2-ilmetil)-λ⁶-sulfanona	¹H-NMR (400 MHz, DMSO-<i>d</i>₆) δ 9,21 (s, 1H), 8,99 (s, 1H), 8,63 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,56 (d, J = 4,2 Hz, 1H), 8,43 (dt, J = 10,3, 2,3 Hz, 1H), 7,76 (td, J = 7,7, 1,8 Hz, 1H), 7,56 (d, J = 9,3 Hz, 1H), 7,36-7,30 (m, 2H), 7,22 (d, J = 1,2 Hz, 1H), 6,96 (dd, J = 9,2, 2,1 Hz, 1H), 4,79 (dd, J = 31,8, 13,9 Hz, 2H), 3,50 (t, J = 6,8 Hz, 1H), 1,43 (d, J = 6,8 Hz, 3H), 1,38 (d, J = 6,8 Hz, 3H)

		ESI MS (m/z): 410,05 [M + 1].
541	metil(piridin-2-il)((2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,21 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,86 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 8,76 (dq, J = 4,7, 0,8 Hz, 1H), 8,58 (dd, J = 4,6, 1,5 Hz, 1H), 8,36 (dq, J = 8,4, 1,3 Hz, 1H), 8,13-8,06 (m, 2H), 7,66 (ddd, J = 7,3, 4,6, 1,5 Hz, 1H), 7,58 (dd, J = 8,7, 5,0 Hz, 1H), 7,50 (d, J = 9,0 Hz, 1H), 7,04 (t, J = 1,0 Hz, 1H), 6,95 (dd, J = 9,2, 2,1 Hz, 1H), 3,47 (s, 3H) ESI MS (m/z): 349,9 [M + 1].
542	isopropil((2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -pirazolo[4,3- <i>b</i>]piridin-5-il)imino)(piridin-4-ilmetil)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,29 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 9,09 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 8,61 (dd, J = 4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,57 (dd, J = 4,6, 1,5 Hz, 2H), 8,43 (dq, J = 8,4, 1,4 Hz, 1H), 7,99 (dd, J = 9,2,

		0,9 Hz, 1H), 7,63-7,60 (m, 1H), 7,42 (dd, J = 4,3, 1,5 Hz, 2H), 6,81 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 5,11 (dd, J = 29,5, 13,6 Hz, 2H), 3,73-3,66 (m, 1H), 1,40 (dd, J = 15,1, 6,9 Hz, 6H) ESI MS (m/z): 392,95 [M + 1].
543	((2-(5-fluoropiridin-3-il)-2H-indazol-5-il)imino)(propil)(piridin-2-il)-λ⁶-sulfanona	¹H-NMR (400 MHz, DMSO-<i>d</i>₆) δ 9,14 (s, 1H), 8,89 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 8,76 (dq, J = 4,6, 0,8 Hz, 1H), 8,61 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,36 (dt, J = 10,2, 2,3 Hz, 1H), 8,14-8,06 (m, 2H), 7,65 (ddd, J = 7,3, 4,6, 1,5 Hz, 1H), 7,49 (d, J = 9,0 Hz, 1H), 7,01 (q, J = 1,0 Hz, 1H), 6,98 (dd, J = 9,0, 2,0 Hz, 1H), 3,66-3,60 (m, 2H), 1,80-1,71 (m, 1H), 1,66-1,56 (m, 1H), 0,94 (t, J = 7,5 Hz, 3H) ESI MS (m/z): 396 [M + 1].

544	isopropil(piridin-2-ilmetil)((2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -pirazolo[4,3- <i>b</i>]piridin-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,30 (d, <i>J</i> = 2,4 Hz, 1H), 9,13 (d, <i>J</i> = 0,9 Hz, 1H), 8,61 (dd, <i>J</i> = 4,6, 1,2 Hz, 1H), 8,58 (td, <i>J</i> = 2,9, 1,9 Hz, 1H), 8,44 (dq, <i>J</i> = 8,5, 1,4 Hz, 1H), 7,96 (dd, <i>J</i> = 9,2, 0,6 Hz, 1H), 7,76 (td, <i>J</i> = 7,8, 1,8 Hz, 1H), 7,64-7,60 (m, 1H), 7,35 (dd, <i>J</i> = 7,6, 4,9 Hz, 2H), 6,76 (d, <i>J</i> = 9,2 Hz, 1H), 5,24 (d, <i>J</i> = 14,4 Hz, 2H), 3,69-3,62 (m, 1H), 1,47-1,40 (m, 6H) ESI MS (<i>m/z</i>): 393,05 [M + 1].
545	((2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)(metil)(piridin-2-il)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,14 (s, 1H), 8,90 (d, <i>J</i> = 1,0 Hz, 1H), 8,76 (dq, <i>J</i> = 4,7, 0,8 Hz, 1H), 8,61 (d, <i>J</i> = 2,4 Hz, 1H), 8,37 (dt, <i>J</i> = 10,2, 2,3 Hz, 1H), 8,14-8,06 (m, 2H), 7,66 (ddd, <i>J</i> = 7,3, 4,6, 1,5 Hz, 1H), 7,50 (d,

		J = 9,0 Hz, 1H), 7,02 (q, J = 0,9 Hz, 1H), 6,96 (dd, J = 9,2, 2,1 Hz, 1H), 3,47 (s, 3H) ESI MS (m/z): 367,95 [M + 1].
546	(3-metoxifenil)(metil)((2-(piridin-3-il)-2H-indazol-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹H-NMR (400 MHz, DMSO-<i>d</i>₆) δ 9,20 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,85 (d, J = 0,6 Hz, 1H), 8,58 (dd, J = 4,6, 1,5 Hz, 1H), 8,35 (dq, J = 8,3, 1,3 Hz, 1H), 7,58 (q, J = 4,3 Hz, 1H), 7,54-7,49 (m, 3H), 7,44 (s, 1H), 7,21 (td, J = 4,6, 2,9 Hz, 1H), 7,04-7,00 (m, 2H), 3,81-3,74 (m, 3H), 3,40 (d, J = 9,5 Hz, 3H) ESI MS (m/z): 378,9 [M + 1].
547	isopentil(isopropil)((2-(pirimidin-5-il)-2H-pirazolo[4,3- <i>b</i>]piridin-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹H-NMR (400 MHz, DMSO-<i>d</i>₆) δ 9,47 (s, 2H), 9,21 (s, 1H), 9,06 (s, 1H), 7,96 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 6,82 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 3,93-3,86 (m, 1H), 3,65-3,60

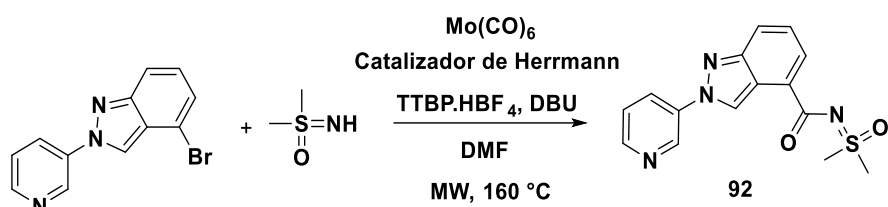
		(m, 2H), 1,73-1,62 (m, 2H), 1,59-1,51 (m, 1H), 1,39-1,34 (m, 6H), 0,87 (t, J = 6,0 Hz, 6H) ESI MS (m/z): 373,00 [M+1].
548	isopropil(2-metoximetil)((2-(piridin-5-il)-2 <i>H</i> -pirazolo[4,3- <i>b</i>]piridin-5-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,49-9,45 (m, 2H), 9,21 (s, 1H), 9,08 (d, J = 0,6 Hz, 1H), 7,97 (dd, J = 9,3, 0,8 Hz, 1H), 6,84 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 4,08-4,02 (m, 1H), 3,93-3,86 (m, 1H), 3,82-3,65 (m, 3H), 3,26 (s, 3H), 1,39 (dd, J = 8,6, 7,0 Hz, 6H) ESI MS (m/z): 361,05 [M+1].
549	((4-cloro-2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)imino)dietyl-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,33 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 9,06 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 8,63 (dd, J = 4,6, 1,5 Hz, 1H), 8,49 (dq, J = 8,3, 1,4 Hz, 1H), 7,62 (qd, J = 4,3, 0,6 Hz, 1H), 7,57 (dd, J = 8,9, 0,9 Hz, 1H), 7,36 (d, J = 8,9 Hz,

		1H), 3,35 (d, J = 7,0 Hz, 1H), 3,30-3,25 (m, 3H), 1,29 (t, J = 7,3 Hz, 6H) ESI MS (m/z): 348,85 [M+1].
550	((4-cloro-2-(piridin-3-il)-2H-indazol-5-il)imino)(etil)(isopropil)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,33 (d, J = 2,1 Hz, 1H), 9,04 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 8,62 (dd, J = 4,6, 1,2 Hz, 1H), 8,49 (dq, J = 8,4, 1,4 Hz, 1H), 7,61 (ddd, J = 8,3, 4,9, 0,6 Hz, 1H), 7,55 (dd, J = 9,2, 0,9 Hz, 1H), 7,39-7,36 (m, 1H), 3,56-3,49 (m, 1H), 3,28-3,24 (m, 2H), 1,40 (d, J = 6,7 Hz, 3H), 1,32 (d, J = 7,0 Hz, 3H), 1,29-1,22 (m, 3H); ESI MS (m/z): 362,90 [M+1].
551	1-óxido de 1-((4-cloro-2-(pirimidin-5-il)-2H-indazol-5-il)imino)tetrahidro-1H-λ ⁶ -tiofeno	¹ H-NMR (400 MHz, CLOROFORMO-D) δ 9,36-9,34 (m, 2H), 9,26 (s, 1H), 8,43 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 7,61 (dd, J = 9,0, 1,0 Hz, 1H), 7,44 (d, J = 9,3 Hz, 1H), 3,60-3,54 (m, 2H), 3,24-

		3,19 (m, 2H), 2,43-2,37 (m, 4H); ESI MS (m/z): 347,90 [M+1].
552	((4-cloro-2-(5-fluoropiridin-3-il)-2H-indazol-5-il)imino)diethyl- λ^6 -sulfanona	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9,25 (d, J = 9,0 Hz, 1H), 9,11 (s, 1H), 8,66 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,52 (dt, J = 10,1, 2,3 Hz, 1H), 7,57 (d, J = 8,3 Hz, 1H), 7,38 (d, J = 9,0 Hz, 1H), 3,35 (t, J = 7,1 Hz, 2H), 3,28 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 1,29 (t, J = 7,5 Hz, 6H) ESI MS (m/z): 366,85 [M+1].
553	((4-cloro-2-(5-fluoropiridin-3-il)-2H-indazol-5-il)imino)(etil)(isopropil)- λ^6 -sulfanona	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, CLOROFORMO-D) δ 9,02 (d, J = 1,7 Hz, 1H), 8,51 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,41-8,38 (m, 1H), 8,10 (dt, J = 9,0, 2,3 Hz, 1H), 7,54-7,46 (m, 2H), 3,53-3,46 (m, 1H), 3,31 (td, J = 14,4, 7,2 Hz, 1H), 3,18 (td, J = 14,4, 7,2 Hz, 1H), 1,56 (t, J = 7,0 Hz, 3H), 1,50 (d, J = 6,8 Hz, 3H), 1,44 (t,

		J = 7,5 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 380,90 [M+1].
--	--	--

Ejemplo 2: Síntesis de *N*-(dimetil(oxo)-λ⁶-sulfanoilideno)-2-(piridin-3-il)-2H-indazol-4-carboxamida **92**



Una solución de 4-bromo-2-(piridin-3-il)-2H-indazol (0,3 g, 1,094 mmol), iminodimetil-λ⁶-sulfanona (0,306 g, 3,28 mmol) en formamida de dimetilo (DMF) (5 mL) se trató con hexacarbonilo de molibdeno (Mo(CO)₆) (0,144 g, 0,547 mmol), tetrafluoroborato de tri-*tert*-butilfosfina (TTBP.HBF₄) (0,016 g, 0,055 mmol), dipaladio(II) trans-Di(μ-acetato)bis[o-(di-*o*-tolilfosfino)bencil] (catalizador de Herrman) (0,026 g, 0,027 mmol) y 1,8-diazabicyclo[5.4.0]undec-7-ene (DBU) (0,330 mL, 2,189 mmol), y se irradió en un dispositivo de microondas (MW) a 160 °C durante 1 h. Después de concluida la reacción, la mezcla de reacción se desactivó al añadir agua (10 mL) y se extrajo con acetato de etilo (2 × 25 mL). Las capas orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de sodio anhidro y se concentró a presión reducida para obtener un residuo aceitoso. Este residuo se purificó mediante HPLC preparativa de fase inversa para obtener la *N*-(dimetil(oxo)-λ⁶-sulfanoilideno)-2-(piridin-3-il)-2H-indazol-4-carboxamida **92** deseada (220 mg, 0,700 mmol, 63,9% de rendimiento).

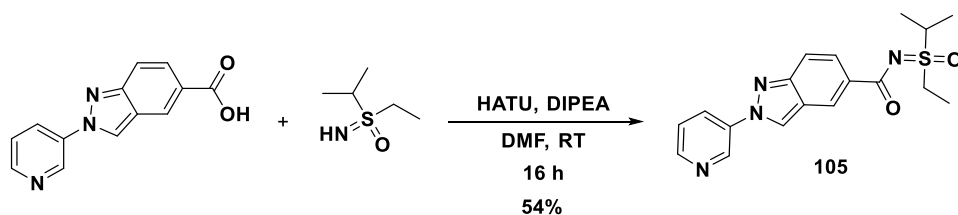
Tabla 2: Los compuestos representativos de la presente divulgación se prepararon según el método conforme se describe en el Ejemplo 2.

N.º de comp.	Nombres del compuesto	Datos analíticos
92	<i>N</i> -(dimetil(oxo)-λ ⁶ -sulfanoilideno)-2-(piridin-3-il)-2H-	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,37 (d, J = 1,0 Hz, 2H), 8,67 (dd, J = 4,6, 1,5 Hz, 1H), 8,55 (dq, J = 8,3, 1,4 Hz, 1H), 7,95 (dt,

	indazol-4-carboxamida	J = 8,6, 0,9 Hz, 1H), 7,88 (dd, J = 7,1, 0,7 Hz, 1H), 7,64 (ddd, J = 8,4, 4,8, 0,7 Hz, 1H), 7,43 (dd, J = 8,6, 7,0 Hz, 1H), 3,55 (s, 6H); ESI MS (m/z): 315 [M+1].
225	<i>N</i> -(butil(etil)(oxo)- λ^6 -sulfaneilideno)-2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-carboxamida	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9,54 (s, 2H), 9,45 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 9,28 (s, 1H), 8,55 (t, J = 1,1 Hz, 1H), 7,95 (dd, J = 9,2, 1,6 Hz, 1H), 7,77-7,74 (m, 1H), 3,68-3,52 (m, 4H), 1,83-1,72 (m, 2H), 1,46 (td, J = 14,7, 7,4 Hz, 2H), 1,34 (t, J = 7,3 Hz, 3H), 0,93 (t, J = 7,3 Hz, 3H); ESI MS(m/z):372,1 [M + 1].
226	<i>N</i> -(ciclohexil(metil)(oxo)- λ^6 -sulfanoilideno)-2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-carboxamida	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9,54 (s, 2H), 9,45 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 9,28 (s, 1H), 8,55 (s, 1H), 7,95 (dd, J = 9,2, 1,6 Hz, 1H), 7,76 (d, J = 9,3 Hz, 1H), 3,58-3,52 (m, 1H), 3,44 (s, 3H), 2,25-2,18 (m, 2H), 1,90 (d, J = 12,5 Hz, 2H), 1,69 (d, J = 13,0 Hz, 1H), 1,60-1,54 (m, 2H), 1,36 (dd, J = 13,0, 3,2 Hz, 2H), 1,23-1,20 (m, 1H); ESI MS(m/z):384,05 [M + 1].
227	<i>N</i> -(metil(oxo)(propil)- λ^6 -sulfanoilideno)-2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-carboxamida	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9,55 (d, J = 8,6 Hz, 2H), 9,46-9,44 (m, 1H), 9,28 (s, 1H), 8,54 (t, J = 1,2 Hz, 1H), 7,94 (dd, J = 9,2, 1,6 Hz, 1H), 7,76-7,74 (m, 1H), 3,65-3,52 (m, 2H), 3,45 (s, 3H), 1,92-1,80 (m, 2H), 1,05 (t, J = 7,5 Hz, 3H) ESI MS (m/z):344,0 [M + 1].
228	<i>N</i> -(dimetil(oxo)- λ^6 -sulfanoilideno)-2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9,54 (s, 2H), 9,45 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 9,28 (s, 1H), 8,54 (d,

	indazol-5-carboxamida	J = 0,9 Hz, 1H), 7,94 (dd, J = 9,2, 1,5 Hz, 1H), 7,76 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 3,48 (s, 6H) ESI MS (m/z):316,05 [M + 1].
230	<i>N</i> -(diisobutil(oxo)-λ ⁶ -sulfanoilideno)-2-(pirimidin-5-il)-2H-indazol-5-carboxamida	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,54 (s, 2H), 9,46 (s, 1H), 9,28 (s, 1H), 8,54 (s, 1H), 7,94 (dd, J = 9,2, 1,6 Hz, 1H), 7,76 (d, J = 9,3 Hz, 1H), 3,62 (dd, J = 14,1, 6,5 Hz, 2H), 3,47 (dd, J = 14,2, 6,4 Hz, 2H), 2,36 (q, J = 6,7 Hz, 2H), 1,08 (q, J = 3,3 Hz, 12H); ESI MS(m/z): 400,1 [M+1].
231	<i>N</i> -(dietil(oxo)-λ ⁶ -sulfanoilideno)-2-(pirimidin-5-il)-2H-indazol-5-carboxamida	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,54 (s, 2H), 9,44 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 9,28 (s, 1H), 8,56 (t, J = 1,2 Hz, 1H), 7,95 (dd, J = 9,2, 1,6 Hz, 1H), 7,77-7,74 (m, 1H), 3,67-3,56 (m, 4H), 1,34 (t, J = 7,3 Hz, 6H); ESI MS(m/z): 344,0 [M+1].

Ejemplo 3: Síntesis de *N*-(etil(isopropil)(oxo)-λ⁶-sulfanoilideno)-2-(piridin-3-il)-2H-indazol-5-carboxamida **105**



Una solución de ácido 2-(piridin-3-il)-2H-indazol-5-carboxílico (0,1 g, 0,418 mmol),etil(imino)(isopropil)- λ⁶-sulfanona (0,057 g, 0,418 mmol) en formamida de dimetilo (DMF) (2 mL) se trató con 3-óxido hexafluorofosfato de 1-[bis(dimetilamino)metileno]-1H-1,2,3-triazolo[4,5-*b*]piridinio (HATU) (0,159 g, 0,418 mmol) y *N*-etil-*N*-(propan-2-il)propan-2-amina (DIPEA) (0,110 mL, 0,627 mmol) y se agitó a 25 °C durante 16 h. Después de concluida la reacción, la mezcla de reacción se desactivó al añadir (5 mL) y se extrajo con acetato de

etilo (2 × 25 mL). Las capas orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de sodio anhidro y se concentraron a presión reducida para obtener un residuo aceitoso. Este residuo se purificó mediante cromatografía CombiFlash® (fase normal; gestión isocrática con 100% de acetato de etilo) para obtener la *N*-(etil(isopropil)(oxo)-λ⁶-sulfanoilideno)-2-(piridin-3-il)-2*H*-indazol-5-carboxamida **105** deseada (80 mg, 0,224 mmol, 53,7% de rendimiento).

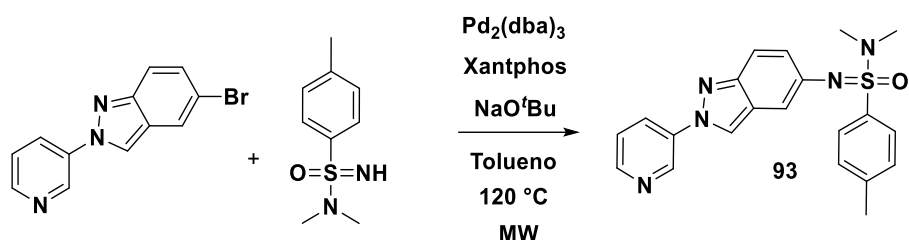
Tabla 3: Los compuestos representativos de la presente divulgación se prepararon según el material inicial y el método adecuados conforme se describe en el Ejemplo 3.

N.º de comp.	Nombres del compuesto	Datos analíticos
105	<i>N</i> -(etil(isopropil)(oxo)-λ ⁶ -sulfanoilideno)-2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-carboxamida	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,38 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 9,33 (d, J = 2,2 Hz, 1H), 8,67 (dd, J = 4,6, 1,2 Hz, 1H), 8,55 (q, J = 0,8 Hz, 1H), 8,49 (dq, J = 8,3, 1,4 Hz, 1H), 7,93 (dd, J = 9,2, 1,6 Hz, 1H), 7,74-7,72 (m, 1H), 7,66 (ddd, J = 8,3, 4,8, 0,6 Hz, 1H), 3,89-3,82 (m,

		1H), 3,74-3,59 (m, 2H), 1,45-1,38 (m, 6H), 1,37-1,27 (m, 4H); ESI MS (m/z):357 [M + 1].
106	<i>N</i> -(isopropil(metil)(oxo)- λ^6 -sulfanoilideno)-2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-carboxamida	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,38 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 9,33 (d, J = 2,2 Hz, 1H), 8,67 (dd, J = 4,6, 1,5 Hz, 1H), 8,54 (q, J = 0,8 Hz, 1H), 8,48 (dq, J = 8,3, 1,4 Hz, 1H), 7,93 (dd, J = 9,2, 1,6 Hz, 1H), 7,74 (dt, J = 9,2, 0,9 Hz, 1H), 7,66 (ddd, J = 8,4, 4,8, 0,7 Hz, 1H), 3,79-3,72 (m, 1H), 3,44 (s, 3H), 1,43 (q, J = 3,3 Hz, 6H);

		ESI MS (m/z):343 [M + 1].
107	<i>N</i> -(dietil(oxo)-λ ⁶ -sulfanoilideno)-2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-carboxamida	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,38 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 9,33 (d, J = 2,2 Hz, 1H), 8,67 (dd, J = 4,8, 1,3 Hz, 1H), 8,55 (q, J = 0,8 Hz, 1H), 8,49 (dq, J = 8,3, 1,4 Hz, 1H), 7,93 (dd, J = 9,2, 1,6 Hz, 1H), 7,73 (dt, J = 9,1, 0,9 Hz, 1H), 7,66 (ddd, J = 8,3, 4,6, 0,7 Hz, 1H), 3,67-3,55 (m, 4H), 1,34 (t, J = 7,3 Hz, 7H); ESI MS (m/z):343[M + 1].

Ejemplo 4: Síntesis de *N,N* 4-trimetil-*N'*-(2-(piridin-3-il)-2*H*-indazol-5-il) bencenosulfonimidamida **93**



Una solución de 5-bromo-2-(piridin-3-il)-2*H*-indazol (0,27 g, 0,985 mmol), *N,N* 4-trimetilbencenosulfonimidamida (0,195 g, 0,985 mmol) en tolueno (5 mL) se trató con tris(dibencilidenoacetona)dipaladio(0) ($\text{Pd}_2(\text{dba})_3$) (0,045 g, 0,049 mmol), (9,9-dimetil-9*H*-xanteno-4,5-diil)bis(difenilfosfano) (Xantphos) (0,057 g, 0,098 mmol) y *tert*-butóxido de sodio (0,095 g, 0,985 mmol), y se irradió en un microondas (MW) a 120°C durante 1 h. Después de concluida la reacción, la mezcla de reacción se desactivó al añadir agua (10 mL) y se extrajo con acetato de etilo (2×25 mL); las capas orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de sodio anhidro y se concentraron a presión reducida para obtener un residuo aceitoso. Este residuo se purificó por cromatografía CombiFlash® para obtener *N,N* 4-trimetil-*N'*-(2-(piridin-3-il)-2*H*-indazol-5-il)bencenosulfonimidamida **93** (133 mg, 0,340 mmol, 34,5% de rendimiento).

Tabla 4: Los compuestos representativos de la presente divulgación se prepararon según el material inicial y el método adecuados conforme se describe en el Ejemplo 4.

N.º de comp.	Nombres del compuesto	Datos analíticos
93	<i>N,N</i> , 4-trimetil- <i>N'</i> -(2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)bencenosulfonimidamida	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, $\text{DMSO-}d_6$) δ 9,27 (d, $J = 2,4$ Hz, 1H), 8,98 (d, $J = 0,7$ Hz,

		1H), 8,61 (dd, J = 4,6, 1,5 Hz, 1H), 8,42 (dq, J = 8,3, 1,4 Hz, 1H), 7,85 (d, J = 8,3 Hz, 2H), 7,64- 7,60 (m, 2H), 7,47 (d, J = 8,1 Hz, 2H), 7,34 (d, J = 1,2 Hz, 1H), 7,21 (dd, J = 9,3, 2,0 Hz, 1H), 2,61 (s, 6H), 2,42 (s, 3H) ESI MS (m/z): 392 [M+1].
94	<i>N'</i> -(2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> - indazol-5-il)- <i>N,N</i> ,4- trimetilbencenosulfonimidamida	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,20 (s, 1H), 9,03 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 8,64 (d,

		J = 2,4 Hz, 1H), 8,43 (dt, J = 10,1, 2,4 Hz, 1H), 7,85 (d, J = 8,3 Hz, 2H), 7,63 (d, J = 9,3 Hz, 1H), 7,47 (d, J = 8,1 Hz, 2H), 7,33 (t, J = 1,0 Hz, 1H), 7,22 (dd, J = 9,3, 2,0 Hz, 1H), 2,61 (s, 6H), 2,42 (s, 3H); ESI MS (m/z): 410 [M+1].
95	<i>N</i>, <i>N</i>,4-trimetil-<i>N'</i>-(2-(pirimidin-5-il)-2<i>H</i>-indazol-5-il)bencenosulfonimidamida	¹H-NMR (400 MHz, DMSO-<i>d</i>₆) δ 9,48 (s, 2H), 9,22 (s, 1H), 9,04 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 7,85 (d, J = 8,3 Hz,

		2H), 7,65 (d, J = 9,3 Hz, 1H), 7,47 (d, J = 8,1 Hz, 2H), 7,34 (d, J = 1,2 Hz, 1H), 7,23 (dd, J = 9,2, 2,1 Hz, 1H), 2,61 (s, 6H), 2,42 (s, 3H) ESI MS (m/z): 393 [M+1].
96	<i>N,N</i>, 4-trimetil-<i>N'</i>-(2-(piridin-3-il)-2<i>H</i>-indazol-4-il)bencenosulfonimidamida	¹H-NMR (400 MHz, DMSO-<i>d</i>₆) δ 9,41 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 9,31 (s, 1H), 8,63 (dd, J = 4,8, 1,3 Hz, 1H), 8,55 (dq, J = 8,4, 1,3 Hz, 1H), 7,97 (d, J = 8,3 Hz, 2H), 7,63

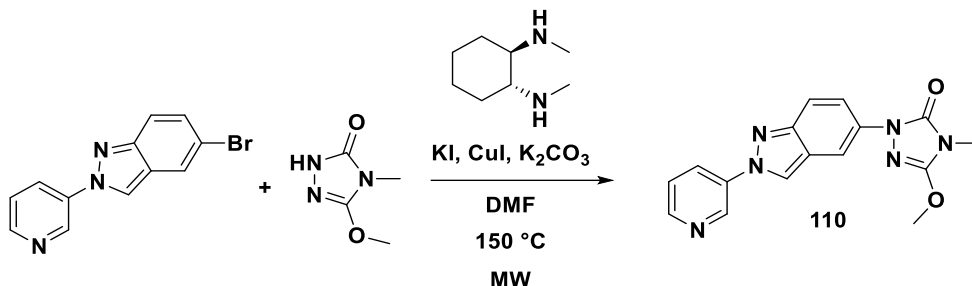
		(dd, J = 8,4, 4,8 Hz, 1H), 7,49 (d, J = 8,1 Hz, 2H), 7,25 (d, J = 8,8 Hz, 1H), 7,16 (dd, J = 8,6, 7,1 Hz, 1H), 6,76 (d, J = 7,1 Hz, 1H), 2,63 (s, 6H), 2,44 (d, J = 7,6 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 392 [M+1].
97	<i>N,N</i> ,4-trimetil- <i>N'</i> -(2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-4-il)bencenosulfonimidamida	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,60 (s, 2H), 9,39 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 9,24 (s, 1H), 7,97 (d, J = 8,3 Hz, 2H), 7,49 (d, J = 8,1 Hz, 2H), 7,26 (d,

		J = 8,6 Hz, 1H), 7,18 (dd, J = 8,6, 7,1 Hz, 1H), 6,76 (d, J = 6,8 Hz, 1H), 2,65 (d, J = 10,0 Hz, 6H), 2,45 (d, J = 7,8 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 393 [M+1].
98	<i>N'</i>-(2-(5-fluoropiridin-3-il)-2<i>H</i>-indazol-4-il)-<i>N,N</i>,4-trimetilbencenosulfonimidamida	¹H-NMR (400 MHz, DMSO-<i>d</i>₆) δ 9,36 (s, 1H), 9,33 (s, 1H), 8,66 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,58 (dt, J = 10,2, 2,3 Hz, 1H), 7,97 (d, J = 8,3 Hz, 2H), 7,50 (d, J = 8,1 Hz, 2H), 7,24 (d, J = 8,6 Hz,

		1H), 7,17 (dd, J = 8,7, 7,0 Hz, 1H), 6,76 (d, J = 6,8 Hz, 1H), 2,63 (s, 6H), 2,44 (s, 3H); ESI MS (m/z): 410 [M+1].
134	<i>N</i> -etil- <i>N</i> -metil- <i>N'</i> -(2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-4-il)etanosulfonimidamida	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,55 (s, 2H), 9,22 (s, 1H), 9,15 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 7,21-7,13 (m, 2H), 6,65 (dd, J = 6,8, 1,0 Hz, 1H), 3,33 (s, 2H), 3,27 (dd, J = 7,2, 5,7 Hz, 2H), 2,81 (s, 3H), 1,39 (t, J = 7,3 Hz,

		3H), 1,01 (t, J = 7,2 Hz, 3H); ESI MS (m/z):345,1 [M + 1].
135	<i>N</i> -etil- <i>N</i> -metil- <i>N'</i> -(2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)ciclopropanosulfonimidamida	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,47 (s, 2H), 9,21 (s, 1H), 9,01 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 7,59-7,57 (m, 1H), 7,18 (q, J = 0,9 Hz, 1H), 7,06 (dd, J = 9,2, 1,8 Hz, 1H), 3,28-3,20 (m, 3H), 2,81-2,77 (m, 4H), 1,11-0,97 (m, 6H); ESI MS (m/z):356,55 [M + 1].

Ejemplo 5: Síntesis de 5-metoxi-4-metil-2-(2-(piridin-3-il)-2*H*-indazol-5-il)-2,4-dihidro-3*H*-1,2,4-triazol-3-ona **110**



A una solución de 5-bromo-2-(piridin-3-il)-2*H*-indazol (0,6 g, 2,189 mmol), 5-metoxi-4-metil-2,4-dihidro-3*H*-1,2,4-triazol-3-ona (0,791 g, 6,13 mmol) en formamida de dimetilo (DMF) (6 mL), yoduro de cobre(I) (CuI) (0,083 g, 0,438 mmol), yoduro de potasio (KI) (0,109 g, 0,657 mmol) de *trans*-1,2-bis(metilamino)ciclohexano (0,249 g, 0,876 mmol) y carbonato de potasio (K₂CO₃) (0,908 g, 6,57 mmol) se añadieron y la mezcla se irradió en un dispositivo de microondas (MW) a 150 °C durante 1 h. Después de concluida la reacción, la mezcla de reacción se desactivó al añadir (20 mL) y se extrajo con acetato de etilo (3 × 25 mL). Las capas orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de sodio anhidro y se concentraron a presión reducida para obtener un residuo gomoso. Este residuo se purificó por cromatografía CombiFlash® para obtener 5-metoxi-4-metil-2-(2-(piridin-3-il)-2*N*-indazol-5-il)-2,4-dihidro-3*N*-1,2,4-triazol-3-ona **110** (0,184 g, 0,571 mmol, 26,1% de rendimiento).

Tabla 5: Los compuestos representativos de la presente divulgación se prepararon según el material inicial y el método adecuados conforme se describe en el Ejemplo 5.

N.º de comp.	Nombres del compuesto	Datos analíticos
110	5-metoxi-4-metil-2-(2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-2,4-	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,33 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 9,27 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 8,67 (dd, J = 4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,49 (dq, J = 8,3,

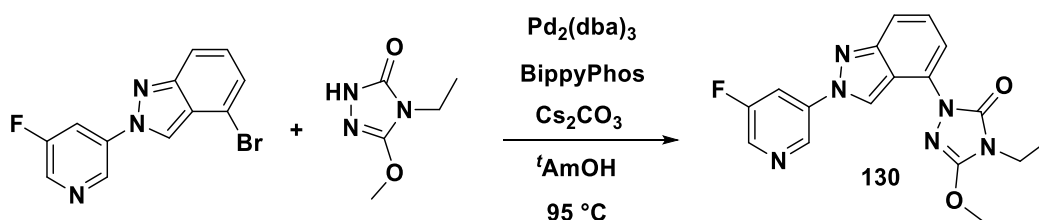
	dihidro-3 <i>H</i> -1,2,4-triazol-3-ona	1,4 Hz, 1H), 7,87-7,84 (m, 1H), 7,77 (q, J = 0,9 Hz, 1H), 7,66 (ddd, J = 8,3, 4,7, 0,7 Hz, 1H), 7,38 (dd, J = 9,2, 2,1 Hz, 1H), 3,04 (s, 3H), 3,01 (s, 3H); ESI MS (m/z): 322,6 [M+1].
111	5-metoxi-4-metil-2-(2-(5-metilpiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-2,4-dihidro-3 <i>H</i> -1,2,4-triazol-3-ona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,25 (s, 1H), 9,09-9,20 (m, 1H), 8,58 (s, 1H), 8,35 (s, 1H), 7,84 (d, J = 9,3 Hz, 1H), 7,76 (d, J = 1,2 Hz, 1H), 7,37 (dd, J = 9,3, 2,0 Hz, 1H), 3,02 (d, J = 10,5 Hz, 6H), 2,44 (s, 3H); ESI MS (m/z): 336,7 [M+1].
112	2-(2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-5-metoxi-4-metil-2,4-dihidro-3 <i>H</i> -1,2,4-triazol-3-ona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,31 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 9,26 (s, 1H), 8,70 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,52 (dt, J = 9,9, 2,3 Hz, 1H), 7,85 (d, J = 9,3 Hz, 1H), 7,76 (t, J = 1,0 Hz, 1H), 7,40 (dd, J = 9,3, 2,0 Hz, 1H), 3,04 (s, 3H), 3,01 (s, 3H); ESI MS (m/z): 341 [M+1].
113	5-metoxi-4-metil-2-(2-(2-metilpiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-2,4-dihidro-3 <i>H</i> -1,2,4-triazol-3-ona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,84 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 8,65 (dd, J = 4,6, 1,5 Hz, 1H), 7,97 (dd, J = 7,9, 1,5 Hz, 1H), 7,85-7,82 (m, 1H), 7,80 (q, J = 0,9 Hz, 1H), 7,51-7,48 (m, 1H), 7,36 (dd, J = 9,3, 2,0 Hz, 1H), 3,04 (d, J = 5,2 Hz, 3H), 3,01 (s, 3H), 2,42 (s, 3H); ESI MS (m/z): 336,9 [M+1].
114	5-metoxi-4-metil-2-(2-(4-metilpiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-2,4-dihidro-3 <i>H</i> -1,2,4-triazol-3-ona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,85 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 8,69 (s, 1H), 8,61 (d, J = 4,9 Hz, 1H), 7,87-7,83 (m, 1H), 7,80 (q, J = 0,9 Hz, 1H), 7,55 (d, J = 5,1 Hz, 1H), 7,36 (dd, J = 9,2, 2,1 Hz, 1H), 3,04 (s, 3H), 3,01 (s, 3H), 2,29 (s, 3H)

		ESI MS (m/z): 336,9 [M+1].
115	5-metoksi-4-metil-2-(2-(6-metilpiridin-3-il)-2H-indazol-5-il)-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-ona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,21 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 9,17 (d, J = 2,8 Hz, 1H), 8,36 (dd, J = 8,6, 2,8 Hz, 1H), 7,85-7,83 (m, 1H), 7,75 (q, J = 0,9 Hz, 1H), 7,50 (d, J = 8,6 Hz, 1H), 7,36 (dd, J = 9,3, 2,0 Hz, 1H), 3,03 (s, 3H), 3,01 (s, 3H), 2,56 (s, 3H) ESI MS (m/z): 336,9 [M+1].
116	2-(2-(2,6-dimetilpiridin-3-il)-2H-indazol-5-il)-5-metoksi-4-metil-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-ona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 8,78 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 7,84 (t, J = 1,1 Hz, 1H), 7,82-7,81 (m, 1H), 7,78 (q, J = 0,9 Hz, 1H), 7,36-7,31 (m, 2H), 3,04 (d, J = 5,8 Hz, 3H), 3,01 (s, 3H), 2,55 (s, 3H), 2,36 (s, 3H); ESI MS (m/z): 350,9 [M+1].
117	5-metoksi-2-(2-(5-metoxipiridin-3-il)-2H-indazol-5-il)-4-metil-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-ona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,30 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 8,94 (s, 1H), 8,40 (s, 1H), 8,07 (t, J = 2,4 Hz, 1H), 7,87-7,84 (m, 1H), 7,76 (q, J = 0,9 Hz, 1H), 7,38 (dd, J = 9,3, 2,0 Hz, 1H), 3,96 (s, 3H), 3,04 (s, 3H), 3,01 (s, 3H) ESI MS (m/z): 353 [M+1].
118	5-metoksi-4-metil-2-(2-(5-(trifluorometil)piridin-3-il)-2H-indazol-5-il)-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-ona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,66 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 9,44 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 9,07 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 8,89 (t, J = 1,8 Hz, 1H), 7,88-7,86 (m, 1H), 7,78 (q, J = 0,9 Hz, 1H), 7,41 (dd, J = 9,2, 2,1 Hz, 1H), 3,03 (d, J = 5,9 Hz, 3H), 3,01 (s, 3H) ESI MS (m/z): 391 [M+1].
119	5-metoksi-4-metil-2-(2-(pirimidin-5-il)-	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,54 (s, 2H), 9,33 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 9,28 (s, 1H), 7,87 (d,

	2 <i>H</i> -indazol-5-il)-2,4-dihidro-3 <i>H</i> -1,2,4-triazol-3-ona	J = 9,3 Hz, 1H), 7,79 (d, J = 1,5 Hz, 1H), 7,41 (dd, J = 9,3, 2,0 Hz, 1H), 3,04 (s, 3H), 3,01 (s, 3H); ESI MS (m/z): 324 [M+1].
120	2-(2-(5-cloropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-5-metoxi-4-metil-2,4-dihidro-3 <i>H</i> -1,2,4-triazol-3-ona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,99 (q, J = 1,2 Hz, 1H), 9,36 (dd, J = 5,9, 1,0 Hz, 1H), 9,11 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 8,27 (q, J = 2,9 Hz, 1H), 7,60-7,57 (m, 1H), 7,13 (q, J = 1,0 Hz, 1H), 7,01 (dd, J = 9,3, 2,0 Hz, 1H), 3,37 (dd, J = 10,1, 5,7 Hz, 2H), 3,16 (s, 3H), 1,79-1,72 (m, 2H), 1,38-1,26 (m, 4H), 0,84 (t, J = 7,1 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 356,6 [M+1].
121	4-bencil-5-metoxi-2-(2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-2,4-dihidro-3 <i>H</i> -1,2,4-triazol-3-ona	¹ H-NMR (400 MHz, CLOROFORMO-D) δ 9,20 (s, 1H), 8,71 (s, 1H), 8,50 (s, 1H), 8,29 (d, J = 8,1 Hz, 1H), 7,86 (d, J = 9,3 Hz, 1H), 7,68 (d, J = 1,2 Hz, 1H), 7,53-7,48 (m, 3H), 7,38-7,28 (m, 4H), 4,78 (s, 2H), 3,16 (s, 3H); ESI MS (m/z): 399,00 [M+1].
122	4-(2-fluorobencil)-5-metoxi-2-(2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-2,4-dihidro-3 <i>H</i> -1,2,4-triazol-3-ona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,33 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 9,28 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 8,67 (dd, J = 4,8, 1,3 Hz, 1H), 8,49 (dq, J = 8,3, 1,4 Hz, 1H), 7,87 (d, J = 9,3 Hz, 1H), 7,82 (d, J = 1,2 Hz, 1H), 7,66 (dd, J = 8,1, 4,4 Hz, 1H), 7,41-7,35 (m, 3H), 7,24-7,19 (m, 2H), 4,75 (s, 2H), 3,07 (s, 3H); ESI MS (m/z): 417,15 [M+1].
123	4-etil-5-metoxi-2-(2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-2,4-dihidro-3 <i>H</i> -1,2,4-triazol-3-ona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,35 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 9,29 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 8,69 (dd, J = 4,8, 1,3 Hz, 1H), 8,51 (dq, J = 8,3, 1,4 Hz, 1H), 7,89-7,86 (m, 1H), 7,80 (q, J = 0,9 Hz, 1H), 7,69-7,66 (m, 1H), 7,39 (dd,

		J = 9,3, 2,0 Hz, 1H), 3,56 (q, J = 7,2 Hz, 2H), 3,06 (s, 3H), 1,21 (t, J = 7,2 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 337,00 [M+1].
124	4-(4-fluorobencil)-5-metoxi-2-(2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-2,4-dihidro-3 <i>H</i> -1,2,4-triazol-3-ona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,33 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 9,28 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 8,67 (d, J = 4,6 Hz, 1H), 8,49 (dq, J = 8,3, 1,4 Hz, 1H), 7,87-7,85 (m, 1H), 7,81 (q, J = 1,0 Hz, 1H), 7,66 (q, J = 4,3 Hz, 1H), 7,42-7,36 (m, 3H), 7,22-7,17 (m, 2H), 4,68 (s, 2H), 3,06 (s, 3H); ESI MS (m/z): 417,15 [M+1].

Ejemplo 6: Síntesis de 4-etil-2-(2-(5-fluoropiridin-3-il)-2*H*-indazol-4-il)-5-metoxi-2,4-dihidro-3*H*-1,2,4-triazol-3-ona **130**



4-bromo-2-(5-fluoropiridin-3-il)-2*H*-indazol (300 mg, 1,027 mmol), 4-etil-5-metoxi-2,4-dihidro-3*H*-1,2,4-triazol-3-ona (162 mg, 1,130 mmol), tris(dibencilidenoacetona)dipaladio ($\text{Pd}_2(\text{dba})_3$) (103 mg, 0,113 mmol), 5-(di-*tert*-butilfosfino)-1', 3', 5'-trifenil-1'*H*-[1,4']bipirazol (BippyPhos) (97 mg, 0,191 mmol) y carbonato de cesio (Cs_2CO_3) (970 mg, 2,98 mmol) se cargaron en un matraz, con un condensador incorporado, en atmósfera de N_2 y se agitó esta mezcla de reacción. Se añadió alcohol amílico terciario (20 mL) y la solución resultante se calentó a 95°C en N_2 durante 16 h. Después de concluida la reacción, la mezcla de reacción se concentró a presión reducida para obtener un residuo oscuro, que se purificó mediante cromatografía CombiFlash® para obtener 4-etil-2-(2-(5-fluoropiridin-3-il)-2*H*-indazol-4-il)-5-metoxi-2,4-dihidro-3*H*-1,2,4-triazol-3-ona **130** (132,5 mg, 0,374 mmol, 36,4% de rendimiento).

Tabla 6: Se prepararon compuestos representativos de la presente divulgación según el material inicial y los métodos adecuados descritos en el Ejemplo 6.

N.º de comp.	Nombres del compuesto	Datos analíticos
125	5-metoxi-4-metil-2-(2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-4-il)-2,4-dihidro-3 <i>H</i> -1,2,4-triazol-3-ona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,33 (d, J = 2,2 Hz, 1H), 9,29 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 8,67 (dd, J = 4,6, 1,5 Hz, 1H), 8,50 (dq, J = 8,3, 1,4 Hz, 1H), 7,71 (dd, J = 7,3, 0,5 Hz, 1H), 7,65 (ddd, J = 8,3, 4,8, 0,6 Hz, 1H), 7,56-7,54 (m, 1H), 7,37 (dd, J = 8,6, 7,3 Hz, 1H), 4,18 (s, 3H), 3,15 (s, 3H); ESI MS (m/z): 322,40 [M+1].
126	4-(3-fluorobencil)-5-metoxi-2-(2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-2,4-dihidro-3 <i>H</i> -1,2,4-triazol-3-ona	¹ H-NMR (400 MHz, CLOROFORMO-D) δ 9,18 (s, 1H), 8,68 (s, 1H), 8,49 (s, 1H), 8,26 (d, J = 8,1 Hz, 1H), 7,84 (d, J = 9,3 Hz, 1H), 7,67 (d, J = 1,2 Hz, 1H), 7,50 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 7,34-7,27 (m, 2H), 7,24 (d, J = 7,6 Hz, 1H), 7,18 (dd, J = 9,4, 2,1 Hz, 1H), 7,02-6,97 (m, 1H), 4,75 (s, 2H), 3,16-3,14 (m, 3H); ESI MS (m/z): 417,00 [M+1].
127	4-ciclopropil-5-metoxi-2-(2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-2,4-dihidro-3 <i>H</i> -1,2,4-triazol-3-ona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,31 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 9,20 (s, 1H), 8,65 (dd, J = 4,8, 1,3 Hz, 1H), 8,46 (dq, J = 8,4, 1,3 Hz, 1H), 8,12 (d, J = 1,2 Hz, 1H), 7,94 (dd, J = 9,3, 2,0 Hz, 1H), 7,81 (d, J = 9,3 Hz, 1H), 7,64 (dd, J = 8,4, 4,8 Hz, 1H), 4,05 (d, J = 5,9 Hz, 3H), 2,82-2,77 (m, 1H), 0,97-0,89 (m, 4H); ESI MS (m/z): 349,900 [M+1].

128	4-ciclopropil-5-metoxi-2-(2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-4-il)-2,4-dihidro-3 <i>H</i> -1,2,4-triazol-3-ona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,55 (s, 2H), 9,36 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 9,28 (s, 1H), 7,72 (d, J = 6,8 Hz, 1H), 7,55 (d, J = 8,8 Hz, 1H), 7,39 (dd, J = 8,7, 7,5 Hz, 1H), 4,17 (s, 3H), 2,84 (s, 1H), 0,95 (dd, J = 9,4, 2,8 Hz, 4H) ESI MS (m/z): 350,20 [M+1].
129	4-etil-5-metoxi-2-(2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-4-il)-2,4-dihidro-3 <i>H</i> -1,2,4-triazol-3-ona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,56 (s, 2H), 9,38 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 9,29 (s, 1H), 7,74 (d, J = 7,3 Hz, 1H), 7,56 (d, J = 8,8 Hz, 1H), 7,40 (dd, J = 8,7, 7,5 Hz, 1H), 4,20 (s, 3H), 3,65 (q, J = 7,3 Hz, 2H), 1,24 (t, J = 7,2 Hz, 3H) ESI MS (m/z): 338,05 [M+1].
130	4-etil-2-(2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-4-il)-5-metoxi-2,4-dihidro-3 <i>H</i> -1,2,4-triazol-3-ona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,34 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 9,27 (s, 1H), 8,71 (d, J = 2,2 Hz, 1H), 8,55 (dt, J = 9,9, 2,4 Hz, 1H), 7,71 (d, J = 6,6 Hz, 1H), 7,55 (d, J = 8,6 Hz, 1H), 7,39 (dd, J = 8,8, 7,3 Hz, 1H), 4,20 (s, 3H), 3,65 (q, J = 7,2 Hz, 2H), 1,24 (t, J = 7,2 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 355,20 [M+1].
131	4-etil-5-metoxi-2-(2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-2,4-dihidro-3 <i>H</i> -1,2,4-triazol-3-ona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,52 (s, 2H), 9,27 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 9,26 (s, 1H), 8,15 (q, J = 0,9 Hz, 1H), 7,98 (dd, J = 9,5, 2,0 Hz, 1H), 7,85 (d, J = 9,5 Hz, 1H), 4,07 (s, 3H), 3,61 (q, J = 7,3 Hz, 2H), 1,22 (t, J = 7,2 Hz, 4H) ESI MS (m/z): 338,20 [M+1].

132	4-ciclopropil-2-(2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-5-metoxi-2,4-dihidro-3 <i>H</i> -1,2,4-triazol-3-ona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,24 (d, J = 0,7 Hz, 2H), 8,68 (d, J = 2,2 Hz, 1H), 8,49-8,47 (m, 1H), 8,11 (t, J = 1,0 Hz, 1H), 7,95 (dd, J = 9,3, 2,0 Hz, 1H), 7,81 (d, J = 9,5 Hz, 1H), 4,04 (s, 3H), 2,80 (s, 1H), 0,95-0,91 (m, 4H) ESI MS (m/z): 367,20 [M+1].
133	4-etil-2-(2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-5-metoxi-2,4-dihidro-3 <i>H</i> -1,2,4-triazol-3-ona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,25-9,24 (m, 2H), 8,68 (d, J = 2,2 Hz, 1H), 8,48 (dt, J = 9,9, 2,3 Hz, 1H), 8,13 (q, J = 0,9 Hz, 1H), 7,97 (dd, J = 9,4, 2,1 Hz, 1H), 7,82 (d, J = 9,5 Hz, 1H), 4,07 (s, 3H), 3,61 (q, J = 7,2 Hz, 2H), 1,21 (t, J = 7,2 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 355,00 [M+1].
319	2-(2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-5-metoxi-4-(3-metilbutan-2-il)-2,4-dihidro-3 <i>H</i> -1,2,4-triazol-3-ona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,25 (t, J = 1,3 Hz, 2H), 8,69-8,68 (m, 1H), 8,49 (dt, J = 10,0, 2,3 Hz, 1H), 8,14 (q, J = 0,9 Hz, 1H), 7,97 (dd, J = 9,4, 2,1 Hz, 1H), 7,83-7,81 (m, 1H), 4,06 (s, 3H), 3,72 (td, J = 7,0, 2,9 Hz, 1H), 2,17-2,12 (m, 1H), 1,40 (d, J = 7,1 Hz, 3H), 0,97 (d, J = 6,6 Hz, 3H), 0,80 (d, J = 6,8 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 397,10 [M+1].
320	4-ciclopropil-2-(2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-4-il)-5-metoxi-2,4-dihidro-3 <i>H</i> -1,2,4-triazol-3-ona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,31 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 9,27 (s, 1H), 8,71 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 8,54 (dd, J = 10,0, 2,2 Hz, 1H), 7,69 (d, J = 6,8 Hz, 1H), 7,54 (d, J = 8,6 Hz, 1H), 7,38 (dd, J = 8,8, 7,3 Hz, 1H), 4,17 (s, 3H), 2,84 (s, 1H), 0,96 (d,

		J = 6,6 Hz, 4H); ESI MS (m/z): 367,05 [M+1].
321	4-ciclopropil-5-metoxi-2-(2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-4-il)-2,4-dihidro-3 <i>H</i> -1,2,4-triazol-3-ona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,33 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 9,27 (s, 1H), 8,67 (d, J = 3,4 Hz, 1H), 8,51-8,48 (m, 1H), 7,69 (d, J = 6,8 Hz, 1H), 7,65 (dd, J = 8,4, 4,8 Hz, 1H), 7,54 (d, J = 8,8 Hz, 1H), 7,38-7,34 (m, 1H), 4,16 (s, 3H), 2,84 (s, 1H), 0,97-0,94 (m, 4H); ESI MS (m/z): 349,05 [M+1].
322	5-metoxi-4-(3-metilbutan-2-il)-2-(2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-2,4-dihidro-3 <i>H</i> -1,2,4-triazol-3-ona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,32 (d, J = 2,2 Hz, 1H), 9,21 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 8,65 (dd, J = 4,6, 1,5 Hz, 1H), 8,47 (dq, J = 8,5, 1,3 Hz, 1H), 8,15 (q, J = 1,0 Hz, 1H), 7,96 (dd, J = 9,5, 2,0 Hz, 1H), 7,82 (d, J = 9,5 Hz, 1H), 7,66-7,63 (m, 1H), 4,06 (s, 3H), 3,72 (dd, J = 9,9, 7,0 Hz, 1H), 2,17-2,12 (m, 1H), 1,40 (d, J = 6,8 Hz, 3H), 0,97 (d, J = 6,8 Hz, 3H), 0,80 (d, J = 6,6 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 379,25 [M+1].
323	4-ciclopropil-5-metoxi-2-(2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-2,4-dihidro-3 <i>H</i> -1,2,4-triazol-3-ona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,52 (s, 2H), 9,27-9,26 (m, 2H), 8,13 (t, J = 1,1 Hz, 1H), 7,96 (dd, J = 9,5, 2,0 Hz, 1H), 7,83 (d, J = 9,3 Hz, 1H), 4,04 (s, 3H), 2,81-2,78 (m, 1H), 0,95-0,91 (m, 4H); ESI MS (m/z): 350,20 [M+1].
324	4-etil-5-metoxi-2-(2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-4-il)-2,4-	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,34 (d, J = 2,2 Hz, 1H), 9,30 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 8,67 (dd, J = 4,8, 1,3 Hz, 1H), 8,50 (dq, J = 8,3, 1,4 Hz, 1H), 7,72-7,70 (m, 1H), 7,65

	dihidro-3 <i>H</i> -1,2,4-triazol-3-ona	(ddd, $J = 8,3, 4,6, 0,7$ Hz, 1H), 7,55 (d, $J = 8,8$ Hz, 1H), 7,37 (dd, $J = 8,7, 7,5$ Hz, 1H), 4,19 (s, 3H), 3,65 (q, $J = 7,3$ Hz, 2H), 1,24 (t, $J = 7,2$ Hz, 3H); ESI MS (m/z): 337,25 [M+1].
325	2-(2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-5-metoxi-4-(2,2,2-trifluoroetil)-2,4-dihidro-3 <i>H</i> -1,2,4-triazol-3-ona	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9,28 (s, 1H), 9,25 (s, 1H), 8,69 (d, $J = 2,4$ Hz, 1H), 8,49 (dt, $J = 9,9, 2,3$ Hz, 1H), 8,13 (d, $J = 1,0$ Hz, 1H), 7,94 (dd, $J = 9,4, 2,1$ Hz, 1H), 7,86 (d, $J = 9,3$ Hz, 1H), 4,50 (q, $J = 9,1$ Hz, 2H), 4,09 (d, $J = 9,8$ Hz, 3H) ESI MS (m/z): 408,60 [M+1].
326	5-etoxi-2-(2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-4-(3-(trifluorometil)bencil)-2,4-dihidro-3 <i>H</i> -1,2,4-triazol-3-ona	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9,53 (s, 2H), 9,28 (s, 1H), 8,15 (d, $J = 1,2$ Hz, 1H), 7,98 (dd, $J = 9,4, 2,1$ Hz, 1H), 7,85 (d, $J = 9,5$ Hz, 1H), 7,72 (d, $J = 8,3$ Hz, 2H), 7,63 (d, $J = 5,1$ Hz, 2H), 4,89 (s, 2H), 4,45 (q, $J = 7,1$ Hz, 2H), 1,36 (t, $J = 7,0$ Hz, 3H), 1,18-1,29 (1H); ESI MS (m/z): 481,5 [M+1].
327	5-etoxi-2-(2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-4-il)-4-(3-(trifluorometil)bencil)-2,4-dihidro-3 <i>H</i> -1,2,4-triazol-3-ona	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9,32 (d, $J = 2,2$ Hz, 1H), 9,27 (d, $J = 1,0$ Hz, 1H), 8,67 (dd, $J = 4,8, 1,3$ Hz, 1H), 8,49 (dq, $J = 8,3, 1,4$ Hz, 1H), 7,75-7,71 (m, 3H), 7,66-7,63 (m, 3H), 7,57 (d, $J = 8,6$ Hz, 1H), 7,38 (dd, $J = 8,7, 7,5$ Hz, 1H), 4,93 (s, 2H), 4,59 (q, $J = 7,0$ Hz, 2H), 1,39 (t, $J = 7,1$ Hz, 3H) ESI MS (m/z): 480,55 [M+1].

328	5-etoxi-2-(2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-4-il)-4-(3-(trifluorometil)bencil)-2,4-dihidro-3 <i>H</i> -1,2,4-triazol-3-ona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,31 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 9,26 (s, 1H), 8,71 (d, J = 2,2 Hz, 1H), 8,55-8,52 (m, 1H), 7,73 (t, J = 7,1 Hz, 3H), 7,64 (d, J = 5,6 Hz, 2H), 7,56 (d, J = 8,8 Hz, 1H), 7,40 (dd, J = 8,7, 7,5 Hz, 1H), 4,93 (s, 2H), 4,60 (q, J = 7,0 Hz, 2H), 1,39 (t, J = 7,1 Hz, 3H) ESI MS (m/z): 498,55 [M+1].
329	5-etoxi-2-(2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-4-il)-4-(3-(trifluorometil)bencil)-2,4-dihidro-3 <i>H</i> -1,2,4-triazol-3-ona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,55 (s, 2H), 9,35 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 9,28 (s, 1H), 7,76-7,71 (m, 3H), 7,65-7,63 (m, 2H), 7,58 (d, J = 8,8 Hz, 1H), 7,40 (dd, J = 8,7, 7,5 Hz, 1H), 4,93 (s, 2H), 4,61 (q, J = 7,1 Hz, 2H), 1,39 (t, J = 7,1 Hz, 3H) ESI MS (m/z): 482,15 [M+1].
330	5-etoxi-2-(2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-4-(3-(trifluorometil)bencil)-2,4-dihidro-3 <i>H</i> -1,2,4-triazol-3-ona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,32 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 9,22 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 8,65 (dd, J = 4,8, 1,3 Hz, 1H), 8,48-8,45 (m, 1H), 8,14 (t, J = 1,0 Hz, 1H), 7,95 (dd, J = 9,5, 2,0 Hz, 1H), 7,83 (d, J = 9,5 Hz, 1H), 7,73-7,70 (m, 2H), 7,66-7,63 (m, 3H), 4,89 (s, 2H), 4,45 (q, J = 7,0 Hz, 2H), 1,36 (t, J = 7,1 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 481,05 [M+1].
331	5-etoxi-2-(2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-4-il)-4-(4-(trifluorometoxi)bencil)-	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,31 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 9,21 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 8,65 (dd, J = 4,6, 1,5 Hz, 1H), 8,46 (dq, J = 8,3, 1,4 Hz, 1H), 8,14 (q, J = 0,9 Hz, 1H), 7,95 (dd, J = 9,5, 2,1 Hz, 1H), 7,84-

	2,4-dihidro-3 <i>H</i> -1,2,4-triazol-3-ona	7,81 (m, 1H), 7,66-7,63 (m, 1H), 7,48-7,45 (m, 2H), 7,39-7,37 (m, 2H), 4,81 (s, 2H), 4,45 (q, J = 7,0 Hz, 2H), 1,37 (t, J = 7,0 Hz, 3H) ESI MS (m/z): 497,10 [M+1].
332	5-etoxi-2-(2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-4-il)-4-(4-(trifluorometoxi)bencil)-2,4-dihidro-3 <i>H</i> -1,2,4-triazol-3-ona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,52 (s, 2H), 9,28-9,26 (m, 2H), 8,15 (q, J = 0,9 Hz, 1H), 7,97 (dd, J = 9,5, 2,1 Hz, 1H), 7,85 (d, J = 9,5 Hz, 1H), 7,47 (d, J = 8,9 Hz, 2H), 7,38 (d, J = 7,9 Hz, 2H), 4,81 (s, 2H), 4,45 (q, J = 7,0 Hz, 2H), 1,37 (t, J = 7,0 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 497,95 [M+1].
333	5-metoxi-2-(2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-4-il)-4-(4-(trifluorometoxi)bencil)-2,4-dihidro-3 <i>H</i> -1,2,4-triazol-3-ona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,34 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 9,31 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 8,67 (dd, J = 4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,50 (dq, J = 8,3, 1,4 Hz, 1H), 7,72 (dd, J = 7,3, 0,6 Hz, 1H), 7,66-7,63 (m, 1H), 7,57 (d, J = 8,9 Hz, 1H), 7,49-7,47 (m, 2H), 7,40-7,36 (m, 3H), 4,86 (s, 2H), 4,18 (s, 3H) ESI MS (m/z): 482,90 [M+1].
334	5-metoxi-2-(2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-4-il)-4-(4-(trifluorometoxi)bencil)-2,4-dihidro-3 <i>H</i> -1,2,4-triazol-3-ona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,56 (s, 2H), 9,39 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 9,28 (s, 1H), 7,75 (d, J = 7,0 Hz, 1H), 7,58 (d, J = 8,6 Hz, 1H), 7,48 (dd, J = 9,2, 2,4 Hz, 2H), 7,41-7,37 (m, 3H), 4,87 (s, 2H), 4,19 (s, 3H); ESI MS (m/z): 483,85 [M+1].
335	5-metoxi-2-(2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-4-	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,32 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 9,22 (d, J = 0,9 Hz, 1H),

	(3-(trifluorometil)bencil)-2,4-dihidro-3 <i>H</i> -1,2,4-triazol-3-ona	8,65 (dd, $J = 4,6, 1,5$ Hz, 1H), 8,47 (dq, $J = 8,3, 1,3$ Hz, 1H), 8,16 (q, $J = 0,9$ Hz, 1H), 7,96 (dd, $J = 9,5, 2,1$ Hz, 1H), 7,84 (d, $J = 9,5$ Hz, 1H), 7,72-7,69 (m, 2H), 7,66-7,62 (m, 3H), 4,90 (s, 2H), 4,06 (s, 3H) ESI MS (m/z): 467,00 [M+1].
336	4-(4-fluorobencil)-5-metoxi-2-(2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-4-il)-2,4-dihidro-3 <i>H</i> -1,2,4-triazol-3-ona	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9,34 (d, $J = 2,4$ Hz, 1H), 9,30 (d, $J = 0,9$ Hz, 1H), 8,67 (dd, $J = 4,6, 1,5$ Hz, 1H), 8,50 (dq, $J = 8,4, 1,3$ Hz, 1H), 7,72 (dd, $J = 7,3, 0,6$ Hz, 1H), 7,66-7,63 (m, 1H), 7,56 (d, $J = 8,9$ Hz, 1H), 7,42-7,38 (m, 3H), 7,21 (tt, $J = 9,3, 2,5$ Hz, 2H), 4,81 (s, 2H), 4,18 (s, 3H) ESI MS (m/z): 417,00 [M+1].
337	5-etoxi-4-(4-fluorobencil)-2-(2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-2,4-dihidro-3 <i>H</i> -1,2,4-triazol-3-ona	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9,31 (d, $J = 2,4$ Hz, 1H), 9,21 (d, $J = 0,9$ Hz, 1H), 8,65 (dd, $J = 4,6, 1,2$ Hz, 1H), 8,46 (dq, $J = 8,3, 1,4$ Hz, 1H), 8,13 (q, $J = 0,9$ Hz, 1H), 7,94 (dd, $J = 9,3, 2,0$ Hz, 1H), 7,82 (d, $J = 9,5$ Hz, 1H), 7,64 (q, $J = 4,2$ Hz, 1H), 7,41-7,36 (m, 2H), 7,23-7,18 (m, 2H), 4,76 (s, 2H), 4,44 (q, $J = 7,0$ Hz, 2H), 1,37 (t, $J = 7,0$ Hz, 3H); ESI MS (m/z): 431,30 [M+1].
338	5-etoxi-2-(2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-4-il)-4-(4-(trifluorometoxi)bencil)-	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9,26-9,24 (m, 2H), 8,68 (d, $J = 2,4$ Hz, 1H), 8,49 (dt, $J = 10,0, 2,3$ Hz, 1H), 8,13 (q, $J = 0,9$ Hz, 1H), 7,96 (dd, $J = 9,5, 1,8$ Hz, 1H), 7,83 (d,

	2,4-dihidro-3 <i>H</i> -1,2,4-triazol-3-ona	J = 9,5 Hz, 1H), 7,47 (d, J = 8,9 Hz, 2H), 7,38 (d, J = 8,3 Hz, 2H), 4,81 (s, 2H), 4,45 (q, J = 7,1 Hz, 2H), 1,37 (t, J = 7,0 Hz, 3H) ESI MS (m/z): 515,15 [M+1].
339	4-(4-fluorobencil)-5-metoxi-2-(2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-2,4-dihidro-3 <i>H</i> -1,2,4-triazol-3-ona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 10,05 (q, J = 1,3 Hz, 1H), 9,42-9,41 (m, 2H), 8,34 (q, J = 2,9 Hz, 1H), 8,15 (q, J = 0,9 Hz, 1H), 8,01 (dd, J = 9,5, 2,0 Hz, 1H), 7,86 (d, J = 9,5 Hz, 1H), 7,39 (dd, J = 8,8, 5,4 Hz, 2H), 7,22-7,18 (m, 2H), 4,77 (s, 2H), 4,06 (s, 3H); ESI MS (m/z): 418,15 [M+1].
340	4-(4-fluorobencil)-2-(2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-4-il)-5-metoxi-2,4-dihidro-3 <i>H</i> -1,2,4-triazol-3-ona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,35 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 9,27 (s, 1H), 8,71 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 8,54 (dt, J = 9,9, 2,3 Hz, 1H), 7,72 (d, J = 7,1 Hz, 1H), 7,56 (d, J = 8,8 Hz, 1H), 7,41-7,37 (m, 3H), 7,21 (t, J = 8,9 Hz, 2H), 4,81 (s, 2H), 4,18 (s, 3H); ESI MS (m/z): 435,10 [M+1].
341	5-etoxi-4-(4-fluorobencil)-2-(2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-2,4-dihidro-3 <i>H</i> -1,2,4-triazol-3-ona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 10,05 (dd, J = 2,9, 1,0 Hz, 1H), 9,42-9,41 (m, 2H), 8,33 (q, J = 2,9 Hz, 1H), 8,13 (q, J = 0,9 Hz, 1H), 8,00 (dd, J = 9,5, 2,0 Hz, 1H), 7,85 (d, J = 9,3 Hz, 1H), 7,41-7,37 (m, 2H), 7,23-7,18 (m, 2H), 4,76 (s, 2H), 4,45 (q, J = 7,0 Hz, 2H), 1,37 (t, J = 7,1 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 432,35 [M+1].
342	5-etoxi-4-(4-fluorobencil)-2-(2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,25-9,24 (m, 2H), 8,68 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 8,49 (dt, J = 10,0, 2,3 Hz, 1H), 8,12 (q, J = 0,9 Hz,

	indazol-5-il)-2,4-dihidro-3 <i>H</i> -1,2,4-triazol-3-ona	1H), 7,96 (dd, J = 9,5, 2,0 Hz, 1H), 7,82 (d, J = 9,5 Hz, 1H), 7,41-7,37 (m, 2H), 7,23-7,18 (m, 2H), 4,76 (s, 2H), 4,44 (q, J = 7,0 Hz, 2H), 1,37 (t, J = 7,1 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 449,20 [M+1].
343	5-etoxi-4-(4-fluorobencil)-2-(2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-4-il)-2,4-dihidro-3 <i>H</i> -1,2,4-triazol-3-ona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,32 (d, J = 2,2 Hz, 1H), 9,26 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 8,67 (dd, J = 4,8, 1,3 Hz, 1H), 8,49 (dq, J = 8,3, 1,4 Hz, 1H), 7,72-7,70 (m, 1H), 7,66-7,63 (m, 1H), 7,56 (d, J = 8,6 Hz, 1H), 7,43-7,35 (m, 3H), 7,24-7,19 (m, 2H), 4,80 (s, 2H), 4,58 (q, J = 7,1 Hz, 2H), 1,40 (t, J = 7,1 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 431,25 [M+1].
344	5-etoxi-4-(4-fluorobencil)-2-(2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-4-il)-2,4-dihidro-3 <i>H</i> -1,2,4-triazol-3-ona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,55 (s, 2H), 9,34 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 9,28 (s, 1H), 7,74 (dd, J = 7,5, 0,6 Hz, 1H), 7,57 (d, J = 8,8 Hz, 1H), 7,43-7,38 (m, 3H), 7,24-7,19 (m, 2H), 4,80 (s, 2H), 4,60 (q, J = 7,0 Hz, 2H), 1,40 (t, J = 7,1 Hz, 3H) ESI MS (m/z): 432,40 [M+1].
345	5-etoxi-4-(4-fluorobencil)-2-(2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-4-il)-2,4-dihidro-3 <i>H</i> -1,2,4-triazol-3-ona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,30 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 9,26 (s, 1H), 8,71 (d, J = 2,2 Hz, 1H), 8,53 (dt, J = 9,9, 2,4 Hz, 1H), 7,72-7,70 (m, 1H), 7,56 (d, J = 8,6 Hz, 1H), 7,43-7,37 (m, 3H), 7,25-7,19 (m, 2H), 4,80 (s, 2H), 4,59 (q, J = 7,1 Hz, 2H), 1,40 (t, J = 7,1 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 449,04 [M+1].

346	2-(2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-5-metoxi-4-(3-(trifluorometil)bencil)-2,4-dihidro-3 <i>H</i> -1,2,4-triazol-3-ona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,26-9,25 (m, 2H), 8,69 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 8,49 (dt, J = 10,0, 2,3 Hz, 1H), 8,15 (q, J = 1,0 Hz, 1H), 7,98 (dd, J = 9,5, 2,0 Hz, 1H), 7,84 (d, J = 9,5 Hz, 1H), 7,72-7,69 (m, 2H), 7,65-7,62 (m, 2H), 4,90 (s, 2H), 4,06 (s, 3H); ESI MS (m/z): 485,25 [M+1].
347	2-(3-cloro-2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-5-metoxi-4-metil-2,4-dihidro-3 <i>H</i> -1,2,4-triazol-3-ona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,00 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,81 (dd, J = 4,9, 1,5 Hz, 1H), 8,26 (dq, J = 8,2, 1,3 Hz, 1H), 7,87 (dd, J = 9,3, 0,7 Hz, 1H), 7,72 (ddd, J = 8,2, 4,8, 0,7 Hz, 1H), 7,64 (q, J = 1,0 Hz, 1H), 7,47 (dd, J = 9,3, 2,0 Hz, 1H), 3,04 (d, J = 4,4 Hz, 3H), 3,01 (s, 3H); ESI MS (m/z): 356,85 [M+1].
348	4-(4-clorobencil)-5-metoxi-2-(2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-2,4-dihidro-3 <i>H</i> -1,2,4-triazol-3-ona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 10,05 (q, J = 1,2 Hz, 1H), 9,42-9,41 (m, 2H), 8,34 (q, J = 2,9 Hz, 1H), 8,15 (d, J = 1,2 Hz, 1H), 8,01 (dd, J = 9,5, 2,1 Hz, 1H), 7,86 (d, J = 9,5 Hz, 1H), 7,45-7,42 (m, 2H), 7,36 (d, J = 8,6 Hz, 2H), 4,78 (s, 2H), 4,05 (s, 3H); ESI MS (m/z): 434,15 [M+1].
349	4-(4-clorobencil)-5-metoxi-2-(2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-4-il)-2,4-dihidro-3 <i>H</i> -1,2,4-triazol-3-ona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,56 (s, 2H), 9,39 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 9,28 (s, 1H), 7,75 (d, J = 7,0 Hz, 1H), 7,58 (d, J = 8,9 Hz, 1H), 7,46-7,36 (m, 5H), 4,83 (s, 2H), 4,19 (s, 3H) ESI MS (m/z): 434,20 [M+1].

350	4-(4-clorobencil)-5-etoxi-2-(2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-4-il)-2,4-dihidro-3 <i>H</i> -1,2,4-triazol-3-ona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,55 (s, 2H), 9,34 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 9,28 (s, 1H), 7,74 (d, J = 7,0 Hz, 1H), 7,57 (d, J = 8,9 Hz, 1H), 7,47-7,44 (m, 2H), 7,42-7,36 (m, 3H), 4,83-4,77 (m, 2H), 4,60 (q, J = 7,0 Hz, 2H), 1,40 (t, J = 7,0 Hz, 3H) ESI MS (m/z): 447,95 [M+1].
351	4-(4-clorobencil)-5-etoxi-2-(2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-4-il)-2,4-dihidro-3 <i>H</i> -1,2,4-triazol-3-ona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,30 (d, J = 0,6 Hz, 1H), 9,26 (s, 1H), 8,71 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,53 (dt, J = 10,0, 2,4 Hz, 1H), 7,71 (d, J = 7,0 Hz, 1H), 7,56 (d, J = 8,9 Hz, 1H), 7,47-7,44 (m, 2H), 7,41-7,37 (m, 3H), 4,81 (s, 2H), 4,59 (q, J = 7,0 Hz, 2H), 1,40 (t, J = 7,0 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 464,95 [M+1].
352	5-metoxi-2-(2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-4-il)-4-(3-(trifluorometil)bencil)-2,4-dihidro-3 <i>H</i> -1,2,4-triazol-3-ona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,34 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 9,31 (d, J = 0,6 Hz, 1H), 8,67 (dd, J = 4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,50 (dq, J = 8,3, 1,4 Hz, 1H), 7,74-7,70 (m, 3H), 7,66-7,63 (m, 3H), 7,57 (d, J = 8,9 Hz, 1H), 7,38 (dd, J = 8,7, 7,5 Hz, 1H), 4,94 (s, 2H), 4,18 (s, 3H); ESI MS (m/z): 467,00 [M+1].
353	2-(2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-4-il)-5-metoxi-4-(4-(trifluorometoxi)bencil)-2,4-dihidro-3 <i>H</i> -1,2,4-triazol-3-ona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,35 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 9,28 (s, 1H), 8,71 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,55 (dt, J = 10,0, 2,4 Hz, 1H), 7,72 (d, J = 6,7 Hz, 1H), 7,57 (d, J = 8,6 Hz, 1H), 7,48 (d, J = 8,9 Hz, 2H), 7,40 (t, J = 8,1 Hz, 3H), 4,87 (s, 2H), 4,19 (s, 3H); ESI MS (m/z): 501,20 [M+1].

354	4-(4-clorobencil)-5-metoxi-2-(2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-2,4-dihidro-3 <i>H</i> -1,2,4-triazol-3-ona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,32 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 9,22 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 8,65 (dd, J = 4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,47 (dq, J = 8,3, 1,4 Hz, 1H), 8,15 (q, J = 0,9 Hz, 1H), 7,96 (dd, J = 9,5, 2,1 Hz, 1H), 7,83 (d, J = 9,5 Hz, 1H), 7,66-7,63 (m, 1H), 7,45-7,42 (m, 2H), 7,37-7,34 (m, 2H), 4,78 (s, 2H), 4,05 (s, 3H); ESI MS (m/z): 433,10 [M+1].
355	4-(2-fluorobencil)-2-(2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-5-metoxi-2,4-dihidro-3 <i>H</i> -1,2,4-triazol-3-ona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,26-9,25 (m, 2H), 8,69 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 8,49 (dt, J = 9,9, 2,3 Hz, 1H), 8,14 (t, J = 1,0 Hz, 1H), 7,97 (dd, J = 9,5, 2,0 Hz, 1H), 7,84 (d, J = 9,5 Hz, 1H), 7,41-7,33 (m, 2H), 7,26-7,19 (m, 2H), 4,84 (s, 2H), 4,05 (s, 3H); ESI MS (m/z): 434,90 [M+1].
356	4-(2-fluorobencil)-5-metoxi-2-(2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-4-il)-2,4-dihidro-3 <i>H</i> -1,2,4-triazol-3-ona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,34 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 9,31 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 8,67 (dd, J = 4,6, 1,2 Hz, 1H), 8,50 (dq, J = 8,3, 1,4 Hz, 1H), 7,72 (d, J = 7,3 Hz, 1H), 7,64 (dd, J = 8,1, 4,4 Hz, 1H), 7,56 (d, J = 8,6 Hz, 1H), 7,41-7,35 (m, 3H), 7,27-7,20 (m, 2H), 4,88 (s, 2H), 4,17 (s, 3H) ESI MS (m/z): 416,90 [M+1].
357	4-(2-fluorobencil)-5-metoxi-2-(2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-4-il)-2,4-dihidro-3 <i>H</i> -1,2,4-triazol-3-ona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,56 (s, 2H), 9,39 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 9,28 (s, 1H), 7,75 (d, J = 6,8 Hz, 1H), 7,57 (d, J = 8,8 Hz, 1H), 7,42-7,35 (m, 3H), 7,26-7,20 (m, 2H),

		4,88 (s, 2H), 4,18 (s, 3H); ESI MS (m/z): 417,95 [M+1].
358	5-etoxi-4-(2-fluorobencil)-2-(2-(piridin-3-il)-2H-indazol-5-il)-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-ona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,31 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 9,21 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 8,65 (dd, J = 4,6, 1,5 Hz, 1H), 8,47 (dq, J = 8,3, 1,4 Hz, 1H), 8,13 (q, J = 0,9 Hz, 1H), 7,94 (dd, J = 9,4, 2,1 Hz, 1H), 7,82 (d, J = 9,5 Hz, 1H), 7,64 (dd, J = 8,3, 4,9 Hz, 1H), 7,41-7,35 (m, 2H), 7,26-7,19 (m, 2H), 4,83 (s, 2H), 4,43 (q, J = 7,0 Hz, 2H), 1,34 (t, J = 7,1 Hz, 3H) ESI MS (m/z): 430,90 [M+1].
359	5-etoxi-4-(2-fluorobencil)-2-(2-(piridin-3-il)-2H-indazol-4-il)-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-ona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,32 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 9,26 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 8,67 (dd, J = 4,6, 1,2 Hz, 1H), 8,49 (dq, J = 8,3, 1,4 Hz, 1H), 7,71 (d, J = 6,8 Hz, 1H), 7,64 (q, J = 4,2 Hz, 1H), 7,56 (d, J = 8,8 Hz, 1H), 7,42-7,35 (m, 3H), 7,27-7,20 (m, 2H), 4,87 (s, 2H), 4,57 (q, J = 7,1 Hz, 2H), 1,37 (t, J = 7,1 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 430,90 [M+1].
360	5-etoxi-4-(2-fluorobencil)-2-(2-(pirimidin-5-il)-2H-indazol-4-il)-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-ona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,55 (s, 2H), 9,35 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 9,28 (s, 1H), 7,74 (d, J = 7,1 Hz, 1H), 7,57 (d, J = 8,8 Hz, 1H), 7,42-7,37 (m, 3H), 7,27-7,20 (m, 2H), 4,87 (s, 2H), 4,59 (q, J = 7,0 Hz, 2H), 1,37 (t, J = 7,0 Hz, 3H) ESI MS (m/z): 431,95 [M+1].
361	5-etoxi-4-(2-fluorobencil)-2-(2-(5-	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,25-9,24 (m, 2H), 8,68 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,49 (dt, J

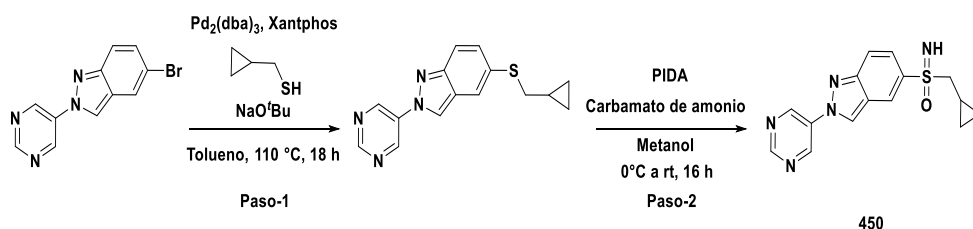
	fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-2,4-dihidro-3 <i>H</i> -1,2,4-triazol-3-ona	= 10,0, 2,3 Hz, 1H), 8,13 (d, J = 1,2 Hz, 1H), 7,96 (dd, J = 9,5, 2,0 Hz, 1H), 7,83 (d, J = 9,5 Hz, 1H), 7,41-7,35 (m, 2H), 7,26-7,19 (m, 2H), 4,83 (s, 2H), 4,43 (q, J = 7,0 Hz, 2H), 1,34 (t, J = 7,0 Hz, 3H) ESI MS (m/z): 449,25 [M+1].
362	4-(3-fluorobencil)-2-(2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-5-metoxi-2,4-dihidro-3 <i>H</i> -1,2,4-triazol-3-ona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,20-9,32 (2H), 8,63-8,75 (1H), 8,41-8,55 (1H), 8,09-8,20 (1H), 7,94-8,03 (1H), 7,79-7,89 (1H), 7,36-7,48 (1H), 7,09-7,23 (3H), 4,76-4,85 (2H), 4,02-4,09 (3H); ESI MS (m/z): 435,25 [M+1].
363	4-(3-fluorobencil)-5-metoxi-2-(2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-4-il)-2,4-dihidro-3 <i>H</i> -1,2,4-triazol-3-ona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,56 (s, 2H), 9,40 (s, 1H), 9,28 (s, 1H), 7,75 (d, J = 7,1 Hz, 1H), 7,58 (d, J = 8,8 Hz, 1H), 7,46-7,39 (m, 2H), 7,19-7,14 (m, 3H), 4,85 (s, 2H), 4,19 (s, 3H); ESI MS (m/z): 418,15 [M+1].
364	5-etoxi-4-(3-fluorobencil)-2-(2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-2,4-dihidro-3 <i>H</i> -1,2,4-triazol-3-ona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,25 (d, J = 5,9 Hz, 2H), 8,69 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,49 (dt, J = 9,9, 2,3 Hz, 1H), 8,14 (d, J = 1,2 Hz, 1H), 7,97 (dd, J = 9,5, 2,0 Hz, 1H), 7,83 (d, J = 9,5 Hz, 1H), 7,43 (dd, J = 14,1, 8,2 Hz, 1H), 7,18-7,14 (m, 3H), 4,80 (s, 2H), 4,45 (q, J = 7,0 Hz, 2H), 1,37 (t, J = 7,1 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 449,15 [M+1].
365	4-(3-fluorobencil)-5-metoxi-2-(2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-4-il)-2,4-	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,34 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 9,32 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 8,67 (dd, J = 4,6, 1,5 Hz, 1H), 8,51 (dq, J = 8,3,

	dihidro-3 <i>H</i> -1,2,4-triazol-3-ona	1,3 Hz, 1H), 7,72 (d, J = 6,8 Hz, 1H), 7,65 (dd, J = 8,1, 4,4 Hz, 1H), 7,57 (d, J = 8,6 Hz, 1H), 7,46-7,36 (m, 2H), 7,19-7,14 (m, 3H), 4,85 (s, 2H), 4,18 (s, 3H) ESI MS (m/z): 417,05 [M+1].
366	5-etoxi-4-(3-fluorobencil)-2-(2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-4-il)-2,4-dihidro-3 <i>H</i> -1,2,4-triazol-3-ona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,33 (d, J = 2,2 Hz, 1H), 9,27 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 8,67 (dd, J = 4,6, 1,5 Hz, 1H), 8,49 (dq, J = 8,3, 1,4 Hz, 1H), 7,71 (d, J = 6,8 Hz, 1H), 7,65 (q, J = 4,2 Hz, 1H), 7,56 (d, J = 8,8 Hz, 1H), 7,46-7,36 (m, 2H), 7,19-7,14 (m, 3H), 4,84 (s, 2H), 4,59 (q, J = 7,0 Hz, 2H), 1,40 (t, J = 7,1 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 431,00 [M+1].
367	4-(2-clorobencil)-5-metoxi-2-(2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-2,4-dihidro-3 <i>H</i> -1,2,4-triazol-3-ona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,32 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 9,22 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 8,65 (dd, J = 4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,47 (dq, J = 8,4, 1,3 Hz, 1H), 8,17 (t, J = 0,9 Hz, 1H), 7,98 (dd, J = 9,3, 2,0 Hz, 1H), 7,84 (d, J = 9,5 Hz, 1H), 7,66-7,63 (m, 1H), 7,52-7,50 (m, 1H), 7,38-7,34 (m, 2H), 7,27-7,25 (m, 1H), 4,87 (s, 2H), 4,04 (s, 3H); ESI MS (m/z): 433,05 [M+1].
368	4-(3,4-diclorobencil)-5-metoxi-2-(2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-2,4-dihidro-3 <i>H</i> -1,2,4-triazol-3-ona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,32 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 9,22 (s, 1H), 8,65 (dd, J = 4,9, 1,2 Hz, 1H), 8,48-8,46 (m, 1H), 8,15 (d, J = 1,5 Hz, 1H), 7,96 (dd, J = 9,5, 1,8 Hz, 1H), 7,84 (d, J = 9,5 Hz, 1H), 7,65 (q, J = 4,2 Hz, 3H), 7,32 (dd, J = 8,3, 1,8 Hz, 1H), 4,80 (s,

		2H), 4,06 (s, 3H); ESI MS (m/z): 467,00 [M+1].
369	4-(2,4-diclorobencil)-5-metoxi-2-(2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-2,4-dihidro-3 <i>H</i> -1,2,4-triazol-3-ona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,32 (d, J = 2,1 Hz, 1H), 9,22 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 8,65 (dd, J = 4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,47 (dq, J = 8,3, 1,4 Hz, 1H), 8,16 (d, J = 1,2 Hz, 1H), 7,97 (dd, J = 9,3, 2,0 Hz, 1H), 7,84 (d, J = 9,5 Hz, 1H), 7,69 (d, J = 2,1 Hz, 1H), 7,67-7,63 (m, 1H), 7,45 (dd, J = 8,6, 2,1 Hz, 1H), 7,33 (d, J = 8,6 Hz, 1H), 4,85 (s, 2H), 4,04 (s, 3H) ESI MS (m/z): 467,00 [M+1].
370	5-metoxi-4-metil-2-(2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -pirazol[3,4- <i>c</i>]piridin-5-il)-2,4-dihidro-3 <i>H</i> -1,2,4-triazol-3-ona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,55 (s, 2H), 9,34-9,30 (m, 3H), 8,06 (d, J = 1,2 Hz, 1H), 4,05 (s, 3H), 3,14 (s, 3H) ESI MS (m/z): 425,1 [M+1].
371	2-(2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -pirazol[3,4- <i>c</i>]piridin-5-il)-5-metoxi-4-metil-2,4-dihidro-3 <i>H</i> -1,2,4-triazol-3-ona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,40 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 9,31-9,29 (m, 2H), 8,78 (d, J = 2,2 Hz, 1H), 8,58 (dt, J = 9,8, 2,3 Hz, 1H), 8,07 (d, J = 1,2 Hz, 1H), 4,03 (s, 3H), 3,12 (s, 3H); ESI MS (m/z): 341,9 [M+1].
374	4-(2-clorobencil)-5-metoxi-2-(2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-2,4-dihidro-3 <i>H</i> -1,2,4-triazol-3-ona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 10,05 (d, J = 1,8 Hz, 1H), 9,42 (d, J = 6,1 Hz, 2H), 8,34 (q, J = 3,0 Hz, 1H), 8,16 (d, J = 1,2 Hz, 1H), 8,03 (dd, J = 9,5, 1,8 Hz, 1H), 7,87 (d, J = 9,5 Hz, 1H), 7,51 (t, J = 4,6 Hz, 1H), 7,37-7,35 (m, 2H), 7,27 (d, J = 4,9 Hz, 1H), 4,87 (s, 2H), 4,04 (s, 3H); ESI MS (m/z): 434,00 [M+1].

375	4-(3,4-diclorobencil)-5-metoxi-2-(2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-2,4-dihidro-3 <i>H</i> -1,2,4-triazol-3-ona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 10,05 (q, J = 1,2 Hz, 1H), 9,43-9,41 (m, 2H), 8,34 (q, J = 2,9 Hz, 1H), 8,15 (d, J = 1,2 Hz, 1H), 8,02 (dd, J = 9,5, 1,8 Hz, 1H), 7,86 (d, J = 9,5 Hz, 1H), 7,65-7,63 (m, 2H), 7,32 (dd, J = 8,4, 2,0 Hz, 1H), 4,80 (s, 2H), 4,06 (s, 3H); ESI MS (m/z): 468,00 [M+1].
379	4-(4-clorobencil)-5-etoxi-2-(2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -pirazol[4,3- <i>b</i>]piridin-5-il)-2,4-dihidro-3 <i>H</i> -1,2,4-triazol-3-ona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,56 (d, J = 4,9 Hz, 2H), 9,48 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 9,29 (s, 1H), 8,36 (dd, J = 9,5, 1,0 Hz, 1H), 8,13 (d, J = 9,5 Hz, 1H), 7,45 (dd, J = 6,6, 2,2 Hz, 2H), 7,38-7,35 (m, 2H), 4,78 (s, 2H), 4,46 (q, J = 7,1 Hz, 2H), 1,37 (t, J = 7,1 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 449,10 [M+1].

Ejemplo 7: Síntesis de (ciclopropilmetil)(imino)2-(pirimidin-5-il)-2*H*-indazol-5-il)-λ⁶-sulfanona **450**



Paso 1: Síntesis de 5-((ciclopropilmetil)tio)-2-(pirimidin-5-il)-2*H*-indazol

A una solución agitada de 5-bromo-2-(pirimidin-5-il)-2*H*-indazol (15 g, 54,5 mmol) en tolueno (200 mL), se le añadieron Xantphos (9,46 g, 16,36 mmol) y *tert*-butóxido sódico (10,48 g, 109 mmol) en una atmósfera de N₂; la mezcla de reacción se desgasificó con nitrógeno durante 15 min y se añadieron tris(dibencilideneacetona)dipaladio (9,99 g, 10,90 mmol) y ciclopropilmetanotiol (5,77 mL, 65,4 mmol). La mezcla resultante se calentó a 110 °C durante 18 h y, después de completada la reacción, la mezcla de reacción se filtró sobre celite y se lavó con acetato de etilo. El filtrado se secó en sulfato de sodio anhidro, se

filtró y se concentró a presión reducida para obtener un semisólido crudo. El compuesto crudo se purificó con cromatografía CombiFlash® para obtener 5-((ciclopropilmetil)tio)-2-(pirimidin-5-il)-2*H*-indazol (15 g, 53,1 mmol, 97% de rendimiento).

Paso 2: Síntesis de (ciclopropilmetil)(imino)(2-(pirimidin-5-il)-2*H*-indazol-5-il)- λ^6 -sulfanona **450**

A una solución agitada de 5-((ciclopropilmetil)tio)-2-(pirimidin-5-il)-2*H*-indazol (15 g, 53,1 mmol) en metanol (230 mL), se le añadió carbamato de amonio (18,66 g, 239 mmol) a 0 °C. La mezcla de reacción se llevó a temperatura ambiente (25 °C) y se agitó durante 1 h a dicha temperatura. La mezcla de reacción se enfrió nuevamente hasta 0 °C y se le añadió (diacetoxiyodo)benceno (PIDA, 37,6 g, 117 mmol). La solución resultante se agitó a 25 °C durante 16 h. Después de completar la reacción, se concentró metanol a presión reducida y el residuo crudo se diluyó con volúmenes de agua mínimos (1 x 50 mL). Esta solución se volvió a acidificar con HCl concentrado (pH = 1-2), y se extrajo la capa acuosa con acetato etílico (3 x 200 mL) para eliminar las impurezas orgánicas residuales no polares. Luego, la capa acuosa se basificó con una solución de bicarbonato de sodio (pH = 8) y se extrajo con cloroformo (3 x 250 mL). Las capas orgánicas combinadas se lavaron además con una solución de salmuera (1 x 250 mL), se secaron sobre sulfato de sodio anhidro, se filtraron y se concentraron a presión reducida para obtener un sólido crudo. Este sólido crudo se trituyó con metil *tert*-butil éter para obtener (ciclopropilmetil)(imino)(2-(pirimidin-5-il)-2*H*-indazol-5-il)- λ^6 -sulfanona **450** (10 g, 31,9 mmol, 60% de rendimiento).

Tabla 7: Los compuestos representativos de la presente divulgación se prepararon según los materiales iniciales y métodos adecuados descritos en el Ejemplo 7.

N.º de comp.	Nombres del compuesto	Datos analíticos
--------------	-----------------------	------------------

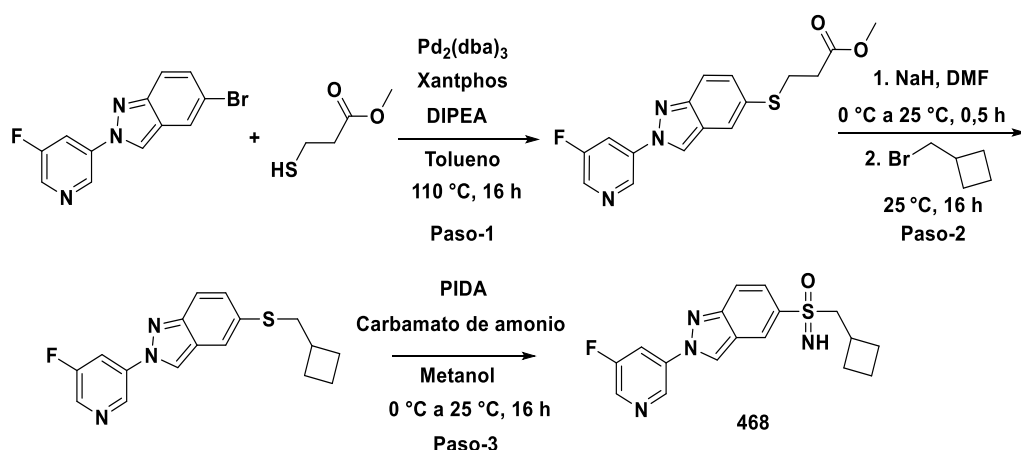
380	imino(isopropil)(2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-4-il)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,38 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 9,29 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 8,69 (dd, J = 4,8, 1,3 Hz, 1H), 8,57 (dq, J = 8,3, 1,4 Hz, 1H), 8,07-8,05 (m, 1H), 7,67-7,64 (m, 2H), 7,54 (dd, J = 8,7, 7,0 Hz, 1H), 4,41 (s, 1H), 3,52-3,45 (m, 1H), 1,18 (q, J = 3,3 Hz, 6H); ESI MS (m/z): 300,55 [M+1].
381	imino(isopropil)(2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,48 (d, J = 0,6 Hz, 1H), 9,36-9,33 (m, 1H), 8,71-8,68 (m, 1H), 8,50 (dq, J = 8,3, 1,4 Hz, 1H), 8,39 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 7,90 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 7,72-7,66 (m, 2H), 4,16 (s, 1H), 3,29-3,24 (m, 1H), 1,20-1,11 (m, 6H); ESI MS (m/z): 301,25 [M+1].
384	<i>tert</i> -butil(imino)(2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,47 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 9,33 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,70 (dd, J = 4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,50 (dq, J = 8,3, 1,4 Hz, 1H), 8,39 (d, J = 0,6 Hz, 1H), 7,89 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 7,72-7,66 (m, 2H), 1,24 (d, J = 12,8 Hz, 11H) ESI MS (m/z): 314,55 [M+1].
385	butil(imino)(2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,39 (s, 1H), 9,32 (d, J = 2,8 Hz, 1H), 8,69 (d, J = 3,7 Hz, 1H), 8,48 (d, J = 8,3 Hz, 1H), 8,44 (s, 1H), 7,88 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 7,76 (dd, J = 9,0, 1,7 Hz, 1H), 7,66 (q, J = 4,2 Hz, 1H), 3,92 (d, J = 1,5 Hz, 1H), 3,17 (t, J = 7,8 Hz, 2H), 1,56 (dd, J = 15,6, 8,3 Hz,

		2H), 1,32 (q, J = 7,4 Hz, 2H), 0,82 (t, J = 7,5 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 315,2 [M+1].
386	(ciclopropilmetil)(imino)(2-(piridin-3-il)-2H-indazol-5-il)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,43-9,53 (1H), 9,30-9,40 (1H), 8,65-8,74 (1H), 8,47-8,57 (1H), 8,39-8,47 (1H), 7,85-7,94 (1H), 7,73-7,78 (1H), 7,65-7,71 (1H), 4,09-4,26 (1H), 3,07-3,20 (2H), 0,73-1,02 (1H), 0,24-0,45 (2H), -0,10-0,14 (2H) ESI MS (m/z): 313 [M+1].
387	etil(imino)(2-(piridin-3-il)-2H-indazol-5-il)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,48 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 9,34 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,70 (dd, J = 4,8, 1,3 Hz, 1H), 8,51 (dq, J = 8,3, 1,4 Hz, 1H), 8,41 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 7,91 (d, J = 9,0 Hz, 1H), 7,73 (dd, J = 9,0, 1,7 Hz, 1H), 7,68 (dd, J = 8,1, 4,9 Hz, 1H), 4,20 (s, 1H), 3,17 (q, J = 7,3 Hz, 2H), 1,08 (t, J = 7,3 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 286,85 [M+1].
393	(2-(5-fluoropiridin-3-il)-2H-pirazol[3,4-b]piridin-5-il)(imino)(isopropil)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,55 (s, 1H), 9,30 (s, 1H), 9,02 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,85 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,78 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 8,61 (dt, J = 9,9, 2,4 Hz, 1H), 4,51 (s, 1H), 3,43-3,36 (m, 1H), 1,19 (dd, J = 6,6, 4,2 Hz, 6H) ESI MS (m/z): 319,5 [M+1].
395	(2-(5-fluoropiridin-3-il)-2H-indazol-5-	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,52 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 9,27 (s, 1H), 8,74 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,55 (dt, J = 9,8, 2,3 Hz, 1H),

	il)(imino)(isopropil)- λ^6 -sulfanona	8,39 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 7,90 (d, J = 9,3 Hz, 1H), 7,72 (dd, J = 9,3, 1,7 Hz, 1H), 4,18 (s, 1H), 3,26 (t, J = 6,7 Hz, 1H), 1,16 (q, J = 3,3 Hz, 6H); ESI MS (m/z): 318,5 [M+1].
409	(ciclopropilmetil)(2-(5-fluoropiridin-3-il)-2H-indazol-5-il)(imino)- λ^6 -sulfanona	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9,52 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 9,28 (s, 1H), 8,74 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 8,55 (dt, J = 9,9, 2,3 Hz, 1H), 8,44 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 7,89 (d, J = 9,3 Hz, 1H), 7,77 (dd, J = 9,0, 1,7 Hz, 1H), 4,20 (s, 1H), 3,19-3,10 (m, 2H), 0,94-0,87 (m, 1H), 0,38-0,34 (m, 2H), 0,04-0,01 (m, 2H); ESI MS (m/z): 330,5 [M+1].
410	imino(isopropil)(2-(pirimidin-5-il)-2H-indazol-5-il)- λ^6 -sulfanona	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9,56-9,54 (m, 3H), 9,31 (s, 1H), 8,42 (q, J = 0,8 Hz, 1H), 7,92 (dt, J = 9,2, 0,9 Hz, 1H), 7,73 (dd, J = 9,2, 1,5 Hz, 1H), 4,18 (s, 1H), 3,28 (d, J = 6,7 Hz, 1H), 1,18-1,14 (m, 6H); ESI MS (m/z): 301,5 [M+1].
450	(ciclopropilmetil)(imino)(2-(pirimidin-5-il)-2H-indazol-5-il)- λ^6 -sulfanona	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9,56-9,53 (m, 3H), 9,31 (s, 1H), 8,46 (d, J = 0,6 Hz, 1H), 7,91 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 7,78 (dd, J = 9,2, 1,5 Hz, 1H), 4,21 (s, 1H), 3,18-3,12 (m, 2H), 0,93-0,86 (m, 1H), 0,38-0,33 (m, 2H), 0,01 (dd, J = 4,6, 3,1 Hz, 2H) ESI MS (m/z): 313,9 [M+1].
454	(3-cloro-2-(piridin-3-il)-2H-indazol-5-	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9,03 (d, J = 2,1 Hz, 1H), 8,82 (dd, J = 4,6, 1,5 Hz,

il)(ciclopropilmetil)(imino)- λ^6 -sulfanona	1H), 8,32-8,29 (m, 2H), 7,91 (dd, J = 9,2, 0,9 Hz, 1H), 7,83 (dd, J = 9,2, 1,5 Hz, 1H), 7,74 (ddd, J = 8,3, 4,9, 0,6 Hz, 1H), 4,29 (s, 1H), 3,19 (d, J = 7,3 Hz, 2H), 0,91 (s, 1H), 0,38 (dq, J = 8,0, 1,5 Hz, 2H), 0,05-0,03 (m, 2H) ESI MS (m/z): 346,9 [M+1].
---	---

Ejemplo 8: Síntesis de (ciclobutilmetil)(2-(5-fluoropiridin-3-il)-2*H*-indazol-5-il)(imino)- λ^6 -sulfanona **468**



Paso 1: Síntesis de 3-((2-(5-fluoropiridin-3-il)-2*H*-indazol-5-il)tio)propanoato de metilo

A una solución desgasificada de 5-bromo-2-(5-fluoropiridin-3-il)-2*H*-indazol (10 g, 34,2 mmol) en tolueno (150 mL), se le añadieron Xantphos (9,90 g, 17,12 mmol), *N,N*-diisopropiletilamina (11,93 mL, 68,5 mmol), tris(dibencilidenacetona)dipaladio (9,40 g, 10,27 mmol) y 3-mercaptopropanoato de metilo (4,55 mL, 41,1 mmol), en una atmósfera de N_2 ; la mezcla de reacción resultante se calentó a 110 °C durante 16 h. Después de completada la reacción, se enfrió hasta temperatura ambiente, se filtró sobre celite y se lavó con acetato de etilo. El filtrado se secó en sulfato de sodio anhidro, se filtró y se concentró a presión reducida, para obtener un residuo crudo que se purificó con cromatografía CombiFlash® para obtener el 3-((2-(5-fluoropiridin-3-il)-2*H*-

indazol-5-il)tio)propanoato de metilo deseado (10 g, 30,2 mmol, 88% de rendimiento) como un sólido de color amarillo pálido.

Paso 2: Síntesis de 5-((ciclobutilmetil)tio)-2-(5-fluoropiridin-3-il)-2*H*-indazol

A una solución agitada de 3-((2-(5-fluoropiridin-3-il)-2*H*-indazol-5-il)tio)propanoato de metilo (4 g, 12,07 mmol) en *N,N*-dimetilformamida (20 mL), se le añadió hidruro de sodio (60% dispersado en aceite mineral, 0,966 g, 24,14 mmol) a 0 °C y se agitó durante 0,5 h; luego se añadió (bromometil)ciclobutano (2,71 mL, 24,14 mmol) a la misma temperatura, y la mezcla de reacción resultante se agitó a 25 °C durante 16 h. Después de completada la reacción, se neutralizó con agua (100 mL) y se extrajo con acetato de etilo (3 x 100 mL). La capa orgánica combinada se secó en sulfato de sodio anhidro, se filtró y se concentró a presión reducida para obtener el compuesto crudo 5-((ciclobutilmetil)tio)-2-(5-fluoropiridin-3-il)-2*H*-indazol (3,5 g, 11,17 mmol, 93% de rendimiento), que fue directamente utilizado en el paso siguiente.

Paso 3: Síntesis de (ciclobutilmetil)(2-(5-fluoropiridin-3-il)-2*H*-indazol-5-il)(imino)-λ⁶-sulfanona **468**

A una solución agitada de 5-((ciclobutilmetil)tio)-2-(5-fluoropiridin-3-il)-2*H*-indazol (3,78 g, 12,06 mmol) en metanol (50 mL), se agregó carbamato de amonio (4,24 g, 54,3 mmol) a 0 °C y se agitó por 0,5 h a 25 °C. De a poco se agregó diacetato de yodobenceno (8,55 g, 26,5 mmol) a 0 °C y la mezcla resultante se agitó a 25 °C por 16 h. Luego de completar la reacción, se concentró la mezcla de reacción bajo presión reducida, se neutralizó con bicarbonato de sodio y se extrajo con diclorometano (3 x 50 mL). La capa orgánica combinada se secó en sulfato de sodio anhidro, se filtró y se concentró bajo presión reducida para obtener un sólido crudo. El compuesto crudo se purificó por cromatografía CombiFlash® para obtener (ciclobutilmetil)(2-(5-fluoropiridin-3-il)-2*H*-indazol-5-il)(imino)-λ⁶-sulfanona **468** (2,3 g, 6,68 mmol, rendimiento de 55%).

Tabla 8: Se prepararon compuestos representativos de la presente divulgación según el material inicial y los métodos adecuados descritos en el Ejemplo 8.

N.º de comp.	Nombres del compuesto	Datos analíticos
455	etil(imino)(2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,56-9,54 (m, 3H), 9,30 (d, J = 3,4 Hz, 1H), 8,43 (t, J = 0,8 Hz, 1H), 7,93 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 7,75 (dd, J = 9,2, 1,8 Hz, 1H), 4,23 (s, 1H), 3,20-3,15 (m, 2H), 1,08 (t, J = 7,3 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 288 [M+1].
458	imino(2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)(2,2,2-trifluoroetil)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,58-9,56 (m, 3H), 9,32 (d, J = 4,9 Hz, 1H), 8,56 (d, J = 0,6 Hz, 1H), 7,95 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 7,84 (dd, J = 9,2, 1,8 Hz, 1H), 5,03 (s, 1H), 4,64 (q, J = 10,1 Hz, 2H); ESI MS (m/z): 342,05 [M+1].
460	etil(2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)(imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,52 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 9,27 (s, 1H), 8,74 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,55 (dt, J = 9,9, 2,3 Hz, 1H), 8,41 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 7,90 (d, J = 9,0 Hz, 1H), 7,74 (dd, J = 9,0, 1,7 Hz, 1H), 4,22 (s, 1H), 3,17 (q, J = 7,3 Hz, 2H), 1,08 (t, J = 7,3 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 304,85 [M+1].
465	(ciclobutilmetil)(imino)(2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,52 (s, 2H), 9,46 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 9,28 (s, 1H), 8,44 (s, 1H), 7,89 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 7,77 (dd, J = 9,2, 1,8 Hz, 1H), 3,89 (s, 1H), 3,32 (d, J = 7,3 Hz, 2H), 2,66-2,58 (m, 1H), 1,93-1,86 (m, 2H), 1,82-1,62 (m, 4H) ESI MS (m/z): 328,1 [M+1].

468	(ciclobutilmetil)(2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)(imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,51 (d, J = 0,5 Hz, 1H), 9,27 (s, 1H), 8,74 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,54 (dt, J = 9,9, 2,3 Hz, 1H), 8,39 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 7,89 (d, J = 9,0 Hz, 1H), 7,74 (dd, J = 9,2, 1,6 Hz, 1H), 4,15 (s, 1H), 3,32 (s, 1H), 2,59-2,51 (m, 1H), 1,87-1,78 (m, 2H), 1,76-1,68 (m, 1H), 1,66-1,57 (m, 3H) ESI MS (m/z): 344,9 [M+1].
470	imino(metil)(2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,56 (s, 2H), 9,55-9,54 (m, 1H), 9,31 (s, 1H), 8,47 (q, J = 0,8 Hz, 1H), 7,93 (dt, J = 9,2, 0,9 Hz, 1H), 7,82 (dd, J = 9,2, 1,8 Hz, 1H), 4,25 (s, 1H), 3,11 (s, 3H); ESI MS (m/z): 274 [M+1].
478	(2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)(imino)(propil)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,52 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 9,27 (s, 1H), 8,74 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 8,55 (dt, J = 9,9, 2,3 Hz, 1H), 8,41 (q, J = 0,8 Hz, 1H), 7,90 (d, J = 9,3 Hz, 1H), 7,75 (dd, J = 9,3, 1,7 Hz, 1H), 4,22 (s, 1H), 3,17-3,13 (m, 2H), 1,59-1,50 (m, 2H), 0,87 (t, J = 7,5 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 319 [M+1].
479	sec-butil(2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)(imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,51-9,49 (m, 1H), 9,27 (s, 1H), 8,74 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,54 (dt, J = 9,8, 2,3 Hz, 1H), 8,39 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 7,90 (d, J = 9,0 Hz, 1H), 7,73-7,69 (m, 1H), 4,18 (d, J = 8,8 Hz, 1H), 3,05 (qd, J = 6,9, 3,2 Hz, 1H), 1,94-1,86

		(m, 1H), 1,33-1,24 (m, 1H), 1,14 (dd, J = 9,3, 6,8 Hz, 3H), 0,87 (dd, J = 16,4, 7,6 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 333 [M+1].
480	(2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)(imino)(pentano-3-il)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,51 (s, 1H), 9,27 (s, 1H), 8,74 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,54 (d, J = 9,8 Hz, 1H), 8,40 (s, 1H), 7,90 (d, J = 9,0 Hz, 1H), 7,73 (d, J = 9,0 Hz, 1H), 4,18 (s, 1H), 2,92-2,89 (m, 1H), 1,85-1,75 (m, 2H), 1,63-1,52 (m, 2H), 0,92-0,86 (m, 6H); ESI MS (m/z): 347,05 [M+1].
482	(3-fluoropropil)(2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il) (imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,53 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 9,27 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 8,74 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 8,55 (dt, J = 9,9, 2,4 Hz, 1H), 8,44 (q, J = 0,8 Hz, 1H), 7,93-7,91 (m, 1H), 7,76 (dd, J = 9,2, 1,8 Hz, 1H), 4,52 (t, J = 5,9 Hz, 1H), 4,41-4,38 (m, 2H), 3,27 (dd, J = 9,4, 6,2 Hz, 2H), 1,99-1,87 (m, 2H); ESI MS (m/z): 336,85 [M+1].
484	(2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)(imino)((3-metilxetano-3-il)metil)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,52 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 9,28 (s, 1H), 8,74 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,55 (dt, J = 9,8, 2,3 Hz, 1H), 8,42 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 7,92 (d, J = 9,3 Hz, 1H), 7,78 (dd, J = 9,2, 1,8 Hz, 1H), 4,62 (d, J = 5,9 Hz, 1H), 4,46 (d, J = 5,9 Hz, 1H), 4,30 (s, 1H), 4,12 (d, J = 6,1 Hz, 1H), 4,07 (d, J = 5,9 Hz, 1H), 3,73 (d, J = 14,2 Hz, 1H), 3,60 (d, J = 14,4 Hz, 1H), 1,47 (s, 3H); ESI MS (m/z): 361 [M+1].

488	ciclobutil(2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)(imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,51 (td, J = 7,3, 0,7 Hz, 1H), 9,27 (s, 1H), 8,74 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,57-8,53 (m, 1H), 8,39 (q, J = 0,8 Hz, 1H), 7,89 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 7,70 (ddd, J = 9,1, 5,1, 1,8 Hz, 1H), 4,19 (d, J = 8,3 Hz, 1H), 4,01-3,93 (m, 1H), 2,39-2,29 (m, 2H), 2,12-1,93 (m, 2H), 1,90-1,73 (m, 2H) ESI MS (m/z): 331 [M+1].
554	ciclobutil(imino)(2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,48 (d, J = 7,3 Hz, 1H), 9,33 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,70 (dd, J = 4,8, 1,3 Hz, 1H), 8,50 (dq, J = 8,3, 1,4 Hz, 1H), 8,39 (s, 1H), 7,89 (d, J = 9,0 Hz, 1H), 7,70-7,66 (m, 2H), 4,18 (s, 1H), 4,00-3,92 (m, 1H), 2,39-2,29 (m, 2H), 2,11-1,94 (m, 2H), 1,88-1,76 (m, 2H); ESI MS (m/z): 312,9 [M+1]
555	(ciclohexilmetil)(imino)(2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,47 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 9,34 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,70 (dd, J = 4,8, 1,3 Hz, 1H), 8,51 (dq, J = 8,3, 1,4 Hz, 1H), 8,42 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 7,90 (d, J = 9,0 Hz, 1H), 7,75 (dd, J = 9,3, 1,7 Hz, 1H), 7,68 (dd, J = 8,3, 4,9 Hz, 1H), 4,20 (s, 1H), 3,13-3,04 (m, 2H), 1,88-1,68 (m, 3H), 1,57-1,49 (m, 3H), 1,19-0,92 (m, 5H); ESI MS (m/z): 355,05 [M+1]
556	imino(pentano-3-il)(2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,47 (d, J = 0,6 Hz, 1H), 9,34 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,70 (dd, J = 4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,50 (dq, J

		= 8,4, 1,3 Hz, 1H), 8,40 (d, J = 0,6 Hz, 1H), 7,90 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 7,72 (dd, J = 9,0, 1,7 Hz, 1H), 7,68 (q, J = 4,4 Hz, 1H), 4,16 (s, 1H), 2,91-2,88 (m, 1H), 1,85-1,75 (m, 2H), 1,63-1,52 (m, 2H), 0,92-0,86 (m, 6H); ESI MS (m/z): 329 [M+1]
557	imino(isobutil)(2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,47 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 9,34 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,70 (dd, J = 4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,51 (dq, J = 8,4, 1,3 Hz, 1H), 8,43 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 7,90 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 7,75 (dd, J = 9,2, 1,8 Hz, 1H), 7,69-7,66 (m, 1H), 4,20 (s, 1H), 3,14-3,05 (m, 2H), 2,08-2,01 (m, 1H), 0,91 (dd, J = 6,7, 1,5 Hz, 6H); ESI MS (m/z): 314,95 [M+1]
558	ciclopentil(imino)(2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,46 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 9,34 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,70 (dd, J = 4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,50 (dq, J = 8,3, 1,4 Hz, 1H), 8,42 (t, J = 0,8 Hz, 1H), 7,90 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 7,74 (dd, J = 9,2, 1,5 Hz, 1H), 7,69-7,66 (m, 1H), 4,10 (s, 1H), 3,67-3,63 (m, 1H), 1,93-1,70 (m, 4H), 1,60-1,48 (m, 4H) ESI MS (m/z): 326,9 [M+1]
559	cicloheptil(imino)(2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,46 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 9,33 (d, J = 2,2 Hz, 1H), 8,70 (dd, J = 4,8, 1,3 Hz, 1H), 8,50 (dq, J = 8,3, 1,4 Hz, 1H), 8,39 (q, J = 0,8 Hz, 1H), 7,89 (d, J = 9,0 Hz, 1H), 7,73-7,66 (m, 2H),

		4,11 (s, 1H), 3,19-3,12 (m, 1H), 2,10-2,01 (m, 2H), 1,68-1,33 (m, 10H); ESI MS (m/z): 355 [M+1]
560	ciclohexil(imino)(2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,47 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 9,33 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,70 (dd, J = 4,8, 1,3 Hz, 1H), 8,50 (dq, J = 8,4, 1,3 Hz, 1H), 8,36 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 7,89 (d, J = 9,3 Hz, 1H), 7,70-7,66 (m, 2H), 4,16 (s, 1H), 3,01-2,96 (m, 1H), 1,99-1,91 (m, 2H), 1,72 (d, J = 9,5 Hz, 2H), 1,55 (d, J = 12,2 Hz, 1H), 1,31-1,16 (m, 4H), 1,06-0,99 (m, 1H); ESI MS (m/z): 340,95 [M+1]
561	(2-ciclohexiletil) (imino) (2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,47 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 9,34 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,70 (dd, J = 4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,51 (dq, J = 8,3, 1,4 Hz, 1H), 8,41 (q, J = 0,8 Hz, 1H), 7,90 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 7,74 (dd, J = 9,2, 1,8 Hz, 1H), 7,69-7,66 (m, 1H), 4,19 (s, 1H), 3,16 (t, J = 8,3 Hz, 2H), 1,59-1,52 (m, 5H), 1,44-1,38 (m, 2H), 1,22 (s, 1H), 1,14-1,02 (m, 3H), 0,81-0,72 (m, 2H); ESI MS (m/z): 369,05 [M+1]
562	imino (pentano-2-il) (2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,48 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 9,34 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,70 (dd, J = 4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,51 (dq, J = 8,4, 1,3 Hz, 1H), 8,39 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 7,90 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 7,72-7,66 (m, 2H), 4,17 (d, J = 7,0 Hz, 1H), 3,13-3,08 (m, 1H), 1,84-1,78 (m, 1H), 1,41-1,12 (m, 6H), 0,81

		(q, J = 7,2 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 328,95 [M+1]
563	imino(isopentil)(2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,48 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 9,34 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,70 (dd, J = 4,6, 1,2 Hz, 1H), 8,51 (dq, J = 8,3, 1,4 Hz, 1H), 8,41 (t, J = 0,7 Hz, 1H), 7,91 (d, J = 9,3 Hz, 1H), 7,74 (dd, J = 9,0, 1,7 Hz, 1H), 7,68 (ddd, J = 8,3, 4,8, 0,6 Hz, 1H), 4,21 (s, 1H), 3,16 (t, J = 8,2 Hz, 2H), 1,58-1,52 (m, 1H), 1,44-1,38 (m, 2H), 0,79 (d, J = 6,6 Hz, 6H); ESI MS (m/z): 328,95 [M+1]
564	4-(2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazole-5-sulfonimidoil)butanonitril	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,49 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 9,34 (d, J = 2,2 Hz, 1H), 8,70 (dd, J = 4,8, 1,3 Hz, 1H), 8,51 (dq, J = 8,3, 1,4 Hz, 1H), 8,44 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 7,93 (d, J = 9,3 Hz, 1H), 7,74 (dd, J = 9,2, 1,8 Hz, 1H), 7,68 (dd, J = 8,3, 4,6 Hz, 1H), 4,46 (s, 1H), 3,26 (dd, J = 8,7, 5,3 Hz, 2H), 2,61 (t, J = 7,3 Hz, 2H), 1,88-1,80 (m, 2H); ESI MS (m/z): 326,05 [M+1]
569	imino(2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)((tetrahidrofurano-2-il)metil)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,48 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 9,34 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,70 (d, J = 3,7 Hz, 1H), 8,51 (d, J = 8,3 Hz, 1H), 8,43 (d, J = 9,5 Hz, 1H), 7,88 (dd, J = 9,2, 2,8 Hz, 1H), 7,78-7,75 (m, 1H), 7,68 (dd, J = 8,3, 4,6 Hz, 1H), 4,27 (s, 1H), 4,12 (dt, J = 17,0, 6,4 Hz, 1H), 3,62-3,37 (m, 4H), 1,94-1,87 (m, 1H), 1,79-1,68 (m,

		2H), 1,56-1,46 (m, 1H); ESI MS (m/z): 342,9 [M+1].
580	imino(2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)(3,3,3-trifluoropropil)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,51 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 9,35 (d, J = 2,2 Hz, 1H), 8,70 (dd, J = 4,6, 1,5 Hz, 1H), 8,53-8,48 (m, 2H), 7,93 (d, J = 9,0 Hz, 1H), 7,79 (dd, J = 9,2, 1,8 Hz, 1H), 7,68 (ddd, J = 8,3, 4,6, 0,7 Hz, 1H), 4,65 (s, 1H), 3,47-3,43 (m, 2H), 2,62-2,55 (m, 2H); ESI MS (m/z): 354,9 [M+1].
602	imino(neopentil)(2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, MeOD) δ 9,31 (d, J = 2,0 Hz, 1H), 9,22 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 8,68 (dd, J = 4,9, 1,5 Hz, 1H), 8,57 (q, J = 0,8 Hz, 1H), 8,52 (dq, J = 8,5, 1,3 Hz, 1H), 7,91 (dt, J = 9,3, 0,9 Hz, 1H), 7,84 (dd, J = 9,3, 2,0 Hz, 1H), 7,69 (ddd, J = 8,4, 4,8, 0,7 Hz, 1H), 3,43-3,36 (m, 2H), 1,15-1,03 (m, 9H); ESI MS (m/z): 329 [M+1].
609	imino(propil)(2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, MeOD) δ 9,31 (s, 1H), 9,23-9,22 (m, 1H), 8,67 (d, J = 4,4 Hz, 1H), 8,55-8,51 (m, 2H), 7,91 (d, J = 9,3 Hz, 1H), 7,82 (dd, J = 9,2, 1,8 Hz, 1H), 7,69 (dd, J = 8,3, 4,9 Hz, 1H), 3,30 (t, J = 1,6 Hz, 2H), 1,75-1,66 (m, 2H), 0,99-0,95 (m, 3H) ESI MS (m/z): 301,1 [M+1].
619	imino(isopropil)(2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -pirazolo[4,3- <i>b</i>]piridin-5-il)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,78 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 9,39 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,74 (dd, J = 4,9, 1,5 Hz, 1H), 8,56 (dq, J = 8,3, 1,4 Hz, 1H), 8,50 (dd, J = 9,2, 0,9

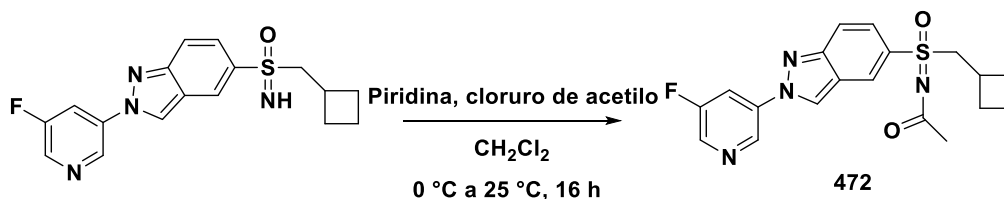
	indazol-5-il)((2,4,5-trifluorofenil)imino)-λ ⁶ -sulfanona	Hz, 1H), 7,97 (d, J = 9,5 Hz, 1H), 7,72 (dd, J = 9,3, 1,7 Hz, 1H), 7,41 (td, J = 10,7, 7,9 Hz, 1H), 6,99-6,92 (m, 1H), 3,66 (dq, J = 23,8, 7,3 Hz, 2H), 1,00-0,94 (m, 1H), 0,50-0,38 (m, 2H), 0,23-0,02 (m, 2H); ESI MS (m/z): 444,05 [M+1].
451	(ciclopropimetil)((5-fluoropiridin-2-il)imino)(2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,55-9,53 (m, 3H), 9,31 (s, 1H), 8,54 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 7,94-7,91 (m, 2H), 7,73 (dd, J = 9,2, 1,8 Hz, 1H), 7,49 (td, J = 8,7, 3,1 Hz, 1H), 6,85 (dd, J = 9,0, 3,8 Hz, 1H), 3,64 (d, J = 7,0 Hz, 2H), 0,91 (dd, J = 11,9, 7,0 Hz, 1H), 0,44-0,34 (m, 2H), 0,10 (q, J = 4,7 Hz, 1H), -0,03 (q, J = 4,8 Hz, 1H); ESI MS (m/z): 409,05 [M+1].
452	(ciclopropilmetil)(piridin-2-ilimino)(2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,54 (d, J = 5,8 Hz, 3H), 9,31 (s, 1H), 8,55 (d, J = 0,6 Hz, 1H), 7,93-7,91 (m, 2H), 7,74 (dd, J = 9,2, 1,8 Hz, 1H), 7,56-7,51 (m, 1H), 6,82 (d, J = 7,9 Hz, 1H), 6,73 (ddd, J = 7,2, 5,0, 0,9 Hz, 1H), 3,67 (dd, J = 7,2, 1,7 Hz, 2H), 0,91-0,88 (m, 1H), 0,44-0,32 (m, 2H), 0,11-0,06 (m, 1H), 0,05-0,0 (m, 1H); ESI MS (m/z): 391,1 [M+1].
453	(ciclopropilmetil)((2-metoxipirimidin-5-il)imino)(2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,53 (d, J = 1,7 Hz, 3H), 9,32 (d, J = 7,3 Hz, 1H), 8,57 (s, 1H), 8,15 (d, J = 5,1 Hz, 2H), 7,95 (d, J = 9,3 Hz, 1H), 7,74 (dd, J = 9,3, 1,7 Hz, 1H), 3,76-3,71 (m, 3H), 3,69-3,61 (m, 2H), 1,00

		(t, J = 7,6 Hz, 1H), 0,53-0,46 (m, 1H), 0,43-0,36 (m, 1H), 0,23 (td, J = 9,5, 4,8 Hz, 1H), 0,04 (td, J = 9,7, 4,7 Hz, 1H); ESI MS (m/z): 422,1 [M+1].
459	etil(2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)((6-(trifluorometil)pirazina-2-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,56 (s, 3H), 9,31 (s, 1H), 8,63 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 8,46 (s, 1H), 8,39 (s, 1H), 7,96 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 7,73 (dd, J = 9,3, 1,7 Hz, 1H), 3,88-3,80 (m, 2H), 1,25-1,16 (m, 3H); ESI MS (m/z): 434,1 [M+1].
463	etil(2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)((6-(trifluorometil)pirazina-2-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,54 (d, J = 0,6 Hz, 1H), 9,27 (s, 1H), 8,75 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,60 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 8,56 (dt, J = 9,9, 2,3 Hz, 1H), 8,45 (s, 1H), 8,39 (s, 1H), 7,93 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 7,72 (dd, J = 9,3, 1,7 Hz, 1H), 3,88-3,78 (m, 2H), 1,20 (t, J = 7,2 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 451,1 [M+1].
464	etil(2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)((2-metilpiridin-4-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,52 (d, J = 0,6 Hz, 1H), 9,24 (s, 1H), 8,75 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,54-8,51 (m, 2H), 7,97 (t, J = 5,5 Hz, 1H), 7,93 (s, 1H), 7,68-7,65 (m, 1H), 6,70 (d, J = 2,1 Hz, 1H), 6,60 (dd, J = 5,5, 2,1 Hz, 1H), 3,67-3,57 (m, 2H), 2,21 (d, J = 14,4 Hz, 3H), 1,22-1,16 (m, 3H); ESI MS (m/z): 396,05 [M+1].
469	(ciclobutilmetil)(2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)((6-	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,55 (s, 3H), 9,31 (s, 1H), 8,62 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 8,44 (s, 1H), 8,39 (s, 1H), 7,95 (d,

	(trifluorometil)pirazin-2-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	J = 9,2 Hz, 1H), 7,74 (dd, J = 9,5, 1,8 Hz, 1H), 4,03-3,93 (m, 2H), 2,71-2,65 (m, 1H), 1,99-1,93 (m, 1H), 1,85-1,57 (m, 5H) ESI MS (m/z): 474 [M+1].
473	(ciclobutilmetil)(2-(5-fluoropiridin-3-il)-2H-indazol-5-il)((6-(trifluorometil)pirazin-2-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, CLOROFORMO-D) δ 9,05 (d, J = 1,8 Hz, 1H), 8,72 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 8,61 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,59 (q, J = 0,8 Hz, 1H), 8,38 (s, 1H), 8,28 (s, 1H), 8,14 (dt, J = 8,9, 2,4 Hz, 1H), 7,90-7,87 (m, 1H), 7,69 (dd, J = 9,3, 1,7 Hz, 1H), 3,82 (q, J = 7,0 Hz, 1H), 3,71 (q, J = 7,2 Hz, 1H), 2,84 (t, J = 7,2 Hz, 1H), 2,14 (q, J = 4,2 Hz, 1H), 1,95-1,77 (m, 5H), 1,64 (t, J = 8,3 Hz, 1H); ESI MS (m/z): 491,25 [M+1].
476	(ciclobutilmetil)(2-(5-fluoropiridin-3-il)-2H-indazol-5-il)((6-(trifluorometil)piridin-3-il)imino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 9,51 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 9,24 (s, 1H), 8,75 (d, J = 2,2 Hz, 1H), 8,56 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 8,52 (dt, J = 9,7, 2,3 Hz, 1H), 8,27 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 7,95 (d, J = 9,3 Hz, 1H), 7,71 (dd, J = 9,2, 1,8 Hz, 1H), 7,55 (d, J = 8,6 Hz, 1H), 7,34 (dd, J = 8,3, 2,2 Hz, 1H), 3,86 (d, J = 7,1 Hz, 2H), 2,71 (d, J = 7,6 Hz, 1H), 2,06-2,00 (m, 1H), 1,86-1,79 (m, 3H), 1,69 (dd, J = 16,4, 7,6 Hz, 2H); ESI MS (m/z): 490,2 [M+1].
477	(ciclobutilmetil)(2-(5-fluoropiridin-3-il)-2H-indazol-5-il)((6-	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 9,53 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 9,27 (s, 1H), 8,74 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 8,57-8,53 (m, 2H), 7,91 (d, J = 9,0 Hz, 1H), 7,78-7,70 (m, 2H), 7,17 (d,

	(trifluorometil)piridin-2-il)imino)- λ^6 -sulfanona	J = 7,3 Hz, 1H), 7,03 (d, J = 8,3 Hz, 1H), 3,92 (d, J = 7,1 Hz, 2H), 2,66-2,59 (m, 1H), 1,98-1,93 (m, 1H), 1,80-1,70 (m, 3H), 1,66-1,55 (m, 2H) ESI MS (m/z): 490,05 [M+1].
481	(ciclobutilmetil)((2-metilpiridin-4-il)imino)(2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)- λ^6 -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,52 (s, 3H), 9,31 (s, 1H), 8,53 (s, 1H), 7,98-7,94 (m, 2H), 7,69-7,66 (m, 1H), 6,68 (d, J = 1,5 Hz, 1H), 6,58 (d, J = 5,5 Hz, 1H), 3,77 (d, J = 7,0 Hz, 2H), 2,73-2,65 (m, 1H), 2,23 (s, 3H), 1,98-1,95 (m, 1H), 1,85-1,80 (m, 3H), 1,72-1,62 (m, 2H); ESI MS (m/z): 419,1 [M+1].

Ejemplo 10: Síntesis de *N*-((ciclobutilmetil)(2-(5-fluoropiridin-3-il)-2*H*-indazol-5-il)(oxo)- λ^6 -sulfaneiliden) acetamida **472**



A una solución agitada de (ciclobutilmetil)(2-(5-fluoropiridin-3-il)-2*H*-indazol-5-il)(imino)- λ^6 -sulfanona (250 mg, 0,726 mmol) en diclorometano (6 mL), se agregó piridina (0,088 mL, 1,089 mmol) y la mezcla resultante se agitó durante 10 minutos. La mezcla de reacción se enfrió hasta 0 °C y se agregó cloruro de acetilo (0,057 mL, 0,798 mmol) en la mezcla de reacción que se agitó a 25 °C durante 16 h. Tras completarse la reacción, La mezcla de reacción se vertió en agua (10 mL) y la capa acuosa se extrajo con diclorometano (3 $\times$ 20 mL). La capa orgánica se secó en sulfato de sodio anhidro, se filtró y se concentró a presión reducida para obtener un sólido crudo. El compuesto crudo se purificó mediante HPLC preparativa para obtener la *N*-((ciclobutilmetil)(2-(5-fluoropiridin-

3-il)-2H-indazol-5-il)(oxo)- λ^6 -sulfaneiliden) acetamida **472** deseada (110 mg, 0,285 mmol, 39,2% de rendimiento).

Tabla 10: Se prepararon compuestos representativos de la presente divulgación según el material inicial y los métodos adecuados descritos en el Ejemplo 10.

N.º de comp.	Nombres del compuesto	Datos analíticos
389	<i>N</i> -(isopropil(oxo)(2-(piridin-3-il)-2H-indazol-5-il)- λ^6 -sulfaneiliden)acetamida	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- D_6) δ 9,49 (d, $J = 0,9$ Hz, 1H), 9,33 (d, $J = 2,1$ Hz, 1H), 8,71 (dd, $J = 4,7, 1,4$ Hz, 1H), 8,51 (dq, $J = 8,4, 1,3$ Hz, 1H), 8,44 (t, $J = 0,9$ Hz, 1H), 7,97 (d, $J = 9,2$ Hz, 1H), 7,71-7,67 (m, 1H), 7,61 (dd, $J = 9,2, 1,8$ Hz, 1H), 3,77-3,70 (m, 1H), 2,01 (s, 3H), 1,30 (d, $J = 6,7$ Hz, 3H), 1,25-1,22 (m, 1H), 1,12 (d, $J = 6,7$ Hz, 3H); ESI MS (m/z): 343,15 [$M+1$].
394	2,2,2-trifluoro- <i>N</i> -(isopropil(oxo)(2-(piridin-3-il)-2H-indazol-5-il)- λ^6 -sulfaneiliden)acetamida	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9,56 (d, $J = 0,7$ Hz, 1H), 9,34 (d, $J = 2,4$ Hz, 1H), 8,73 (dd, $J = 4,8, 1,3$ Hz, 1H), 8,59 (d, $J = 1,0$ Hz, 1H), 8,52 (dq, $J = 8,3, 1,4$ Hz, 1H),

		8,07 (d, J = 9,3 Hz, 1H), 7,72-7,63 (m, 2H), 4,13-4,06 (m, 1H), 1,41 (d, J = 6,6 Hz, 3H), 1,22-1,18 (m, 3H); ESI MS (m/z): 396,5 [M+1].
396	2,2-difluoro- <i>N</i> -(isopropil(oxo)(2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)- λ^6 -sulfaneiliden)acetamida	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9,54 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 9,34 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,72 (dd, J = 4,6, 1,2 Hz, 1H), 8,54-8,50 (m, 2H), 8,04 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 7,71-7,68 (m, 1H), 7,64 (dd, J = 9,2, 1,8 Hz, 1H), 6,22 (t, J = 54,3 Hz, 1H), 3,99-3,93 (m, 1H), 1,37 (d, J = 6,7 Hz, 3H), 1,17 (d, J = 6,7 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 378,45 [M+1].
398	2,2,2-trifluoro- <i>N</i> -((2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)(isopropil)(oxo)- λ^6 -sulfaneiliden)acetamida	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9,60 (s, 1H), 9,27 (s, 1H), 8,78 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 8,61 (d, J = 1,7 Hz, 1H), 8,57 (dd, J = 9,8, 2,2 Hz, 1H), 8,07 (d, J = 9,3 Hz, 1H), 7,66 (dd, J = 9,3, 2,0 Hz, 1H), 4,10 (t, J = 6,8 Hz, 1H),

		1,41 (d, J = 6,6 Hz, 3H), 1,22 (s, 1H), 1,18 (d, J = 6,6 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 414,95 [M+1].
399	<i>N</i> -((2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)(isopropil)(oxo)- λ^6 -sulfaneiliden)acetamida	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- D_6) δ 9,53 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 9,27 (s, 1H), 8,76 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,56 (dt, J = 9,8, 2,3 Hz, 1H), 8,45 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 7,97 (d, J = 9,0 Hz, 1H), 7,62 (dd, J = 9,2, 1,8 Hz, 1H), 3,77-3,70 (m, 1H), 2,01 (s, 3H), 1,31 (d, J = 6,8 Hz, 3H), 1,12 (d, J = 6,6 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 361,1 [M+1].
401	2,2,2-trifluoro- <i>N</i> -((2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -pirazolo[3,4- <i>b</i>]piridin-5-il)(isopropil)(oxo)- λ^6 -sulfaneiliden)acetamida	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9,63 (s, 1H), 9,31 (s, 1H), 9,16 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 9,01 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,82 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,64 (dt, J = 9,8, 2,3 Hz, 1H), 4,22 (m, J = 6,7 Hz, 1H), 1,44 (d, J = 6,7 Hz, 3H), 1,24 (d, J = 6,7 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 415,45 [M+1].

402	<i>N</i> -((2-(5-fluoropiridin-3-il)-2H-pirazolo[3,4- <i>b</i>]piridin-5-il)(isopropil)(oxo)- λ^6 -sulfaneiliden)acetamida	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- D_6) δ 9,55 (s, 1H), 9,30 (s, 1H), 8,97 (d, $J = 2,4$ Hz, 1H), 8,93 (d, $J = 2,4$ Hz, 1H), 8,80 (d, $J = 2,4$ Hz, 1H), 8,62 (dt, $J = 9,7, 2,3$ Hz, 1H), 3,84 (q, $J = 6,7$ Hz, 1H), 2,04 (s, 3H), 1,34 (d, $J = 6,8$ Hz, 3H), 1,18 (d, $J = 6,6$ Hz, 3H); ESI MS (m/z): 361,95 [M+1].
403	2,2-difluoro- <i>N</i> -((2-(5-fluoropiridin-3-il)-2H-indazol-5-il)(isopropil)(oxo)- λ^6 -sulfaneiliden)acetamida	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9,58 (s, 1H), 9,27 (s, 1H), 8,77 (d, $J = 2,4$ Hz, 1H), 8,59-8,56 (m, 2H), 8,03 (d, $J = 9,3$ Hz, 1H), 7,65 (dd, $J = 9,2, 1,8$ Hz, 1H), 6,22 (t, $J = 54,3$ Hz, 1H), 4,00-3,93 (m, 1H), 1,37 (d, $J = 6,8$ Hz, 3H), 1,17 (d, $J = 6,6$ Hz, 3H); ESI MS (m/z): 396,9 [M+1].
404	2,2-difluoro- <i>N</i> -((2-(5-fluoropiridin-3-il)-2H-pirazolo[3,4- <i>b</i>]piridin-5-il)(isopropil)(oxo)- λ^6 -sulfaneiliden)acetamida	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9,61 (s, 1H), 9,31 (s, 1H), 9,09 (d, $J = 2,4$ Hz, 1H), 8,99 (d, $J = 2,4$ Hz, 1H), 8,81 (d,

		J = 2,4 Hz, 1H), 8,63 (dt, J = 9,8, 2,3 Hz, 1H), 6,25 (t, J = 54,2 Hz, 1H), 4,08 (q, J = 6,8 Hz, 1H), 1,40 (d, J = 6,8 Hz, 3H), 1,23 (d, J = 6,6 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 397,95 [M+1].
413	<i>N</i> -((ciclopropilmetil)(2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)(oxo)- λ^6 -sulfaneiliden)-2,2,2-trifluoroacetamida	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,62 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 9,28 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 8,78-8,77 (m, 1H), 8,66 (q, J = 0,8 Hz, 1H), 8,57 (dt, J = 9,8, 2,3 Hz, 1H), 8,08-8,05 (m, 1H), 7,75 (dd, J = 9,3, 2,0 Hz, 1H), 3,99 (ddd, J = 26,4, 14,7, 7,1 Hz, 2H), 0,92-0,84 (m, 1H), 0,56-0,40 (m, 2H), 0,28 (td, J = 9,8, 4,6 Hz, 1H), 0,12 (td, J = 9,7, 4,5 Hz, 1H); ESI MS (m/z): 426,9 [M+1].
415	<i>N</i> -((ciclopropilmetil)(2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)(oxo)- λ^6 -sulfaneiliden)acetamida	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-D ₆) δ 9,55 (s, 1H), 9,28 (s, 1H), 8,76 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,58-8,53 (m, 2H), 7,97 (d, J = 9,3 Hz, 1H), 7,72 (dd,

		J = 9,3, 1,7 Hz, 1H), 3,64 (d, J = 7,1 Hz, 2H), 2,01 (s, 3H), 0,85-0,81 (m, 1H), 0,45-0,36 (m, 2H), 0,15-0,02 (m, 2H); ESI MS (m/z): 372,95 [M+1].
416	<i>N</i> -((ciclopropilmetil)(2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)(oxo)-λ ⁶ -sulfaneiliden)-2,2-difluoroacetamida	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,60 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 9,28 (s, 1H), 8,77 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 8,62 (t, J = 1,0 Hz, 1H), 8,57 (dt, J = 9,8, 2,3 Hz, 1H), 8,03 (d, J = 9,3 Hz, 1H), 7,74 (dd, J = 9,3, 2,0 Hz, 1H), 6,21 (t, J = 54,2 Hz, 1H), 3,91-3,81 (m, 2H), 0,91-0,84 (m, 1H), 0,52-0,38 (m, 2H), 0,22 (td, J = 9,5, 4,8 Hz, 1H), 0,09 (td, J = 9,6, 4,6 Hz, 1H); ESI MS (m/z): 408,95 [M+1].
417	2,2,2-trifluoro- <i>N</i> -(isopropil(oxo)(2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-λ ⁶ -sulfaneiliden)acetamida	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,62 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 9,56 (s, 2H), 9,34 (s, 1H), 8,64 (t, J = 1,0 Hz, 1H), 8,09 (d, J = 9,3 Hz, 1H), 7,67 (dd, J = 9,3, 2,0 Hz, 1H), 4,14-

		4,07 (m, 1H), 1,41 (d, J = 6,6 Hz, 3H), 1,18 (d, J = 6,6 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 398,0 [M+1].
418	<i>N</i> -(isopropil(oxo)(2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-λ ⁶ -sulfaneiliden)acetamida	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-D ₆) δ 9,56-9,55 (m, 3H), 9,33 (s, 1H), 8,48 (t, J = 0,9 Hz, 1H), 7,99 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 7,63 (dd, J = 9,3, 1,7 Hz, 1H), 3,77-3,71 (m, 1H), 2,00 (d, J = 4,9 Hz, 3H), 1,30 (d, J = 6,7 Hz, 3H), 1,12 (d, J = 6,7 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 343,5 [M+1].
421	2,2-difluoro- <i>N</i> -(isopropil(oxo)(2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-λ ⁶ -sulfaneiliden)acetamida	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,60 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 9,56 (s, 2H), 9,33 (s, 1H), 8,59 (q, J = 0,8 Hz, 1H), 8,05 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 7,66 (dd, J = 9,5, 1,8 Hz, 1H), 6,22 (t, J = 54,3 Hz, 1H), 4,00-3,93 (m, 1H), 1,37 (d, J = 6,4 Hz, 3H), 1,17 (d, J = 6,7 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 379,9 [M+1].
422	2,2,3,3,3-pentafluoro- <i>N</i> -(isopropil(oxo)(2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,63 (d,

	indazol-5-il)- λ^6 -sulfaneiliden)propanamida	J = 0,9 Hz, 1H), 9,56 (s, 2H), 9,34 (s, 1H), 8,62 (t, J = 0,9 Hz, 1H), 8,10 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 7,63 (dd, J = 9,2, 1,8 Hz, 1H), 4,11 (t, J = 6,7 Hz, 1H), 1,41 (d, J = 6,7 Hz, 3H), 1,19 (d, J = 6,7 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 447,9 [M+1].
456	<i>N</i> -(etil(oxo)(2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)- λ^6 -sulfaneiliden)acetamida	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-D ₆) δ 9,56 (s, 3H), 9,32 (s, 1H), 8,53 (t, J = 0,9 Hz, 1H), 8,00 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 7,70 (dd, J = 9,3, 1,7 Hz, 1H), 3,67-3,57 (m, 2H), 2,01 (s, 3H), 1,10 (t, J = 7,3 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 330 [M+1].
462	<i>N</i> -(etil(2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)(oxo)- λ^6 -sulfaneiliden)acetamida	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-D ₆) δ 9,54 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 9,27 (s, 1H), 8,76 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 8,56 (dt, J = 9,9, 2,3 Hz, 1H), 8,50 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 7,98 (d, J = 9,3 Hz, 1H), 7,69 (dd, J = 9,3, 1,7 Hz, 1H), 3,65-3,58 (m, 2H), 2,00 (s, 3H), 1,10 (t, J = 7,2 Hz, 3H);

		ESI MS (m/z): 346,9 [M+1].
467	<i>N</i> -((ciclobutilmetil)(oxo)(2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-λ ⁶ -sulfaneiliden)acetamida	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-D ₆) δ 9,56 (t, J = 1,2 Hz, 3H), 9,32 (s, 1H), 8,52 (q, J = 0,8 Hz, 1H), 7,99 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 7,70 (dd, J = 9,5, 1,8 Hz, 1H), 3,78 (d, J = 7,0 Hz, 2H), 2,58-2,54 (m, 1H), 1,99 (s, 3H), 1,93-1,89 (m, 1H), 1,79-1,57 (m, 5H); ESI MS (m/z): 369,95 [M+1].
472	<i>N</i> -((ciclobutilmetil)(2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)(oxo)-λ ⁶ -sulfaneiliden)acetamida	¹ H-NMR (400 MHz, CLOROFORMO-D) δ 9,05 (s, 1H), 8,72 (s, 1H), 8,61 (d, J = 1,8 Hz, 1H), 8,53 (t, J = 0,8 Hz, 1H), 8,14 (dt, J = 8,9, 2,3 Hz, 1H), 7,92 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 7,69 (dd, J = 9,2, 1,8 Hz, 1H), 3,73 (dd, J = 14,2, 6,6 Hz, 1H), 3,59 (q, J = 7,3 Hz, 1H), 2,71 (q, J = 7,6 Hz, 1H), 2,17 (s, 3H), 2,09-2,05 (m, 1H), 1,91-1,74 (m, 4H), 1,64-1,60 (m, 1H);

		ESI MS (m/z): 387,1 [M+1].
475	<i>N</i> -(metil(oxo)(2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-λ ⁶ -sulfaneiliden)acetamida	¹ H-NMR (400 MHz, CLOROFORMO-D) δ 9,38 (s, 2H), 9,33 (s, 1H), 8,74 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 8,60 (q, J = 0,8 Hz, 1H), 7,97 (dd, J = 8,6, 0,9 Hz, 1H), 7,75 (dd, J = 9,2, 1,8 Hz, 1H), 3,40 (s, 3H), 2,19 (s, 3H); ESI MS (m/z): 316,05 [M+1].
483	<i>N</i> -((2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)(oxo)(propil)-λ ⁶ -sulfaneiliden)acetamida	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-D6) δ 9,54 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 9,27 (s, 1H), 8,76 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,56 (dt, J = 9,8, 2,3 Hz, 1H), 8,50 (t, J = 0,9 Hz, 1H), 7,98 (d, J = 9,0 Hz, 1H), 7,69 (dd, J = 9,3, 1,7 Hz, 1H), 3,66-3,52 (m, 2H), 2,00 (s, 3H), 1,63-1,45 (m, 2H), 0,89 (t, J = 7,3 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 361 [M+1].
485	<i>N</i> -((2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)(oxo)(pentan-3-il)-λ ⁶ -sulfaneiliden)acetamida	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-D6) δ 9,52 (s, 1H), 9,27 (s, 1H), 8,76 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,56 (dd,

		J = 7,5, 2,3 Hz, 1H), 8,47 (s, 1H), 7,97 (d, J = 9,3 Hz, 1H), 7,64 (dd, J = 9,3, 1,7 Hz, 1H), 3,39 (d, J = 6,6 Hz, 1H), 2,01-1,96 (m, 4H), 1,76 (td, J = 14,7, 7,7 Hz, 2H), 1,49 (t, J = 7,2 Hz, 1H), 0,99 (t, J = 7,5 Hz, 3H), 0,85 (t, J = 7,5 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 389,05 [M+1].
486	<i>N</i> -(sec-butil(2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)(oxo)-λ ⁶ -sulfaneiliden)acetamida	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-D ₆) δ 9,45 (dd, J = 13,0, 5,0 Hz, 1H), 9,24 (d, J = 2,1 Hz, 1H), 8,72 (q, J = 2,4 Hz, 1H), 8,50-8,45 (m, 2H), 7,95 (q, J = 4,6 Hz, 1H), 7,65-7,62 (m, 1H), 3,58-3,54 (m, 1H), 2,18-1,80 (m, 4H), 1,48-1,15 (m, 4H), 0,94 (dtd, J = 32,3, 7,4, 4,1 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 375,05 [M+1].
487	<i>N</i> -((3-fluoropropil)(2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)(oxo)-λ ⁶ -sulfaneiliden)acetamida	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-D ₆) δ 9,55 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 9,28 (s, 1H), 8,76 (d, J = 2,4 Hz,

		1H), 8,58-8,54 (m, 2H), 7,99 (d, J = 9,3 Hz, 1H), 7,71 (dd, J = 9,3, 2,0 Hz, 1H), 4,54-4,39 (m, 2H), 3,80-3,63 (m, 2H), 2,06-1,86 (m, 5H) ESI MS (m/z): 379,1 [M+1].
565	<i>N</i> -(ciclobutil(oxo)(2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-λ ⁶ -sulfaneiliden)acetamida	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,48 (d, J = 0,6 Hz, 1H), 9,34 (q, J = 2,5 Hz, 1H), 8,71 (dd, J = 4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,53-8,49 (m, 1H), 8,45 (q, J = 0,8 Hz, 1H), 7,98-7,94 (m, 1H), 7,72-7,67 (m, 1H), 7,60 (dd, J = 9,3, 1,7 Hz, 1H), 4,37 (t, J = 7,9 Hz, 1H), 2,56-2,53 (m, 1H), 2,32-2,20 (m, 2H), 1,97 (d, J = 7,3 Hz, 3H), 1,93-1,81 (m, 3H); ESI MS (m/z): 354,9 [M+1].
566	<i>N</i> -((ciclohexilmetil)(oxo)(2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-λ ⁶ -sulfaneiliden)acetamida	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,50 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 9,34 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,71 (dd, J = 4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,53-

		8,50 (m, 2H), 7,97 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 7,72-7,67 (m, 2H), 3,54 (dd, J = 19,6, 5,8 Hz, 2H), 1,97 (s, 3H), 1,79 (s, 2H), 1,61-1,51 (m, 4H), 1,08 (dd, J = 15,7, 8,4 Hz, 5H); ESI MS (m/z): 396,95 [M+1].
570	<i>N</i> -(etil(2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)(oxo)-λ ⁶ -sulfaneiliden)propionamida	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,55 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 9,27 (s, 1H), 8,76 (d, J = 2,2 Hz, 1H), 8,56 (dt, J = 9,9, 2,3 Hz, 1H), 8,50 (q, J = 0,8 Hz, 1H), 7,99-7,96 (m, 1H), 7,68 (dd, J = 9,3, 2,0 Hz, 1H), 3,69-3,58 (m, 2H), 2,30 (q, J = 7,5 Hz, 2H), 1,10 (t, J = 7,3 Hz, 3H), 0,99 (t, J = 7,6 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 361 [M+1].
571	<i>N</i> -(etil(2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)(oxo)-λ ⁶ -sulfaneiliden)isobutiramida	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,56 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 9,27 (s, 1H), 8,76 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,56 (dt, J = 9,9, 2,4 Hz, 1H), 8,49 (q, J = 0,9 Hz,

		1H), 7,98 (d, J = 9,3 Hz, 1H), 7,67 (dd, J = 9,3, 1,7 Hz, 1H), 3,63 (q, J = 7,3 Hz, 2H), 2,46 (s, 1H), 1,09 (q, J = 7,0 Hz, 9H); ESI MS (m/z): 375,05 [M+1].
572	<i>N</i> -((ciclobutilmetil)(oxo)(2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-λ ⁶ -sulfaneilideno)ciclopropanocarboxamida	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,56 (d, J = 2,4 Hz, 3H), 9,32 (s, 1H), 8,50 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 7,99 (d, J = 9,5 Hz, 1H), 7,68 (dd, J = 9,2, 1,8 Hz, 1H), 3,79 (d, J = 7,3 Hz, 2H), 2,56 (d, J = 6,4 Hz, 1H), 1,93-1,90 (m, 1H), 1,79-1,73 (m, 3H), 1,69-1,59 (m, 3H), 0,80-0,73 (m, 4H); ESI MS (m/z): 396 [M+1].
573	<i>N</i> -((ciclobutilmetil)(oxo)(2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-λ ⁶ -sulfaneilideno)propionamida	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,56 (s, 3H), 9,32 (s, 1H), 8,52 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 7,99 (d, J = 9,5 Hz, 1H), 7,70 (dd, J = 9,2, 1,8 Hz, 1H), 3,78 (d, J = 7,3 Hz, 2H), 2,57-2,53 (m, 1H), 2,29 (q, J = 7,5 Hz, 2H), 1,94-1,89 (m, 1H), 1,79-1,58 (m, 5H),

		0,99 (t, J = 7,5 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 384 [M+1].
574	<i>N</i> -((ciclobutilmetil)(2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)(oxo)-λ ⁶ -sulfaneilideno)ciclopropanocarboxamida	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,55 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 9,27 (s, 1H), 8,76 (d, J = 2,2 Hz, 1H), 8,56 (dt, J = 9,7, 2,3 Hz, 1H), 8,47 (q, J = 0,9 Hz, 1H), 7,97 (d, J = 9,3 Hz, 1H), 7,67 (dd, J = 9,3, 1,7 Hz, 1H), 3,83-3,74 (m, 2H), 2,59-2,51 (m, 1H), 1,96-1,87 (m, 1H), 1,80-1,57 (m, 6H), 0,84-0,73 (m, 4H) ESI MS (m/z): 413,05 [M+1].
575	<i>N</i> -((ciclobutilmetil)(2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)(oxo)-λ ⁶ -sulfaneilideno)butiramida	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,54 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 9,27 (t, J = 1,1 Hz, 1H), 8,75 (d, J = 2,2 Hz, 1H), 8,56 (dt, J = 9,8, 2,3 Hz, 1H), 8,48 (q, J = 0,8 Hz, 1H), 7,97 (d, J = 9,3 Hz, 1H), 7,68 (dd, J = 9,3, 2,0 Hz, 1H), 3,82-3,73 (m, 2H), 2,58-2,51 (m, 1H), 2,27-2,20 (m, 2H), 1,95-1,87 (m, 1H),

		1,81-1,60 (m, 5H), 1,58-1,48 (m, 2H), 0,87 (t, J = 7,5 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 415,05 [M+1].
576	<i>N</i> -((ciclobutilmetil)(2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)(oxo)- λ^6 -sulfaneilideno)isobutiramida	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,55 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 9,27 (s, 1H), 8,76 (d, J = 2,2 Hz, 1H), 8,56 (dt, J = 9,7, 2,3 Hz, 1H), 8,48 (t, J = 0,9 Hz, 1H), 7,97 (d, J = 9,0 Hz, 1H), 7,67 (dd, J = 9,2, 1,8 Hz, 1H), 3,78 (d, J = 7,3 Hz, 2H), 2,54 (d, J = 8,1 Hz, 1H), 2,46 (d, J = 6,8 Hz, 1H), 1,95-1,90 (m, 1H), 1,78-1,60 (m, 5H), 1,06 (d, J = 7,3 Hz, 6H); ESI MS (m/z): 415,1 [M+1].
577	<i>N</i> -(etil(2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)(oxo)- λ^6 -sulfaneilideno)ciclopropanocarboxamida	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,55 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 9,27 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 8,76 (d, J = 2,2 Hz, 1H), 8,56 (dt, J = 9,8, 2,3 Hz, 1H), 8,48 (q, J = 0,8 Hz, 1H), 7,98 (dt, J = 9,2, 0,9 Hz, 1H), 7,67 (dd, J = 9,3, 2,0 Hz, 1H),

		3,68-3,56 (m, 2H), 1,68-1,62 (m, 1H), 1,10 (t, J = 7,3 Hz, 3H), 0,82-0,71 (m, 4H); ESI MS (m/z): 373 [M+1].
578	<i>N</i> -(etil(2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)(oxo)-λ ⁶ -sulfaneilideno)butiramida	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,55 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 9,27 (d, J = 1,2 Hz, 1H), 8,75 (d, J = 2,2 Hz, 1H), 8,55 (dt, J = 9,9, 2,4 Hz, 1H), 8,49 (q, J = 0,9 Hz, 1H), 7,99-7,96 (m, 1H), 7,67 (dd, J = 9,3, 1,7 Hz, 1H), 3,69-3,56 (m, 2H), 2,29-2,22 (m, 2H), 1,53 (td, J = 14,7, 7,3 Hz, 2H), 1,11-1,04 (m, 3H), 0,93-0,85 (m, 3H); ESI MS (m/z): 375 [M+1].
579	<i>N</i> -((ciclobutilmetil)(2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)(oxo)-λ ⁶ -sulfaneilideno)propionamida	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,54 (d, J = 0,5 Hz, 1H), 9,27 (s, 1H), 8,75 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,55 (dt, J = 9,8, 2,3 Hz, 1H), 8,49 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 7,96 (d, J = 9,3 Hz, 1H), 7,68 (dd, J = 9,2, 1,8 Hz, 1H), 3,82-3,73 (m, 2H), 2,57-2,52 (m, 1H),

		2,28 (q, J = 7,5 Hz, 2H), 1,95-1,87 (m, 1H), 1,79-1,58 (m, 5H), 0,99 (t, J = 7,5 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 401 [M+1].
581	<i>N</i> -(ciclopentil(oxo)(2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-λ ⁶ -sulfaneilideno)acetamida	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,48 (s, 1H), 9,33 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,71 (dd, J = 4,8, 1,3 Hz, 1H), 8,52-8,49 (m, 1H), 8,47 (s, 1H), 7,96 (d, J = 9,0 Hz, 1H), 7,69 (dd, J = 8,8, 4,9 Hz, 1H), 7,64 (dd, J = 9,3, 1,7 Hz, 1H), 4,04 (t, J = 7,9 Hz, 1H), 2,13-2,04 (m, 2H), 1,97 (s, 3H), 1,75 (dd, J = 13,0, 7,6 Hz, 1H), 1,66-1,50 (m, 5H); ESI MS (m/z): 369 [M+1].
582	<i>N</i> -(isopentil(oxo)(2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-λ ⁶ -sulfaneilideno)acetamida	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,50 (s, 1H), 9,34 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,71 (dd, J = 4,6, 1,2 Hz, 1H), 8,53-8,50 (m, 2H), 7,98 (d, J = 9,3 Hz, 1H), 7,72-7,67 (m, 2H), 3,68-3,55 (m, 2H), 2,00 (s, 3H), 1,57 (td, J = 13,3, 6,7 Hz, 1H), 1,52-1,43 (m, 1H),

		1,36-1,27 (m, 1H), 0,80 (dd, J = 6,5, 4,3 Hz, 6H); ESI MS (m/z): 371 [M+1].
583	<i>N</i> -((3-cianopropil)(oxo)(2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-λ ⁶ -sulfaneilideno)acetamida	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,51 (s, 1H), 9,34 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,72 (dd, J = 4,8, 1,3 Hz, 1H), 8,53-8,50 (m, 2H), 8,00 (d, J = 9,3 Hz, 1H), 7,71-7,68 (m, 2H), 3,77-3,60 (m, 2H), 2,61 (t, J = 7,3 Hz, 2H), 2,03 (s, 3H), 1,94-1,79 (m, 2H); ESI MS (m/z): 368 [M+1].
584	<i>N</i> -((3-cianopropil)(oxo)(2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-λ ⁶ -sulfaneilideno)ciclopropanocarboxamida	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,52 (s, 1H), 9,34 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,72-8,71 (m, 1H), 8,51 (d, J = 7,3 Hz, 2H), 8,00 (d, J = 9,3 Hz, 1H), 7,71-7,65 (m, 2H), 3,79-3,61 (m, 2H), 2,61 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 1,93-1,78 (m, 2H), 1,65 (dd, J = 13,0, 6,8 Hz, 1H), 0,83-0,77 (m, 4H); ESI MS (m/z): 394 [M+1].
590	<i>N</i> -(oxo(pentan-3-il)(2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-λ ⁶ -sulfaneilideno)acetamida	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,48 (d, J =

		0,7 Hz, 1H), 9,33 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 8,71 (dd, J = 4,8, 1,3 Hz, 1H), 8,51 (dq, J = 8,3, 1,4 Hz, 1H), 8,46 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 7,97 (d, J = 9,0 Hz, 1H), 7,69 (dd, J = 8,3, 4,9 Hz, 1H), 7,63 (dd, J = 9,3, 2,0 Hz, 1H), 3,38 (t, J = 7,1 Hz, 1H), 2,03-1,96 (m, 4H), 1,80-1,68 (m, 2H), 1,53-1,46 (m, 1H), 0,99 (t, J = 7,6 Hz, 3H), 0,85 (t, J = 7,6 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 370,95 [M+1].
591	<i>N</i> -(isobutil(oxo)(2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-λ ⁶ -sulfaneilideno)acetamida	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,49 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 9,34 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,71 (dd, J = 4,6, 1,5 Hz, 1H), 8,52-8,49 (m, 2H), 7,98 (d, J = 9,3 Hz, 1H), 7,72-7,67 (m, 2H), 3,59 (dd, J = 14,4, 6,4 Hz, 1H), 3,49 (dd, J = 14,4, 6,4 Hz, 1H), 2,02 (t, J = 6,6 Hz, 1H), 1,98 (s, 3H), 0,98 (d, J = 6,8 Hz, 3H), 0,88 (d, J = 6,8 Hz,

		3H); ESI MS (m/z): 356,9 [M+1].
592	<i>N</i> -(cicloheptil(oxo)(2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-λ ⁶ -sulfaneilideno)acetamida	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,48 (d, J = 0,6 Hz, 1H), 9,33 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,71 (dd, J = 4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,51 (dq, J = 8,3, 1,4 Hz, 1H), 8,45 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 7,96 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 7,69 (q, J = 4,2 Hz, 1H), 7,63 (dd, J = 9,2, 1,8 Hz, 1H), 3,69-3,64 (m, 1H), 2,30-2,27 (m, 1H), 2,00 (s, 3H), 1,95-1,90 (m, 1H), 1,68-1,60 (m, 3H), 1,53-1,34 (m, 7H); ESI MS (m/z): 397,05 [M+1].
593	<i>N</i> -((2-ciclopentiletil)(oxo)(2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-λ ⁶ -sulfaneilideno)acetamida	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,50 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 9,34 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,71 (dd, J = 4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,53-8,50 (m, 2H), 7,97 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 7,71-7,67 (m, 2H), 3,67-3,60 (m, 2H), 1,99 (s, 3H), 1,59-1,51 (m, 5H), 1,50-1,44 (m, 1H), 1,34-1,21 (m, 2H),

		1,11-1,01 (m, 3H), 0,78 (dd, J = 21,5, 9,9 Hz, 2H) ESI MS (m/z): 411,1 [M+1].
594	<i>N</i> -(oxo(pentan-2-il)(2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-λ ⁶ -sulfaneilideno)acetamida	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,48 (s, 1H), 9,33 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 8,71 (dd, J = 4,6, 1,5 Hz, 1H), 8,51 (d, J = 9,3 Hz, 1H), 8,44 (s, 1H), 7,97 (d, J = 8,6 Hz, 1H), 7,69 (dd, J = 8,2, 4,8 Hz, 1H), 7,61 (dd, J = 9,3, 1,2 Hz, 1H), 3,62-3,58 (m, 1H), 2,00 (d, J = 6,6 Hz, 4H), 1,35-1,11 (m, 6H), 0,83 (dt, J = 36,4, 7,2 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 370,85 [M+1].
596	<i>N</i> -(oxo(2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)((tetrahidrofuran-2-il)metil)-λ ⁶ -sulfaneilideno)acetamida	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,50 (d, J = 4,2 Hz, 1H), 9,34 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 8,71 (d, J = 4,6 Hz, 1H), 8,51 (d, J = 10,8 Hz, 2H), 7,95 (dd, J = 9,3, 4,2 Hz, 1H), 7,74-7,67 (m, 2H), 4,16-4,05 (m, 1H), 3,93-3,82 (m, 2H), 3,59-3,42 (m, 2H), 2,00 (d, J = 16,6 Hz, 3H),

		1,96-1,84 (m, 1H), 1,80-1,66 (m, 2H), 1,63-1,50 (m, 1H); ESI MS (m/z): 384,9 [M+1].
598	<i>N</i> -((ciclopentilmetil)(oxo)(2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)- λ^6 -sulfaneilideno)ciclopropanocarboxamida	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,50 (s, 1H), 9,34 (d, <i>J</i> = 2,4 Hz, 1H), 8,71 (d, <i>J</i> = 3,4 Hz, 1H), 8,51 (d, <i>J</i> = 9,5 Hz, 2H), 7,97 (d, <i>J</i> = 9,3 Hz, 1H), 7,70-7,67 (m, 2H), 3,58 (d, <i>J</i> = 5,9 Hz, 1H), 3,52 (d, <i>J</i> = 5,9 Hz, 1H), 1,79 (s, 2H), 1,63-1,51 (m, 5H), 1,11-1,00 (m, 5H), 0,76-0,73 (m, 4H); ESI MS (m/z): 423,15 [M+1].
599	<i>N</i> -((ciclopentilmetil)(oxo)(2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)- λ^6 -sulfaneilideno)propionamida	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,50 (s, 1H), 9,34 (d, <i>J</i> = 2,4 Hz, 1H), 8,71 (d, <i>J</i> = 3,4 Hz, 1H), 8,52 (s, 2H), 7,97 (d, <i>J</i> = 9,3 Hz, 1H), 7,72-7,67 (m, 2H), 3,57 (d, <i>J</i> = 5,9 Hz, 1H), 3,52 (d, <i>J</i> = 5,9 Hz, 1H), 2,27 (q, <i>J</i> = 7,5 Hz, 2H), 1,79 (s, 2H), 1,61-1,51 (m, 4H), 1,11-1,05 (m, 4H), 0,97 (t, <i>J</i> = 7,6

		Hz, 4H); ESI MS (m/z): 411 [M+1].
600	<i>N</i> -(isobutil(oxo)(2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-λ ⁶ -sulfaneilideno)ciclopropanocarboxamida	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,50 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 9,34 (d, J = 2,2 Hz, 1H), 8,71 (dd, J = 4,8, 1,3 Hz, 1H), 8,52-8,49 (m, 2H), 7,98 (d, J = 9,0 Hz, 1H), 7,71-7,67 (m, 2H), 3,60 (dd, J = 14,5, 6,2 Hz, 1H), 3,51 (dd, J = 14,4, 6,4 Hz, 1H), 2,01 (t, J = 6,7 Hz, 1H), 1,61 (d, J = 6,6 Hz, 1H), 0,98 (d, J = 6,6 Hz, 3H), 0,89 (d, J = 6,8 Hz, 3H), 0,78-0,74 (m, 4H); ESI MS (m/z): 383 [M+1].
601	<i>N</i> -(oxo(pentan-2-il)(2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-λ ⁶ -sulfaneilideno)ciclopropanocarboxamida	¹ H-NMR (400 MHz, CLOROFORMO-D) δ 9,32 (s, 1H), 8,77-8,74 (m, 2H), 8,46-8,45 (m, 2H), 7,89 (d, J = 9,3 Hz, 1H), 7,68-7,62 (m, 2H), 3,59-3,49 (m, 1H), 2,21-2,16 (m, 1H), 1,82-1,77 (m, 1H), 1,48-1,23 (m, 6H), 1,02-0,98 (m, 2H),

		0,96-0,80 (m, 5H); ESI MS (m/z): 397,05 [M+1].
605	<i>N</i> -(oxo(pentan-3-il)(2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-λ ⁶ -sulfaneilideno)ciclopropanocarboxamida	¹ H-NMR (400 MHz, CLOROFORMO-D) δ 9,28 (s, 1H), 8,81-8,73 (m, 2H), 8,48 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 8,41 (d, J = 9,0 Hz, 1H), 7,86 (dd, J = 15,0, 8,7 Hz, 1H), 7,67-7,58 (m, 2H), 3,28-3,22 (m, 1H), 2,19-2,08 (m, 1H), 1,92-1,75 (m, 3H), 1,68-1,57 (m, 1H), 1,13-1,07 (m, 3H), 1,04-0,94 (m, 5H), 0,85-0,77 (m, 2H) ESI MS (m/z): 397,2 [M+1].
606	<i>N</i> -(ciclohexil(oxo)(2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-λ ⁶ -sulfaneilideno)acetamida	¹ H-NMR (400 MHz, MeOD) δ 9,34 (d, J = 2,0 Hz, 1H), 9,27 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 8,71 (dd, J = 4,9, 1,5 Hz, 1H), 8,57-8,53 (m, 2H), 7,97 (d, J = 9,3 Hz, 1H), 7,73-7,69 (m, 2H), 4,60 (s, 1H), 3,51-3,45 (m, 1H), 2,35 (s, 1H), 2,14 (s, 3H), 1,94 (d, J = 15,2 Hz, 2H), 1,86 (d, J = 11,7

		Hz, 1H), 1,69 (s, 1H), 1,49-1,30 (m, 4H); ESI MS (m/z): 382,9 [M+1].
607	<i>N</i> -(oxo(pentan-2-il)(2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-λ ⁶ -sulfaneilideno)propionamida	¹ H-NMR (400 MHz, MeOD) δ 9,31 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 9,25 (s, 1H), 8,68 (dd, J = 4,8, 1,3 Hz, 1H), 8,54-8,51 (m, 2H), 7,95-7,92 (m, 1H), 7,70-7,66 (m, 2H), 4,57 (s, 1H), 3,60-3,53 (m, 1H), 2,44-2,38 (m, 2H), 2,16-1,80 (m, 1H), 1,41 (d, J = 6,8 Hz, 2H), 1,24 (d, J = 6,8 Hz, 2H), 1,15-1,09 (m, 3H), 0,95 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 0,86 (t, J = 7,2 Hz, 2H); ESI MS (m/z): 385,05 [M+1].
608	<i>N</i> -(oxo(pentan-3-il)(2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-λ ⁶ -sulfaneilideno)propionamida	¹ H-NMR (400 MHz, CLOROFORMO-D) δ 9,29 (d, J = 2,1 Hz, 1H), 8,76-8,74 (m, 2H), 8,49 (d, J = 0,6 Hz, 1H), 8,44 (d, J = 8,3 Hz, 1H), 7,88 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 7,66-7,62 (m, 2H), 3,30-3,24 (m, 1H), 2,44 (q, J = 7,5 Hz, 2H), 2,19-2,09 (m,

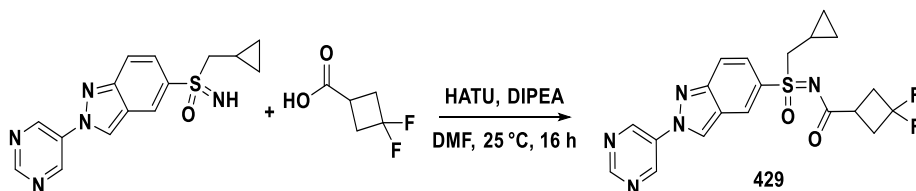
		1H), 1,90-1,79 (m, 2H), 1,68-1,57 (m, 1H), 1,17-1,07 (m, 6H), 0,95 (t, J = 7,5 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 384,95 [M+1].
611	<i>N</i> -(oxo(2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)(3,3,3-trifluoropropil)-λ ⁶ -sulfaneilideno)acetamida	¹ H-NMR (400 MHz, CLOROFORMO-D) δ 9,21 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,73-8,71 (m, 2H), 8,66 (d, J = 0,6 Hz, 1H), 8,30 (dq, J = 8,3, 1,4 Hz, 1H), 7,89 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 7,72 (dd, J = 9,3, 1,7 Hz, 1H), 7,55-7,52 (m, 1H), 4,16-4,11 (m, 1H), 4,00-3,94 (m, 1H), 3,55-3,48 (m, 1H), 3,44-3,37 (m, 1H), 2,61-2,54 (m, 1H), 2,41-2,34 (m, 1H); ESI MS (m/z): 396,85 [M+1].
613	<i>N</i> -(neopentil(oxo)(2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-λ ⁶ -sulfaneilideno)acetamida	¹ H-NMR (400 MHz, METANOL-D4) δ 9,30 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 9,24 (s, 1H), 8,68 (dd, J = 4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,59 (d, J = 1,2 Hz, 1H), 8,52 (dq, J = 8,4, 1,3 Hz, 1H), 7,94 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 7,76 (dd, J = 9,2, 1,8 Hz, 1H), 7,69 (dd,

		J = 8,3, 4,9 Hz, 1H), 3,71 (d, J = 14,7 Hz, 1H), 3,47 (d, J = 14,7 Hz, 1H), 2,05 (d, J = 14,7 Hz, 3H), 1,12 (t, J = 14,7 Hz, 9H); ESI MS (m/z): 370,95 [M+1].
614	<i>N</i> -(neopentil(oxo)(2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-λ ⁶ -sulfaneilideno)ciclopropanocarboxamida	¹ H-NMR (400 MHz, METANOL-D ₄) δ 9,30 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 9,24 (s, 1H), 8,67 (dd, J = 4,9, 1,2 Hz, 1H), 8,56 (d, J = 1,5 Hz, 1H), 8,52 (dq, J = 8,3, 1,3 Hz, 1H), 7,93 (d, J = 9,5 Hz, 1H), 7,74 (dd, J = 9,2, 1,8 Hz, 1H), 7,69 (dd, J = 8,3, 4,9 Hz, 1H), 3,68 (d, J = 14,4 Hz, 1H), 3,42 (d, J = 14,5 Hz, 1H), 1,70-1,65 (m, 1H), 1,12 (d, J = 14,7 Hz, 9H), 0,98-0,81 (m, 4H); ESI MS (m/z): 397,1 [M+1].
616	<i>N</i> -(oxo(propil)(2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-λ ⁶ -sulfaneilideno)acetamida	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,50 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 9,34 (d, J = 2,2 Hz, 1H), 8,71 (dd, J = 4,6, 1,5 Hz, 1H), 8,53-8,49 (m, 2H), 7,98 (d, J = 9,3 Hz, 1H), 7,71-7,67 (m,

		2H), 3,66-3,52 (m, 2H), 2,00 (s, 3H), 1,64-1,44 (m, 2H), 0,89 (t, J = 7,5 Hz, 3H) ESI MS (m/z): 343,05 [M+1].
--	--	--

Para los análogos de acilo fluorado, se usaron los anhídridos de ácido correspondientes.

Ejemplo 11: Síntesis de *N*-((ciclopropilmetil)(oxo)(2-(pirimidin-5-il)-2*H*-indazol-5-il)-λ⁶-sulfaneilideno)-3,3-difluorociclobutano-1-carboxamida **429**



A una solución agitada de (ciclopropilmetil)(imino)(2-(pirimidin-5-il)-2*H*-indazol-5-il)-λ⁶-sulfanona (250 mg, 0,798 mmol) en *N,N*-dimetilformamida (3 mL), se le añadió ácido 3,3-difluorociclobutano-1-carboxílico (130 mg, 0,957 mmol) y 3-óxido hexafluorofosfato de 1-[bis(dimetilamino)metileno]-1*H*-1,2,3-triazolo[4,5-*b*]piridinio (455 mg, 1,197 mmol) a 25 °C. Luego, se añadió *N,N*-diisopropiletilamina (0,278 mL, 1,596 mmol) y la mezcla resultante se agitó a 25 °C durante 16 h. Tras completar la reacción, la mezcla de reacción se inactivó mediante la adición de agua (10 mL), se extrajo con acetato de etilo (3 × 25 mL) y se lavó con salmuera (1 × 25 mL). La capa orgánica se secó más sobre sulfato sódico anhidro, se filtró y se concentró a presión reducida para obtener una goma cruda. El compuesto crudo se purificó mediante HPLC preparativa para obtener la *N*-((ciclopropilmetil)(oxo)(2-(pirimidin-5-il)-2*H*-indazol-5-il)-λ⁶-sulfaneilideno)-3,3-difluorociclobutano-1-carboxamida **429** deseada (88 mg, 0,204 mmol, 26% de rendimiento).

Tabla 11: Se prepararon compuestos representativos de la presente divulgación según el material inicial y los métodos adecuados descritos en el Ejemplo 11.

N.º de comp.	Nombres del compuesto	Datos analíticos
420	1-ciano- <i>N</i> -(isopropil(oxo)(2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)- λ^6 -sulfaneilideno)ciclopropano-1-carboxamida	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, $\text{DMSO-}d_6$) δ 9,58-9,56 (m, 3H), 9,33 (s, 1H), 8,53 (d, $J = 1,0$ Hz, 1H), 8,03 (d, $J = 9,3$ Hz, 1H), 7,64 (dd, $J = 9,2, 1,8$ Hz, 1H), 3,91-3,85 (m, 1H), 1,64-1,46 (m, 4H), 1,36 (d, $J = 6,6$ Hz, 3H), 1,17 (d, $J = 6,6$ Hz, 3H); ESI MS (m/z): 394,6 [$M+1$].
423	<i>N</i> -(isopropil(oxo)(2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)- λ^6 -sulfaneilideno)-1-metilciclopropano-1-carboxamida	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, $\text{DMSO-}d_6$) δ 9,57-9,56 (m, 3H), 9,32 (s, 1H), 8,42 (q, $J = 0,9$ Hz, 1H), 8,01-7,98 (m, 1H), 7,57 (dd, $J = 9,2, 1,8$ Hz, 1H), 3,71 (q, $J = 6,7$ Hz, 1H), 1,28 (d, $J = 6,8$ Hz, 3H), 1,21 (s, 3H), 1,15 (q, $J = 2,8$ Hz, 2H), 1,12 (d, $J = 6,6$ Hz, 3H), 0,65 (dd, $J = 9,0, 6,1$ Hz, 2H); ESI MS (m/z): 384,1 [$M+1$].
425	1-ciano- <i>N</i> -((2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)(isopropil)(oxo)- λ^6 -sulfaneilideno)ciclopropano-1-carboxamida	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, $\text{DMSO-}d_6$) δ 9,56 (d, $J = 0,7$ Hz, 1H), 9,27 (s, 1H), 8,77 (d, $J = 2,2$ Hz, 1H), 8,56 (dt, $J = 9,8, 2,4$ Hz, 1H), 8,50 (t, $J = 0,9$ Hz, 1H), 8,01 (d, $J = 9,3$ Hz, 1H), 7,63 (dd, $J = 9,3, 1,7$ Hz, 1H),

		3,91-3,85 (m, 1H), 1,62-1,46 (m, 4H), 1,36 (d, J = 6,6 Hz, 3H), 1,17 (d, J = 6,6 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 412 [M+1].
426	1-ciano- <i>N</i> -((ciclopropilmetil)(oxo)(2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)- λ^6 -sulfaniliden)ciclopropan-1-carboxamida	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9,62 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 9,56 (d, J = 12,0 Hz, 2H), 9,33 (s, 1H), 8,61 (t, J = 0,9 Hz, 1H), 8,04 (d, J = 9,3 Hz, 1H), 7,75 (dd, J = 9,3, 1,7 Hz, 1H), 3,77 (t, J = 7,6 Hz, 2H), 1,65-1,49 (m, 4H), 0,88-0,82 (m, 1H), 0,50-0,40 (m, 2H), 0,23-0,09 (m, 2H); ESI MS (m/z): 406,9 [M+1].
427	<i>N</i> -((ciclopropilmetil)(oxo)(2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)- λ^6 -sulfaniliden)-3,3,3-trifluoro-2,2-dimetilpropanamida	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9,62 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 9,57 (s, 2H), 9,33 (s, 1H), 8,57 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 8,03 (d, J = 9,3 Hz, 1H), 7,71 (dd, J = 9,3, 2,0 Hz, 1H), 3,79-3,68 (m, 2H), 1,37 (d, J = 8,6 Hz, 6H), 0,83 (t, J = 7,6 Hz, 1H), 0,44-0,39 (m, 2H), 0,18-0,08 (m, 2H); ESI MS (m/z): 452,1 [M+1].

428	<i>N</i> -((ciclopropilmetil)(oxo)(2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)- λ^6 -sulfaniliden)ciclohexancarboxamida	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,59 (d, <i>J</i> = 1,0 Hz, 1H), 9,56 (s, 2H), 9,32 (s, 1H), 8,54 (t, <i>J</i> = 0,9 Hz, 1H), 7,99 (d, <i>J</i> = 9,3 Hz, 1H), 7,71 (dd, <i>J</i> = 9,3, 1,7 Hz, 1H), 3,65 (dq, <i>J</i> = 23,5, 7,3 Hz, 2H), 2,25-2,19 (m, 1H), 1,86 (d, <i>J</i> = 4,2 Hz, 2H), 1,70-1,58 (m, 3H), 1,38-1,13 (m, 5H), 0,81 (t, <i>J</i> = 7,3 Hz, 1H), 0,45-0,35 (m, 2H), 0,13-0,03 (m, 2H); ESI MS (<i>m/z</i>): 424,2 [M+1].
429	<i>N</i> -((ciclopropilmetil)(oxo)(2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)- λ^6 -sulfaniliden)-3,3-difluorociclobutano-1-carboxamida	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,59 (d, <i>J</i> = 1,0 Hz, 1H), 9,57 (s, 2H), 9,33 (s, 1H), 8,58 (d, <i>J</i> = 1,0 Hz, 1H), 8,01 (d, <i>J</i> = 9,3 Hz, 1H), 7,73 (dd, <i>J</i> = 9,3, 1,7 Hz, 1H), 3,72 (d, <i>J</i> = 7,1 Hz, 2H), 3,03-2,99 (m, 1H), 2,84-2,74 (m, 4H), 0,83 (t, <i>J</i> = 7,5 Hz, 1H), 0,47-0,37 (m, 2H), 0,16 (q, <i>J</i> = 4,7 Hz, 1H), 0,07-0,03 (m, 1H); ESI MS (<i>m/z</i>): 431,9 [M+1].

430	<i>N</i> -((ciclopropilmetil)(oxo)(2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)- λ^6 -sulfaneiliden)butiramida	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,58-9,55 (m, 3H), 9,32 (d, <i>J</i> = 4,2 Hz, 1H), 8,55 (t, <i>J</i> = 0,9 Hz, 1H), 7,99 (d, <i>J</i> = 9,3 Hz, 1H), 7,72 (dd, <i>J</i> = 9,2, 1,8 Hz, 1H), 3,66 (d, <i>J</i> = 7,3 Hz, 2H), 2,26 (t, <i>J</i> = 7,2 Hz, 2H), 1,54 (td, <i>J</i> = 14,7, 7,4 Hz, 2H), 0,92-0,80 (m, 4H), 0,47-0,34 (m, 2H), 0,13 (td, <i>J</i> = 9,3, 4,9 Hz, 1H), 0,07-0,02 (m, 1H); ESI MS (<i>m/z</i>): 383,95 [M+1].
431	<i>N</i> -((ciclopropilmetil)(oxo)(2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)- λ^6 -sulfaniliden)-1-fluorociclopropan-1-carboxamida	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,60 (d, <i>J</i> = 1,0 Hz, 1H), 9,57 (s, 2H), 9,32 (d, <i>J</i> = 4,2 Hz, 1H), 8,58 (t, <i>J</i> = 0,9 Hz, 1H), 8,02 (d, <i>J</i> = 9,3 Hz, 1H), 7,72 (dd, <i>J</i> = 9,3, 2,0 Hz, 1H), 3,72 (d, <i>J</i> = 7,3 Hz, 2H), 1,36-1,30 (m, 4H), 0,86-0,80 (m, 1H), 0,50-0,37 (m, 2H), 0,17 (td, <i>J</i> = 9,4, 4,8 Hz, 1H), 0,07 (td, <i>J</i> = 9,4, 4,8 Hz, 1H); ESI MS (<i>m/z</i>): 399,9 [M+1].
432	<i>N</i> -((ciclopropilmetil)(oxo)(2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)- λ^6 -sulfaniliden)-	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,60 (t, <i>J</i> = 1,2 Hz, 1H), 9,57 (d, <i>J</i> = 4,2 Hz, 2H),

	2,2-difluorociclopropan-1-carboxamida	9,33-9,30 (m, 1H), 8,58 (dq, J = 5,9, 0,8 Hz, 1H), 8,01 (dd, J = 9,0, 3,7 Hz, 1H), 7,73 (dt, J = 9,2, 1,5 Hz, 1H), 3,78-3,69 (m, 2H), 2,77-2,67 (m, 1H), 1,94-1,82 (m, 2H), 0,87-0,81 (m, 1H), 0,49-0,36 (m, 2H), 0,19-0,12 (m, 1H), 0,10-0,03 (m, 1H); ESI MS (m/z): 417,9 [M+1].
433	<i>N</i> -((ciclopropilmetil)(oxo)(2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-λ ⁶ -sulfaniliden)-2-fluorociclopropan-1-carboxamida	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,58 (s, 1H), 9,56 (d, J = 0,7 Hz, 2H), 9,32 (d, J = 4,4 Hz, 1H), 8,56 (t, J = 0,9 Hz, 1H), 8,01-7,99 (m, 1H), 7,73 (dd, J = 9,3, 1,0 Hz, 1H), 4,98 (s, 1H), 3,69 (d, J = 7,1 Hz, 2H), 2,17-2,08 (m, 1H), 1,49-1,41 (m, 1H), 1,19 (dt, J = 18,2, 6,4 Hz, 1H), 0,83 (s, 1H), 0,48-0,38 (m, 2H), 0,15 (dd, J = 8,8, 5,1 Hz, 1H), 0,07 (s, 1H); ESI MS (m/z): 399,85 [M+1].
434	<i>N</i> -((ciclopropilmetil)(oxo)(2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-λ ⁶ -sulfaniliden)-3-metilciclobutano-1-carboxamida	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,59 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 9,57 (s, 2H), 9,32 (d, J = 4,4 Hz, 1H), 8,53 (d,

		J = 1,0 Hz, 1H), 8,00 (d, J = 9,3 Hz, 1H), 7,71 (qd, J = 4,6, 1,9 Hz, 1H), 3,66 (d, J = 7,1 Hz, 2H), 2,98-2,89 (m, 1H), 2,32-2,29 (m, 1H), 2,27-2,20 (m, 2H), 1,77-1,68 (m, 2H), 1,08 (d, J = 6,4 Hz, 1H), 0,98 (d, J = 5,9 Hz, 2H), 0,83-0,78 (m, 1H), 0,47-0,34 (m, 2H), 0,17-0,11 (m, 1H), 0,07-0,02 (m, 1H); ESI MS (m/z): 410 [M+1].
435	<i>N</i> -((ciclopropilmetil)(oxo)(2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-λ ⁶ -sulfaneiliden)-2,2-difluorobutanamida	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,62 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 9,57 (s, 2H), 9,33 (s, 1H), 8,63 (q, J = 0,8 Hz, 1H), 8,05 (d, J = 9,3 Hz, 1H), 7,74 (dd, J = 9,3, 2,0 Hz, 1H), 3,91-3,81 (m, 2H), 2,15-2,01 (m, 2H), 0,94 (t, J = 7,5 Hz, 3H), 0,89-0,82 (m, 1H), 0,52-0,38 (m, 2H), 0,23 (td, J = 9,5, 4,8 Hz, 1H), 0,09 (td, J = 9,7, 4,5 Hz, 1H); ESI MS (m/z): 419,95 [M+1].
436	<i>N</i> -((ciclopropilmetil)(oxo)(2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-λ ⁶ -sulfaniliden)ciclopentanecarboxamida	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,59 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 9,56 (s, 2H), 9,32 (d, J = 4,2 Hz, 1H), 8,54 (q,

		J = 0,8 Hz, 1H), 8,00 (d, J = 9,3 Hz, 1H), 7,71 (dd, J = 9,3, 1,7 Hz, 1H), 3,71-3,61 (m, 2H), 2,77-2,69 (m, 1H), 1,82-1,70 (m, 4H), 1,61-1,48 (m, 4H), 0,84-0,78 (m, 1H), 0,46-0,34 (m, 2H), 0,15-0,03 (m, 2H); ; ESI MS (m/z): 409,9 [M+1].
437	<i>N</i> -((ciclopropilmetil)(oxo)(2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-λ ⁶ -sulfaniliden)-2,2-dimetilciclopropan-1-carboxamida	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,57 (dd, J = 6,9, 1,1 Hz, 3H), 9,32 (d, J = 1,5 Hz, 1H), 8,53 (qd, J = 1,9, 0,9 Hz, 1H), 8,01-7,96 (m, 1H), 7,71 (dt, J = 9,2, 1,7 Hz, 1H), 3,65 (d, J = 7,0 Hz, 2H), 1,67-1,62 (m, 1H), 1,13 (d, J = 2,8 Hz, 3H), 1,08 (d, J = 22,9 Hz, 3H), 0,86-0,81 (m, 2H), 0,72 (q, J = 3,8 Hz, 1H), 0,46-0,35 (m, 2H), 0,15-0,11 (m, 1H), 0,03 (q, J = 4,7 Hz, 1H); ESI MS (m/z): 410 [M+1].
438	3-ciano- <i>N</i> -((ciclopropilmetil)(oxo)(2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-λ ⁶ -sulfaneiliden)propanamida	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,58-9,53 (m, 3H), 9,32 (d, J = 4,6 Hz, 1H), 8,60 (t, J = 0,9 Hz, 1H), 7,99 (d, J = 9,3 Hz, 1H), 7,76 (dd,

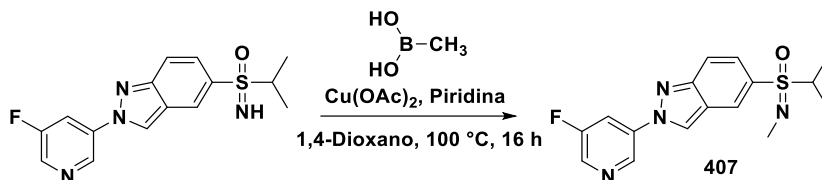
		J = 9,2, 1,8 Hz, 1H), 3,75-3,65 (m, 2H), 2,69-2,60 (m, 4H), 0,90-0,83 (m, 1H), 0,47-0,36 (m, 2H), 0,16-0,04 (m, 2H) ESI MS (m/z): 394,75 [M+1].
439	<i>N</i>-((ciclopropilmetil)(oxo)(2-(pirimidin-5-il)-2<i>H</i>-indazol-5-il)-λ^6-sulfaneiliden)-2-(isopropiltio)acetamida	¹H-NMR (400 MHz, DMSO-<i>d</i>₆) δ 9,60 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 9,57 (s, 2H), 9,32 (d, J = 4,4 Hz, 1H), 8,58 (q, J = 0,8 Hz, 1H), 8,01 (d, J = 9,3 Hz, 1H), 7,77-7,73 (m, 1H), 3,71-3,63 (m, 2H), 3,28-3,23 (m, 2H), 3,06-3,00 (m, 1H), 1,25-1,14 (m, 6H), 0,89-0,82 (m, 1H), 0,47-0,35 (m, 2H), 0,17-0,03 (m, 2H); ESI MS (m/z): 430,1 [M+1].
440	<i>N</i>-((ciclopropilmetil)(oxo)(2-(pirimidin-5-il)-2<i>H</i>-indazol-5-il)-λ^6-sulfaneiliden)-2-(isobutiltio)acetamida	¹H-NMR (400 MHz, DMSO-<i>d</i>₆) δ 9,59 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 9,57 (s, 2H), 9,32 (d, J = 4,4 Hz, 1H), 8,58 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 8,00 (d, J = 9,3 Hz, 1H), 7,75 (dd, J = 9,3, 1,7 Hz, 1H), 3,73-3,63 (m, 2H), 3,22 (dd, J = 18,6, 13,9 Hz, 2H), 2,47 (d, J = 6,8 Hz, 2H), 1,82-1,72 (m, 1H), 0,94-0,83 (m, 7H),

		0,47-0,35 (m, 2H), 0,10 (tq, J = 18,1, 4,8 Hz, 2H); ESI MS (m/z): 444,3 [M+1].
441	<i>N</i> -((ciclopropilmetil)(oxo)(2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-λ ⁶ -sulfaniliden)-1-metilciclopropan-1-carboxamida	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,59 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 9,56 (s, 2H), 9,32 (s, 1H), 8,52 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 8,00 (d, J = 9,3 Hz, 1H), 7,70 (dd, J = 9,2, 1,8 Hz, 1H), 3,67-3,58 (m, 2H), 1,25-1,20 (m, 3H), 1,16 (d, J = 2,9 Hz, 2H), 0,82-0,77 (m, 1H), 0,70-0,64 (m, 2H), 0,47-0,36 (m, 2H), 0,15-0,04 (m, 2H) ESI MS (m/z): 396,15 [M+1].
442	1-ciano- <i>N</i> -((ciclopropilmetil)(oxo)(2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-λ ⁶ -sulfaniliden)ciclobutano-1-carboxamida	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,63 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 9,57 (s, 2H), 9,33 (s, 1H), 8,63 (t, J = 0,9 Hz, 1H), 8,05 (d, J = 9,3 Hz, 1H), 7,76 (dd, J = 9,3, 2,0 Hz, 1H), 3,82 (d, J = 7,1 Hz, 2H), 2,66-2,52 (m, 4H), 2,15-1,96 (m, 2H), 0,87-0,82 (m, 1H), 0,50-0,39 (m, 2H), 0,21 (td, J = 9,2, 4,9 Hz, 1H), 0,14-0,08 (m, 1H); ESI MS (m/z): 421 [M+1].

443	<i>N</i> -((ciclopropilmetil)(oxo)(2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)- λ^6 -sulfaniliden)-3,3-dimetilciclobutano-1-carboxamida	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,59 (d, <i>J</i> = 1,0 Hz, 1H), 9,57 (s, 2H), 9,32 (d, <i>J</i> = 4,4 Hz, 1H), 8,54 (q, <i>J</i> = 0,9 Hz, 1H), 7,99 (d, <i>J</i> = 9,3 Hz, 1H), 7,70 (dd, <i>J</i> = 9,2, 1,8 Hz, 1H), 3,66 (d, <i>J</i> = 7,1 Hz, 2H), 3,11-3,02 (m, 1H), 1,98-1,85 (m, 4H), 1,13 (s, 3H), 1,02 (t, <i>J</i> = 12,2 Hz, 3H), 0,83-0,79 (m, 1H), 0,45-0,36 (m, 2H), 0,16-0,11 (m, 1H), 0,07-0,02 (m, 1H); ESI MS (<i>m/z</i>): 424,4 [M+1].
444	<i>N</i> -((ciclopropilmetil)(oxo)(2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)- λ^6 -sulfaniliden)-1-metilciclobutano-1-carboxamida	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,60 (d, <i>J</i> = 0,7 Hz, 1H), 9,57 (s, 2H), 9,32 (d, <i>J</i> = 4,4 Hz, 1H), 8,54 (q, <i>J</i> = 0,9 Hz, 1H), 8,00 (d, <i>J</i> = 9,3 Hz, 1H), 7,72 (dd, <i>J</i> = 9,3, 1,7 Hz, 1H), 3,73-3,62 (m, 2H), 2,44-2,36 (m, 2H), 1,93-1,84 (m, 1H), 1,76-1,69 (m, 3H), 1,36 (d, <i>J</i> = 9,8 Hz, 3H), 0,83-0,78 (m, 1H), 0,46-0,36 (m, 2H), 0,15-0,05 (m, 2H); ESI MS (<i>m/z</i>): 410,45 [M+1].

445	<i>N</i> -((2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)(isopropil)(oxo)- λ^6 -sulfaniliden)ciclohexancarboxamida	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,55 (d, <i>J</i> = 0,9 Hz, 1H), 9,27 (s, 1H), 8,76 (d, <i>J</i> = 2,8 Hz, 1H), 8,56 (dt, <i>J</i> = 9,8, 2,3 Hz, 1H), 8,41 (d, <i>J</i> = 0,9 Hz, 1H), 7,97 (d, <i>J</i> = 9,2 Hz, 1H), 7,58 (dd, <i>J</i> = 9,3, 1,7 Hz, 1H), 3,79-3,72 (m, 1H), 2,22 (qd, <i>J</i> = 7,2, 3,6 Hz, 1H), 1,89-1,82 (m, 2H), 1,68 (t, <i>J</i> = 4,4 Hz, 2H), 1,59 (d, <i>J</i> = 11,6 Hz, 1H), 1,37-1,12 (m, 11H); ESI MS (<i>m/z</i>): 429,3 [M+1].
449	<i>N</i> -((ciclopropilmetil)(2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)(oxo)- λ^6 -sulfaniliden)-1-metilciclopropan-1-carboxamida	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,58 (s, 1H), 9,28 (s, 1H), 8,76 (d, <i>J</i> = 2,4 Hz, 1H), 8,58-8,54 (m, 1H), 8,49 (s, 1H), 7,98 (d, <i>J</i> = 9,0 Hz, 1H), 7,69 (dd, <i>J</i> = 9,3, 1,7 Hz, 1H), 3,63-3,61 (m, 2H), 1,24 (d, <i>J</i> = 8,8 Hz, 3H), 1,16 (d, <i>J</i> = 2,9 Hz, 2H), 0,79 (t, <i>J</i> = 7,6 Hz, 1H), 0,65 (d, <i>J</i> = 3,2 Hz, 2H), 0,44-0,40 (m, 2H), 0,14-0,06 (m, 2H); ESI MS (<i>m/z</i>): 413 [M+1].

Ejemplo 12: Síntesis de (2-(5-fluoropiridin-3-il)-2*H*-indazol-5-il)(isopropil)(metilimino)-λ⁶-sulfanona **407**



A una solución agitada desgasificada de (2-(5-fluoropiridin-3-il)-2*H*-indazol-5-il)(imino)(isopropil)-λ⁶-sulfanona (300 mg, 0,942 mmol) en 1,4-dioxano (15 mL), se agregó acetato de cobre(II) (257 mg, 1,413 mmol), piridina (0,183 mL, 2,262 mmol) y ácido metilborónico (282 mg, 4,71 mmol). La mezcla resultante se agitó en condición de reflujo (100 °C) durante 16 h. Luego de completarse la reacción, se eliminó 1,4-dioxano a presión reducida y la mezcla de reacción se diluyó con acetato de etilo (60 mL). La capa orgánica se extrajo con agua (3 × 20 mL), se lavó con salmuera (1 × 25 mL) y se secó sobre sulfato de sodio anhidro. Luego se concentró a presión reducida para obtener sólido crudo. El material crudo se purificó aún más mediante HPLC preparativa para obtener la 2-(5-fluoropiridin-3-il)-2*H*-indazol-5-il)(isopropil)(metilimino)-λ⁶-sulfanona **407** deseada (175 mg, 0,526 mmol, 56% de rendimiento).

Tabla 12: Se prepararon compuestos representativos de la presente divulgación según el material inicial y los métodos adecuados descritos en el Ejemplo 12.

N.º de comp.	Nombres del compuesto	Datos analíticos
405	(ciclopropilimino)(2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)(isopropil)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,50 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 9,26 (s, 1H), 8,75 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,54 (dt, J = 9,8, 2,3 Hz, 1H), 8,38 (s, 1H), 7,93 (d, J = 9,0 Hz, 1H), 7,63 (dd, J = 9,0, 1,7 Hz, 1H), 3,44-3,38 (m, 1H), 2,33-2,28 (m, 1H),

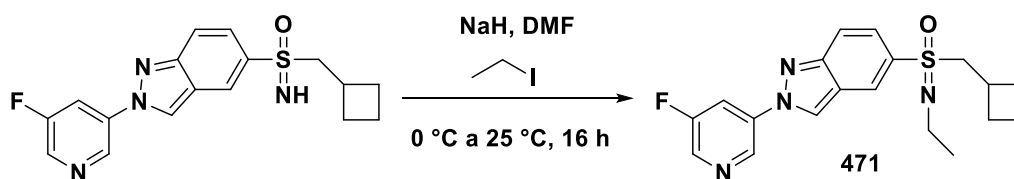
		1,24 (d, J = 6,6 Hz, 3H), 1,07 (d, J = 6,6 Hz, 3H), 0,41-0,34 (m, 2H), 0,32-0,21 (m, 2H); ESI MS (m/z): 358,55 [M+1].
406	(ciclopropilimino)(isopropil)(2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,46 (s, 1H), 9,33 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,70 (dd, J = 4,6, 1,2 Hz, 1H), 8,50 (dq, J = 8,3, 1,4 Hz, 1H), 8,38 (s, 1H), 7,93 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 7,68 (q, J = 4,3 Hz, 1H), 7,62 (dd, J = 9,2, 1,8 Hz, 1H), 3,43-3,37 (m, 1H), 2,32-2,28 (m, 1H), 1,24 (d, J = 6,7 Hz, 3H), 1,07 (d, J = 6,7 Hz, 3H), 0,41-0,34 (m, 2H), 0,32-0,22 (m, 2H); ESI MS (m/z): 341,35 [M+1].
407	(2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)(isopropil)(metilimino)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,50 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 9,26 (q, J = 0,7 Hz, 1H), 8,75 (d, J = 3,1 Hz, 1H), 8,55 (dt, J = 9,8, 2,3 Hz, 1H), 8,31 (q, J = 0,8 Hz, 1H), 7,93 (dd, J = 9,2, 0,9 Hz, 1H), 7,57 (dd, J = 9,2, 1,5 Hz, 1H), 3,43-3,36 (m, 1H), 2,53 (s, 3H), 1,25 (d, J = 6,7 Hz, 3H), 1,10 (d, J = 7,0 Hz, 3H)

		ESI MS (m/z): 333,1 [M+1].
408	isopropil(metilimino)(2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)- λ^6 -sulfanona	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, $\text{DMSO-}d_6$) δ 9,45 (d, $J = 0,7$ Hz, 1H), 9,33 (d, $J = 2,2$ Hz, 1H), 8,70 (dd, $J = 4,8, 1,3$ Hz, 1H), 8,50 (dq, $J = 8,3, 1,4$ Hz, 1H), 8,31 (q, $J = 0,8$ Hz, 1H), 7,94 (d, $J = 9,0$ Hz, 1H), 7,68 (ddd, $J = 8,3, 4,6, 0,7$ Hz, 1H), 7,56 (dd, $J = 9,0, 1,7$ Hz, 1H), 3,42-3,35 (m, 1H), 2,53 (s, 3H), 1,26-1,22 (m, 3H), 1,11 (d, $J = 6,8$ Hz, 3H); ESI MS (m/z): 315,35 [M+1].
412	(ciclopropilimino)(ciclopropilmetil)(2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)- λ^6 -sulfanona	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, $\text{DMSO-}d_6$) δ 9,51 (d, $J = 0,7$ Hz, 1H), 9,27 (s, 1H), 8,74 (d, $J = 2,7$ Hz, 1H), 8,55 (dt, $J = 9,8, 2,3$ Hz, 1H), 8,43 (q, $J = 0,8$ Hz, 1H), 7,92 (d, $J = 9,0$ Hz, 1H), 7,69 (dd, $J = 9,3, 1,7$ Hz, 1H), 3,26 (d, $J = 7,1$ Hz, 2H), 2,35-2,30 (m, 1H), 0,90-0,83 (m, 1H), 0,44-0,35 (m, 3H), 0,34-0,22 (m, 3H), 0,12 (td, $J = 9,7, 4,8$ Hz, 1H), -0,06 (dt, $J = 14,9, 4,6$ Hz, 1H); ESI MS (m/z): 371 [M+1].

414	(ciclopropilmetil)(2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)(metilimino)- λ^6 -sulfanona	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, $\text{DMSO-}d_6$) δ 9,50 (d, $J = 1,0$ Hz, 1H), 9,27 (s, 1H), 8,75 (q, $J = 2,8$ Hz, 1H), 8,55 (dt, $J = 9,9, 2,3$ Hz, 1H), 8,38 (q, $J = 0,8$ Hz, 1H), 7,92 (d, $J = 9,3$ Hz, 1H), 7,64 (dd, $J = 9,0, 1,7$ Hz, 1H), 3,26-3,24 (m, 2H), 2,54 (s, 3H), 0,93-0,86 (m, 1H), 0,45-0,30 (m, 2H), 0,04 (dtd, $J = 55,2, 9,6, 4,8$ Hz, 2H); ESI MS (m/z): 344,9 [M+1].
446	(ciclopropilimino)(ciclopropilmetil)(2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)- λ^6 -sulfanona	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, $\text{DMSO-}d_6$) δ 9,55 (s, 2H), 9,54-9,53 (m, 1H), 9,31 (s, 1H), 8,46 (s, 1H), 7,94 (d, $J = 9,2$ Hz, 1H), 7,69 (dd, $J = 9,2, 1,5$ Hz, 1H), 3,26 (d, $J = 7,3$ Hz, 2H), 2,36-2,31 (m, 1H), 0,90-0,84 (m, 1H), 0,44-0,21 (m, 6H), 0,11 (td, $J = 9,7, 4,8$ Hz, 1H), -0,07 (td, $J = 9,7, 4,9$ Hz, 1H); ESI MS (m/z): 354 [M+1].
447	(ciclopropilmetil)(metilimino)(2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)- λ^6 -sulfanona	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, $\text{DMSO-}d_6$) δ 9,55 (d, $J = 4,3$ Hz, 2H), 9,52 (d, $J = 0,6$ Hz, 1H), 9,31-9,29 (m, 1H), 8,40 (d, $J = 0,9$ Hz, 1H), 7,93 (q, $J = 4,7$ Hz, 1H), 7,65 (dd, $J = 9,2, 1,5$ Hz, 1H),

		3,27-3,24 (m, 2H), 2,53 (d, J = 3,7 Hz, 3H), 0,94-0,87 (m, 1H), 0,45-0,30 (m, 2H), 0,11 (td, J = 9,5, 4,9 Hz, 1H), -0,03 (td, J = 9,6, 4,8 Hz, 1H); ESI MS (m/z): 328,1 [M+1].
--	--	--

Ejemplo 13: Síntesis de (ciclobutilmetil)(etilimino)(2-(5-fluoropiridin-3-il)-2*H*-indazol-5-il)-λ⁶-sulfanona **471**



A una solución agitada de (ciclobutilmetil)(2-(5-fluoropiridin-3-il)-2*H*-indazol-5-il)(imino)-λ⁶-sulfanona (250 mg, 0,726 mmol) en *N,N*-dimetilformamida (6 mL), hidruro de sodio (60% de dispersión en aceite mineral, 58,1 mg, 1,452 mmol) se agregó en atmósfera de nitrógeno a 0 °C y la mezcla resultante se agitó aún más a 25 °C durante 15 minutos. Luego, se enfrió a 0 °C y se agregó 1-yodoetano (0,117 mL, 1,452 mmol) a la misma temperatura. La mezcla de reacción resultante se agitó a 25 °C durante 16 h. Después de completarse la reacción, la masa de reacción se vertió en agua, y la capa acuosa se extrajo con acetato de etilo (3 × 20 mL). La capa orgánica se separó, se secó sobre sulfato de sodio anhidro, se filtró, y se concentró a presión reducida para obtener un sólido crudo. El material crudo se purificó mediante HPLC preparativa para obtener la (ciclobutilmetil)(etilimino)(2-(5-fluoropiridin-3-il)-2*H*-indazol-5-il)-λ⁶-sulfanona **471** deseada (167 mg, 0,448 mmol, 62% de rendimiento).

Tabla 13: Se prepararon compuestos representativos de la presente divulgación según el material inicial y los métodos adecuados descritos en el Ejemplo 13.

N.º de comp.	Nombres del compuesto	Datos analíticos

382	(etilimino)(isopropil)(2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-4-il)- λ^6 -sulfanona	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, $\text{DMSO-}d_6$) δ 9,33 (d, $J = 2,4$ Hz, 1H), 9,16 (d, $J = 0,9$ Hz, 1H), 8,69 (dd, $J = 4,7$, 1,4 Hz, 1H), 8,51 (dq, $J = 8,3$, 1,4 Hz, 1H), 8,05 (d, $J = 8,6$ Hz, 1H), 7,66-7,60 (m, 2H), 7,54 (dd, $J = 8,6$, 7,0 Hz, 1H), 3,56-3,49 (m, 1H), 2,99-2,92 (m, 1H), 2,89-2,83 (m, 1H), 1,32 (t, $J = 7,0$ Hz, 3H), 1,11-1,02 (m, 6H); ESI MS (m/z): 329,15 [$M+1$].
383	(etilimino)(isopropil)(2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)- λ^6 -sulfanona	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, $\text{DMSO-}d_6$) δ 9,45 (d, $J = 0,7$ Hz, 1H), 9,33 (d, $J = 2,4$ Hz, 1H), 8,70 (dd, $J = 4,8$, 1,3 Hz, 1H), 8,50 (dq, $J = 8,3$, 1,4 Hz, 1H), 8,32 (s, 1H), 7,93 (d, $J = 9,3$ Hz, 1H), 7,68 (dd, $J = 8,3$, 4,6 Hz, 1H), 7,58 (dd, $J = 9,2$, 1,6 Hz, 1H), 3,41-3,34 (m, 1H), 2,94-2,86 (m, 1H), 2,84-2,75 (m, 1H), 1,26-1,22 (m, 3H), 1,10-1,05 (m, 6H); ESI MS (m/z): 328,55 [$M+1$].
388	(ciclopropilmetil)(etilimino)(2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)- λ^6 -sulfanona	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, $\text{DMSO-}d_6$) δ 9,46 (s, 1H), 9,34 (s, 1H), 8,70 (d, $J = 4,6$ Hz, 1H), 8,50 (d, $J = 7,1$ Hz, 1H), 8,38 (s, 1H), 7,91 (d, $J = 9,0$ Hz, 1H), 7,70-7,64 (m, 2H), 3,24 (d, $J = 7,1$ Hz, 2H), 2,94-2,79 (m, 2H), 1,07 (t, $J = 7,2$ Hz, 3H), 0,87 (d, $J = 7,6$ Hz, 1H), 0,43-0,38 (m, 1H),

		0,33 (dd, J = 13,8, 4,5 Hz, 1H), 0,14-0,09 (m, 1H), -0,02--0,07 (m, 1H) ESI MS (m/z): 341,05 [M+1].
390	butil(etilimino)(2-(piridin-3-il)-2H-indazol-5-il)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,45 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 9,33 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,70 (dd, J = 4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,50 (dq, J = 8,3, 1,4 Hz, 1H), 8,36 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 7,93 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 7,70-7,66 (m, 1H), 7,62 (dd, J = 9,2, 1,8 Hz, 1H), 3,27-3,21 (m, 2H), 2,93-2,85 (m, 1H), 2,81-2,72 (m, 1H), 1,63-1,52 (m, 1H), 1,50-1,39 (m, 1H), 1,34-1,25 (m, 2H), 1,10-1,04 (m, 3H), 0,86-0,77 (m, 3H); ESI MS (m/z): 343,1 [M+1].
391	etil(etilimino)(2-(piridin-3-il)-2H-indazol-5-il)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,46 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 9,33 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,70 (dd, J = 4,6, 1,5 Hz, 1H), 8,44-8,56 (1H), 8,35 (t, J = 0,9 Hz, 1H), 7,93 (d, J = 9,0 Hz, 1H), 7,61 (dd, J = 9,3, 1,7 Hz, 2H), 3,26 (dd, J = 7,5, 5,7 Hz, 2H), 2,89 (s, 1H), 2,80 (d, J = 7,3 Hz, 1H), 1,07 (td, J = 7,2, 5,4 Hz, 6H) ESI MS (m/z): 315,05 [M+1].
397	(etilimino)(2-(5-fluoropiridin-3-il)-2H-indazol-5-il)(isopropil)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,50 (s, 1H), 9,26 (s, 1H), 8,75 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,54 (dt, J = 9,7, 2,3 Hz, 1H), 8,32 (s, 1H), 7,93 (d,

		J = 9,0 Hz, 1H), 7,59 (dd, J = 9,3, 1,7 Hz, 1H), 3,39 (t, J = 6,8 Hz, 1H), 2,93-2,86 (m, 1H), 2,83-2,77 (m, 1H), 1,26 (d, J = 6,8 Hz, 3H), 1,07 (dd, J = 13,0, 6,8 Hz, 6H) ESI MS (m/z): 347 [M+1].
400	(etilimino)(2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -pirazolo[3,4- <i>b</i>]piridin-5-il)(isopropil)-λ ⁶ -sulfanona	¹H-NMR (400 MHz, DMSO-<i>d</i>₆) δ 9,52 (s, 1H), 9,29 (s, 1H), 8,90 (d, J = 2,2 Hz, 1H), 8,79 (d, J = 2,2 Hz, 2H), 8,60 (dd, J = 9,8, 2,4 Hz, 1H), 3,50 (t, J = 6,7 Hz, 1H), 2,96-2,89 (m, 1H), 2,87-2,80 (m, 1H), 1,27 (d, J = 6,6 Hz, 3H), 1,13 (d, J = 6,8 Hz, 3H), 1,08 (t, J = 7,2 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 348 [M+1].
411	(ciclopropilmetil)(etilimino)(2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-λ ⁶ -sulfanona	¹H-NMR (400 MHz, DMSO-<i>d</i>₆) δ 9,50 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 9,27 (s, 1H), 8,74 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,54 (dt, J = 9,9, 2,4 Hz, 1H), 8,38 (d, J = 0,6 Hz, 1H), 7,91 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 7,66 (dd, J = 9,2, 1,5 Hz, 1H), 3,24 (d, J = 7,3 Hz, 2H), 2,96-2,88 (m, 1H), 2,86-2,77 (m, 1H), 1,07 (t, J = 7,2 Hz, 3H), 0,91-0,85 (m, 1H), 0,45-0,38 (m, 1H), 0,35-0,29 (m, 1H), 0,11 (td, J = 9,6, 4,9 Hz, 1H), -0,05 (td, J = 9,9, 4,8 Hz, 1H); ESI MS (m/z): 358,95 [M+1].

419	(etilimino)(isopropil)(2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,54 (s, 2H), 9,51 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 9,31 (s, 1H), 8,34 (t, J = 0,8 Hz, 1H), 7,94 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 7,60 (dd, J = 9,2, 1,8 Hz, 1H), 3,42-3,36 (m, 1H), 2,94-2,86 (m, 1H), 2,83-2,75 (m, 1H), 1,26-1,21 (m, 3H), 1,10-1,03 (m, 6H); ESI MS (m/z): 329,5 [M+1].
457	etil(etilimino)(2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,55 (s, 2H), 9,52 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 9,31 (s, 1H), 8,38 (d, J = 0,6 Hz, 1H), 7,95 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 7,64 (dd, J = 9,2, 1,5 Hz, 1H), 3,30-3,23 (m, 2H), 2,92-2,86 (m, 1H), 2,83-2,76 (m, 1H), 1,07 (dd, J = 13,3, 7,2 Hz, 6H) ESI MS (m/z): 316 [M+1].
461	etil(etilimino)(2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,50 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 9,26 (s, 1H), 8,74 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,54 (dt, J = 9,9, 2,3 Hz, 1H), 8,35 (t, J = 0,7 Hz, 1H), 7,93 (d, J = 9,3 Hz, 1H), 7,62 (dd, J = 9,0, 1,7 Hz, 1H), 3,30-3,21 (m, 2H), 2,94-2,86 (m, 1H), 2,83-2,74 (m, 1H), 1,07 (q, J = 7,1 Hz, 6H); ESI MS (m/z): 332,95 [M+1].
466	(ciclobutilmetil)(etilimino)(2-(pirimidin-5-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,55 (s, 2H), 9,51 (s, 1H), 9,31 (s, 1H), 8,37 (s, 1H), 7,93 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 7,63 (dd, J = 9,2, 1,8 Hz, 1H), 3,42 (td,

		J = 14,0, 7,2 Hz, 2H), 2,90-2,83 (m, 1H), 2,80-2,73 (m, 1H), 2,59 (d, J = 7,3 Hz, 1H), 1,95-1,92 (m, 1H), 1,73-1,64 (m, 4H), 1,56-1,51 (m, 1H), 1,05 (t, J = 7,2 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 356,05 [M+1].
471	(ciclobutilmetil)(etilimino)(2-(5-fluoropiridin-3-il)-2H-indazol-5-il)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, CLOROFORMO-D) δ 9,05 (d, J = 1,8 Hz, 1H), 8,68 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 8,59 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,43 (d, J = 0,6 Hz, 1H), 8,13 (dt, J = 9,0, 2,4 Hz, 1H), 7,89 (dd, J = 9,2, 0,9 Hz, 1H), 7,68 (dd, J = 9,2, 1,5 Hz, 1H), 3,45-3,34 (m, 2H), 3,10-3,01 (m, 1H), 2,94-2,86 (m, 1H), 2,81-2,73 (m, 1H), 2,14-2,06 (m, 1H), 1,92-1,71 (m, 4H), 1,58-1,50 (m, 1H), 1,20 (t, J = 7,3 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 373,2 [M+1].
474	(etilimino)(metil)(2-(pirimidin-5-il)-2H-indazol-5-il)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, CLOROFORMO-D) δ 9,38 (d, J = 3,4 Hz, 2H), 9,33 (s, 1H), 8,71 (s, 1H), 8,54 (s, 1H), 7,96 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 7,77 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 3,25 (s, 3H), 3,12-3,02 (m, 1H), 2,92 (dt, J = 19,8, 7,0 Hz, 1H), 1,22 (q, J = 6,7 Hz, 3H) ESI MS (m/z): 302,15 [M+1].
489	(etilimino)(2-(5-fluoropiridin-3-il)-2H-indazol-5-il)(propil)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO-d ₆) δ 9,50 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 9,26 (s, 1H), 8,74 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 8,54 (dt, J = 9,8,

		2,3 Hz, 1H), 8,36 (q, J = 0,8 Hz, 1H), 7,93 (d, J = 9,0 Hz, 1H), 7,63 (dd, J = 9,0, 1,7 Hz, 1H), 3,23 (t, J = 7,9 Hz, 2H), 2,93-2,85 (m, 1H), 2,81-2,73 (m, 1H), 1,66-1,46 (m, 2H), 1,05 (t, J = 7,1 Hz, 3H), 0,87 (t, J = 7,5 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 346,95 [M+1].
490	sec-butil(etilimino)(2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,49 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 9,26 (s, 1H), 8,75 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 8,54 (dt, J = 9,9, 2,4 Hz, 1H), 8,32 (s, 1H), 7,92 (dd, J = 9,0, 0,7 Hz, 1H), 7,59 (dd, J = 9,3, 1,7 Hz, 1H), 3,20-3,12 (m, 1H), 2,94-2,86 (m, 1H), 2,84-2,76 (m, 1H), 1,40-1,27 (m, 1H), 1,24 (d, J = 6,8 Hz, 2H), 1,09-1,05 (m, 5H), 0,89 (dt, J = 32,4, 7,5 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 361 [M+1].
491	(etilimino)(3-fluoropropil)(2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,51 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 9,27 (s, 1H), 8,75 (d, J = 2,2 Hz, 1H), 8,55 (dt, J = 9,9, 2,3 Hz, 1H), 8,39 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 7,94 (d, J = 9,0 Hz, 1H), 7,65 (dd, J = 9,0, 1,7 Hz, 1H), 4,47 (dt, J = 47,1, 6,0 Hz, 2H), 3,38-3,33 (m, 2H), 2,95-2,76 (m, 2H), 2,04-1,84 (m, 2H), 1,07 (t, J = 7,2 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 364,9 [M+1].

492	(etilimino)(2-(5-fluoropiridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)(pentan-3-il)- λ^6 -sulfanona	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, $\text{DMSO-}d_6$) δ 9,49 (s, 1H), 9,26 (s, 1H), 8,75 (d, $J = 2,4$ Hz, 1H), 8,54 (dt, $J = 9,9, 2,3$ Hz, 1H), 8,33 (s, 1H), 7,92 (d, $J = 9,3$ Hz, 1H), 7,60 (dd, $J = 9,2, 1,6$ Hz, 1H), 3,06-3,00 (m, 1H), 2,89 (dt, $J = 19,4, 7,2$ Hz, 1H), 2,77 (dt, $J = 19,4, 7,2$ Hz, 1H), 1,98-1,90 (m, 1H), 1,79-1,68 (m, 2H), 1,54-1,46 (m, 1H), 1,07 (dd, $J = 14,1, 6,7$ Hz, 3H), 0,96 (t, $J = 7,5$ Hz, 3H), 0,84 (t, $J = 7,6$ Hz, 3H); ESI MS (m/z): 375 [M+1].
567	ciclobutil(etilimino)(2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)- λ^6 -sulfanona	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, $\text{DMSO-}d_6$) δ 9,45 (dd, $J = 7,0, 0,9$ Hz, 1H), 9,33 (q, $J = 2,4$ Hz, 1H), 8,70 (dd, $J = 4,7, 1,4$ Hz, 1H), 8,52-8,48 (m, 1H), 8,33 (q, $J = 0,8$ Hz, 1H), 7,91 (d, $J = 8,9$ Hz, 1H), 7,69-7,65 (m, 1H), 7,57 (dd, $J = 9,2, 1,5$ Hz, 1H), 4,13-4,05 (m, 1H), 2,94-2,85 (m, 1H), 2,84-2,74 (m, 1H), 2,23-2,15 (m, 2H), 1,91-1,75 (m, 3H), 1,07-1,03 (m, 4H); ESI MS (m/z): 340,95 [M+1].
568	(ciclohexilmetil)(etilimino)(2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)- λ^6 -sulfanona	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, $\text{DMSO-}d_6$) δ 9,44 (d, $J = 0,6$ Hz, 1H), 9,33 (d, $J = 2,4$ Hz, 1H), 8,70 (dd, $J = 4,7, 1,4$ Hz, 1H), 8,50 (dq, $J = 8,3, 1,4$ Hz, 1H), 8,37 (d, $J = 0,9$ Hz, 1H), 7,92 (d,

		J = 9,2 Hz, 1H), 7,69-7,62 (m, 2H), 3,17 (dd, J = 6,0, 1,7 Hz, 2H), 2,85 (dd, J = 12,2, 7,3 Hz, 1H), 2,72 (dd, J = 12,2, 7,0 Hz, 1H), 1,84 (d, J = 3,1 Hz, 2H), 1,56 (d, J = 43,4 Hz, 4H), 1,09-1,02 (m, 8H) ESI MS (m/z): 383,05 [M+1].
585	(etilimino)(pentan-3-il)(2-(piridin-3-il)-2H-indazol-5-il)-λ ⁶ -sulfanona	¹H-NMR (400 MHz, DMSO-<i>d</i>₆) δ 9,44 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 9,32 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,70 (dd, J = 4,6, 1,5 Hz, 1H), 8,49 (dq, J = 8,3, 1,3 Hz, 1H), 8,32 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 7,92 (d, J = 9,3 Hz, 1H), 7,68 (dd, J = 8,3, 4,9 Hz, 1H), 7,59 (dd, J = 9,2, 1,6 Hz, 1H), 3,05-2,99 (m, 1H), 2,93-2,85 (m, 1H), 2,81-2,73 (m, 1H), 1,94 (qd, J = 7,3, 4,6 Hz, 1H), 1,79-1,66 (m, 2H), 1,55-1,44 (m, 1H), 1,10-1,02 (m, 3H), 0,96 (t, J = 7,5 Hz, 3H), 0,84 (t, J = 7,6 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 357,05 [M+1].
586	ciclopentil(etilimino)(2-(piridin-3-il)-2H-indazol-5-il)-λ ⁶ -sulfanona	¹H-NMR (400 MHz, DMSO-<i>d</i>₆) δ 9,44 (s, 1H), 9,33 (d, J = 2,1 Hz, 1H), 8,70 (d, J = 4,0 Hz, 1H), 8,50 (d, J = 8,6 Hz, 1H), 8,34 (s, 1H), 7,92 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 7,68 (dd, J = 8,3, 4,9 Hz, 1H), 7,61 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 3,77 (t, J = 7,5 Hz, 1H), 2,91-2,84 (m, 1H), 2,76 (dt, J = 19,4, 7,1 Hz, 1H),

		2,11 (dd, J = 13,4, 7,6 Hz, 1H), 1,94 (d, J = 5,5 Hz, 1H), 1,73 (dd, J = 12,2, 7,0 Hz, 1H), 1,54 (dd, J = 15,3, 6,7 Hz, 4H), 1,48 (t, J = 6,6 Hz, 1H), 1,04 (t, J = 7,2 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 354,95 [M+1].
587	cicloheptil(etilimino)(2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)- λ^6 -sulfanona	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9,44 (d, J = 0,6 Hz, 1H), 9,32 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,70 (dd, J = 4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,49 (dq, J = 8,3, 1,4 Hz, 1H), 8,31 (d, J = 0,6 Hz, 1H), 7,91 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 7,70-7,66 (m, 1H), 7,58 (dd, J = 9,0, 1,7 Hz, 1H), 3,28-3,23 (m, 1H), 2,94-2,85 (m, 1H), 2,82-2,74 (m, 1H), 2,30-2,23 (m, 1H), 1,97-1,91 (m, 1H), 1,68-1,59 (m, 3H), 1,54-1,31 (m, 7H), 1,05 (q, J = 7,2 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 382,95 [M+1].
588	(2-ciclohexiletil)(etilimino)(2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)- λ^6 -sulfanona	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, DMSO- d_6) δ 9,45 (d, J = 0,9 Hz, 1H), 9,33 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,70 (dd, J = 4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,50 (dq, J = 8,3, 1,3 Hz, 1H), 8,35 (d, J = 0,6 Hz, 1H), 7,92 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 7,68 (dd, J = 8,3, 4,9 Hz, 1H), 7,62 (dd, J = 9,2, 1,8 Hz, 1H), 3,28-3,23 (m, 2H), 2,91-2,84 (m, 1H), 2,81-2,74 (m, 1H), 1,59-1,47 (m, 6H), 1,36-1,30 (m, 1H), 1,24-1,20 (m, 1H), 1,11-1,01 (m, 6H), 0,77 (t,

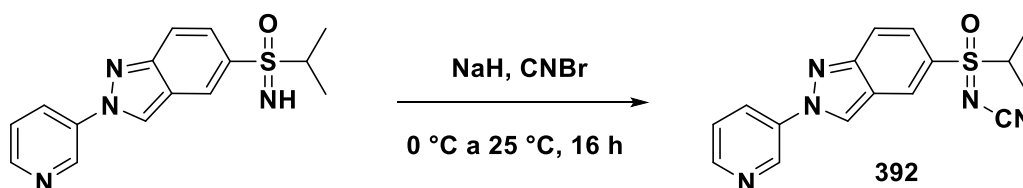
		J = 10,5 Hz, 2H); ESI MS (m/z): 397 [M+1].
589	(etilimino)(isobutil)(2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,45 (s, 1H), 9,33 (d, J = 2,1 Hz, 1H), 8,70 (d, J = 3,7 Hz, 1H), 8,51-8,49 (m, 1H), 8,37 (s, 1H), 7,93 (d, J = 9,2 Hz, 1H), 7,68 (dd, J = 8,3, 4,9 Hz, 1H), 7,63 (dd, J = 9,2, 1,5 Hz, 1H), 3,23-3,12 (m, 2H), 2,89-2,82 (m, 1H), 2,78-2,71 (m, 1H), 2,11-2,05 (m, 1H), 1,04 (t, J = 7,2 Hz, 3H), 0,98 (d, J = 6,7 Hz, 3H), 0,87 (d, J = 6,7 Hz, 3H) ESI MS (m/z): 343 [M+1].
595	ciclohexil(etilimino)(2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,48 (s, 1H), 9,33 (d, J = 2,7 Hz, 1H), 8,71 (dd, J = 4,6, 1,5 Hz, 1H), 8,51 (d, J = 9,3 Hz, 1H), 8,44 (s, 1H), 7,97 (d, J = 8,6 Hz, 1H), 7,69 (dd, J = 8,2, 4,8 Hz, 1H), 7,61 (dd, J = 9,3, 1,2 Hz, 1H), 3,62-3,58 (m, 1H), 2,00 (d, J = 6,6 Hz, 3H), 1,35-1,11 (m, 6H), 0,83 (dt, J = 36,4, 7,2 Hz, 3H) ESI MS (m/z): 369 [M+1].
597	(etilimino)(2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)((tetrahidrofuran-2-il)metil)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,45 (dd, J = 6,1, 0,9 Hz, 1H), 9,33 (d, J = 2,8 Hz, 1H), 8,71-8,69 (m, 1H), 8,52-8,48 (m, 1H), 8,38-8,35 (m, 1H), 7,90 (q, J = 4,6 Hz, 1H), 7,69-7,62 (m, 2H), 4,14 (td, J = 6,2, 2,5 Hz, 1H),

		3,54-3,40 (m, 5H), 2,93-2,73 (m, 2H), 1,77-1,68 (m, 2H), 1,63-1,48 (m, 1H), 1,09-1,03 (m, 3H) ESI MS (m/z): 370,95 [M+1].
603	4-(<i>N</i> -etil-2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-sulfonimidoil)butanonitrilo	¹ H-NMR (400 MHz, MeOD) δ 9,32 (d, J = 2,2 Hz, 1H), 9,25 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 8,69 (dd, J = 4,8, 1,3 Hz, 1H), 8,55-8,52 (m, 2H), 7,97-7,95 (m, 1H), 7,72-7,68 (m, 2H), 3,46-3,42 (m, 2H), 3,08-3,00 (m, 1H), 2,97-2,89 (m, 1H), 2,62 (t, J = 7,2 Hz, 2H), 2,13-1,95 (m, 2H), 1,19 (t, J = 7,2 Hz, 3H) ESI MS (m/z): 353,9 [M+1].
604	(etilimino)(isopentil)(2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, CLOROFORMO-D) δ 9,22 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,74-8,73 (m, 1H), 8,69 (d, J = 0,7 Hz, 1H), 8,50 (s, 1H), 8,30 (dq, J = 8,3, 1,4 Hz, 1H), 7,95-7,90 (m, 1H), 7,71 (dd, J = 9,3, 1,7 Hz, 1H), 7,56-7,52 (m, 1H), 3,49-3,27 (m, 2H), 3,13-3,05 (m, 1H), 2,99-2,90 (m, 1H), 1,78-1,68 (m, 1H), 1,67-1,57 (m, 1H), 1,50-1,41 (m, 1H), 1,25-1,21 (m, 3H), 0,86 (dd, J = 8,7, 6,5 Hz, 6H); ESI MS (m/z): 357,05 [M+1].
612	(etilimino)(2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)(3,3,3-trifluoropropil)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, METANOL-D4) δ 9,31 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 9,24 (s, 1H), 8,68 (dd, J = 4,6, 1,2 Hz, 1H), 8,54-8,51 (m, 2H), 7,96 (d, J = 9,2 Hz, 1H),

		7,73-7,67 (m, 2H), 3,59-3,48 (m, 2H), 3,07-2,92 (m, 2H), 2,76-2,48 (m, 2H), 1,19 (t, J = 7,3 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 382,9 [M+1].
615	(etilimino)(pentan-2-il)(2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)- λ^6 -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, CLOROFORMO-D) δ 9,22 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,73 (dd, J = 4,7, 1,4 Hz, 1H), 8,65 (t, J = 1,2 Hz, 1H), 8,39 (s, 1H), 8,32-8,29 (m, 1H), 7,90 (dd, J = 9,2, 1,2 Hz, 1H), 7,66 (dt, J = 9,2, 1,4 Hz, 1H), 7,54 (dd, J = 8,3, 4,9 Hz, 1H), 3,19-3,05 (m, 2H), 3,00-2,91 (m, 1H), 2,24-1,83 (m, 1H), 1,43-1,36 (m, 3H), 1,28-1,18 (m, 6H), 0,95-0,83 (m, 3H) ESI MS (m/z): 357,15 [M+1].
617	(etilimino)(propil)(2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)- λ^6 -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,46 (d, J = 1,0 Hz, 1H), 9,33 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 8,70 (dd, J = 4,6, 1,5 Hz, 1H), 8,50 (dq, J = 8,3, 1,4 Hz, 1H), 8,35 (q, J = 0,8 Hz, 1H), 7,94-7,91 (m, 1H), 7,68 (ddd, J = 8,4, 4,7, 0,7 Hz, 1H), 7,62 (dd, J = 9,3, 1,7 Hz, 1H), 3,27-3,18 (m, 2H), 2,93-2,84 (m, 1H), 2,81-2,73 (m, 1H), 1,66-1,45 (m, 2H), 1,06 (t, J = 7,1 Hz, 3H), 0,87 (t, J = 7,5 Hz, 3H) ESI MS (m/z): 329,05 [M+1].

618	(etilimino)(neopentil)(2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)- λ^6 -sulfanona	$^1\text{H-NMR}$ (400 MHz, $\text{DMSO-}d_6$) δ 9,59 (s, 1H), 9,36 (d, $J = 2,2$ Hz, 1H), 8,79 (s, 1H), 8,74 (dd, $J = 4,8, 1,3$ Hz, 1H), 8,53 (dq, $J = 8,3, 1,4$ Hz, 1H), 8,14 (d, $J = 9,3$ Hz, 1H), 7,82 (dd, $J = 9,3, 2,0$ Hz, 1H), 7,71 (dd, $J = 8,1, 4,4$ Hz, 1H), 4,13 (d, $J = 30,6$ Hz, 2H), 3,10-2,94 (m, 2H), 1,11 (t, $J = 7,2$ Hz, 3H), 1,03 (d, $J = 14,9$ Hz, 9H); ESI MS (m/z): 357,05 [M+1].
-----	---	--

Ejemplo 14: Síntesis de *N*-(isopropil(oxo)(2-(piridin-3-il)-2*H*-indazol-5-il)- λ^6 -sulfaneiliden) cianamida **392**



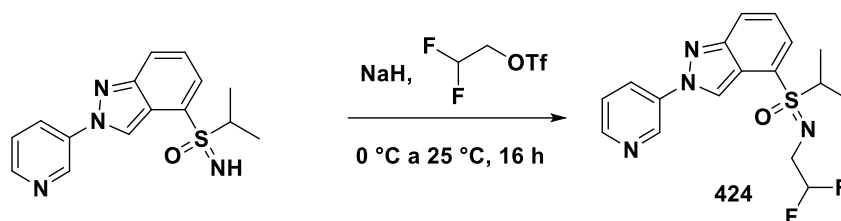
A una solución agitada de imino(isopropil)(2-(piridin-3-il)-2*H*-indazol-5-il)- λ^6 -sulfanona (300 mg, 0,999 mmol) en *N,N*-dimetilformamida (5 mL), hidruro de sodio (59,9 mg, 1,498 mmol) se cargó en atmósfera de nitrógeno, a 25 °C, y se siguió agitandodurante otros 5 a 10 minutos. Luego, la mezcla de reacción se enfrió hasta 0 °C y se agregó bromuro de cianógeno (159 mg, 1,498 mmol) a esta temperatura bajo agitación continua. Después de completarse la adición, la mezcla de reacción se dejó calentar a 25 °C y se agitó durante 12 h a esta temperatura. Después de completarse la reacción, la mezcla se vertió en agua helada y la capa acuosa se extrajo con acetato de etilo (3 × 25 mL). La capa orgánica se separó, se lavó con solución de salmuera (2 × 25 mL), se secó sobre sulfato de sodio anhidro, se filtró y se concentró a presión reducida para obtener un aceite crudo. El material crudo se purificó mediante cromatografía en columna rápida para obtener la *N*-(isopropil(oxo)(2-(piridin-3-il)-2*H*-indazol-5-il)- λ^6 -

sulfaneilideno)cianamida **392** deseada (130 mg, 0,400 mmol, 40,0% de rendimiento).

Tabla 14: Se prepararon compuestos representativos de la presente divulgación según el material inicial y los métodos adecuados descritos en el Ejemplo 14.

N.º de comp.	Nombres del compuesto	Datos analíticos
392	<i>N</i> -(isopropil(oxo)(2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-5-il)-λ ⁶ -sulfaneiliden)cianamida	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,59 (d, <i>J</i> = 0,7 Hz, 1H), 9,35 (d, <i>J</i> = 2,4 Hz, 1H), 8,74 (dd, <i>J</i> = 4,6, 1,5 Hz, 1H), 8,66 (d, <i>J</i> = 1,2 Hz, 1H), 8,53 (dq, <i>J</i> = 8,3, 1,4 Hz, 1H), 8,10 (d, <i>J</i> = 9,3 Hz, 1H), 7,75-7,69 (m, 2H), 1,37 (d, <i>J</i> = 6,8 Hz, 3H), 1,23 (d, <i>J</i> = 6,6 Hz, 4H); ESI MS (<i>m/z</i>): 325,5 [M+1].

Ejemplo 15: Síntesis de ((2,2-difluoroetil)imino)(isopropil)(2-(piridin-3-il)-2*H*-indazol-4-il)-λ⁶-sulfanona **424**



A una solución agitada de imino(isopropil)(2-(piridin-3-il)-2*H*-indazol-4-il)-λ⁶-sulfanona (300 mg, 0,999 mmol) en *N*, se cargó *N*-dimetilformamida (5 mL) hidruro de sodio (59,9 mg, 1,498 mmol) en atmósfera de nitrógeno, a 25 °C, y se siguió agitando durante otros 5 a 10 minutos. Luego, la mezcla de reacción se enfrió hasta 0 °C y se agregó trifluorometansulfonato de 2,2-difluoroetilo (662 µL, 4,99 mmol) a esta temperatura mientras se agitaba. Después de completarse la adición, la mezcla de reacción se dejó calentar a 25 °C y se agitó durante 16 h a esta temperatura. Después de completarse la reacción, la mezcla de reacción se vertió en agua helada y la capa acuosa se extrajo con acetato de etilo (3 × 25 mL). La capa orgánica se separó, se lavó con solución de salmuera

(2 × 25 mL), se secó sobre sulfato de sodio anhidro, se filtró y se concentró a presión reducida para obtener un aceite crudo. El compuesto crudo se purificó mediante cromatografía en columna rápida para obtener la ((2,2-difluoroetil)imino)(isopropil)(2-(piridin-3-il)-2*H*-indazol-4-il)-λ⁶-sulfanona **424** deseada (70 mg, 0,192 mmol, 19,23 % de rendimiento).

Tabla 15: Se prepararon compuestos representativos de la presente divulgación según el material inicial y los métodos adecuados descritos en el Ejemplo 15.

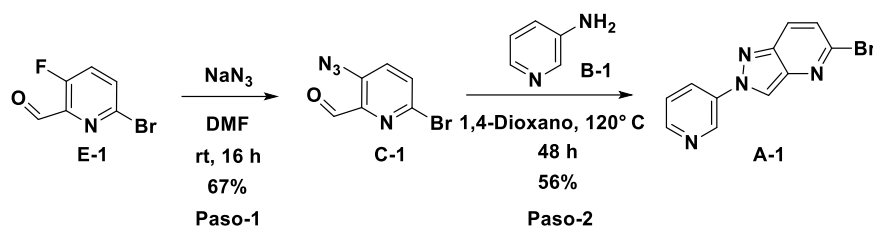
N.º de comp.	Nombres del compuesto	Datos analíticos
424	((2,2-difluoroetil)imino)(isopropil)(2-(piridin-3-il)-2 <i>H</i> -indazol-4-il)-λ ⁶ -sulfanona	¹ H-NMR (400 MHz, DMSO- <i>d</i> ₆) δ 9,36 (d, J = 2,4 Hz, 1H), 9,23 (d, J = 0,5 Hz, 1H), 8,70 (dd, J = 4,6, 1,2 Hz, 1H), 8,55 (dq, J = 8,3, 1,3 Hz, 1H), 8,13-8,08 (m, 1H), 7,69-7,63 (m, 2H), 7,58 (dd, J = 8,6, 7,1 Hz, 1H), 6,01 (tt, J = 56,3, 4,2 Hz, 1H), 3,73-3,66 (m, 1H), 3,25-3,00 (m, 2H), 1,36-1,28 (m, 3H), 1,07 (d, J = 6,6 Hz, 3H); ESI MS (m/z): 364,95 [M+1].

* Los nombres de compuestos se generaron con Chemdraw Professional 19.1

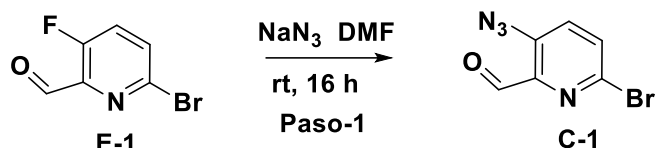
Los compuestos de fórmula A-1, A-2 o A-3 se sintetizan según el esquema general 6-14 descrito en la descripción. En particular, los compuestos de fórmula A-1, donde A₁, A₂ y A₃ representan C y se sintetizan según el procedimiento descrito en WO 201614435 y los compuestos de fórmula A-1, donde uno de los A₁, A₂ y A₃ representan N y se sintetizan según el procedimiento descrito abajo.

Esquema de reacción:

Ejemplo 16:

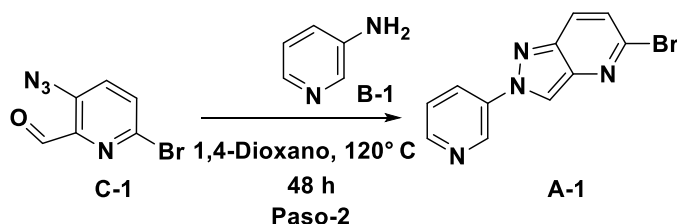


3-azido-6-bromopicolinaldehido:



A una solución agitada de 6-bromo-3-fluoropicolinaldehido **E-1** (8 g, 39,2 mmol) en *N,N*-dimetilformamida (80 mL), se agregó azida de sodio (3,06 g, 47,1 mmol) y la mezcla resultante se agitó a 25 °C durante 16 h. Después de completarse la reacción, la mezcla de reacción se diluyó con agua y la capa acuosa se extrajo con acetato de etilo (3 × 100 mL). La capa orgánica se separó y se lavó con una solución de salmuera (1 × 100 mL). La fase orgánica se secó en sulfato de sodio anhidro, se filtró y se concentró a presión reducida para obtener 3-azido-6-bromopicolinaldehido **C-1** (6 g, 26,4 mmol, 67,4 % de rendimiento). El TLC se comparó con el lugar auténtico.

5-bromo-2-(piridin-3-il)-2*H*-pirazolo[4,3-*b*]piridina:



A una solución agitada de 3-azido-6-bromopicolinaldehido **C-1** (6 g, 26,4 mmol) en 1,4-dioxano (60 mL), se agregó piridin-3-amina **B-1** (2,74 g, 29,1 mmol) y la mezcla resultante se agitó a 120 °C durante 48 h. Después de completarse la reacción, la mezcla de reacción se concentró a presión reducida y se agregó agua para obtener un sólido crudo que se filtró, se recolectó y se purificó aún más mediante cromatografía en columna rápida para obtener la 5-bromo-2-

(piridin-3-il)-2*H*-pirazolo[4,3-*b*]piridina **A-1** deseada (4,1 g, 14,90 mmol, 56,4 % de rendimiento).

Tal como se describe en el presente documento, los compuestos de fórmula (I), muestran actividades insecticidas que se ejercen con respecto a numerosos insectos que atacan a cultivos agrícolas importantes. Se evaluó la actividad de los compuestos de la presente invención, tal como se describe en las siguientes pruebas:

EJEMPLOS BIOLÓGICOS:

Ejemplo A: *Bemisia tabaci*

Para las pruebas se utilizó el método de inmersión de hoja, donde la cantidad requerida por el compuesto se ponderó y se disolvió en un tubo que contenía solución de solvente. El tubo se colocó en un vórtice a 2000 rpm para mezclarse de forma correcta y luego se diluyó con una solución Tritón-X de 0,01% en la concentración de prueba deseada. Las hojas de berenjena se sumergieron en la solución de compuesto durante 10 segundos, se secaron a la sombra durante 20 min y luego se colocaron, con el lado abaxial de la hoja hacia arriba, en 4 mL de solución de agar-agar de 1% solidificada en respectivas tapas contenedoras. Cantidades conocidas de moscas blancas adultas recién emergidas se recolectaron utilizando un aspirador modificada, y se liberaron en un contenedor perforado en donde se colocó la tapa que contenía la hoja tratada. Los contenedores se mantuvieron en una cámara de crecimiento vegetal a una temperatura de 25 °C y una humedad relativa de 70%. Las observaciones de los adultos vivos, moribundos y muertos se registraron 72 h después de la liberación. El porcentaje de mortalidad se calculó mediante la combinación de adultos moribundos y muertos y la comparación del resultado con uno de los controles no tratados. Los compuestos 1 9 11 18 25 28 29 30 31 32 33 34 38 43 48 65 66 68 71 72 73 74 77 78 79 86 87 93 101 104 108 109 110 116 119 122 123 124 126 135 184 186 193 213 214 215 216 218 219 220 221 222 223 224 226 227 228 231 236 237 238 239 240 241 248 249 250 254 255 278 287 288 289 290 291 292 293 294 296 306 307 308 309 310 311 312 313 314 337 354 355 358

368 369 383 385 386 387 389 391 397 406 408 410 418 419 421 446 447 450
455 457 458 461 462 463 465 466 467 470 474 475 478 479 480 482 554 557
561 y 580 registraron $\geq 70\%$ de mortalidad a 300 ppm.

Ejemplo B: *Myzus persicae*

Para las pruebas se utilizó el método de inmersión de hoja, donde la cantidad requerida por el compuesto se ponderó y se disolvió en un tubo que contenía solución de solvente. El tubo se colocó en un vórtice a 2000 rpm para mezclarse de forma correcta y luego se diluyó con una solución Tritón-X de 0,01% en la concentración de prueba deseada. Las hojas de capsicum se sumergieron en la solución de compuesto durante 10 segundos, se secaron a la sombra durante 20 min y luego se colocaron, con el lado abaxial de la hoja hacia arriba, en celdas únicas de una bandeja de bioensayo con 4 mL de solución de agar-agar de 1% solidificada. Cantidades conocidas de ninfas de tercer instar de *Myzus persicae*, se recolectaron en placas petri, se liberaron en la celda con la hoja tratada y la celda se cubrió con una tapa perforada para una mejor aireación. Las bandejas se mantuvieron en una cámara de crecimiento vegetal a una temperatura de 25 °C y una humedad relativa de 70%. Las observaciones de las ninfas vivas, moribundas y muertas se registraron 72 h después de la liberación. El porcentaje de mortalidad se calculó mediante la combinación de ninfas moribundas y muertas y la comparación del resultado con uno de los controles no tratados. Los compuestos 1 2 3 25 28 29 32 41 64 70 71 73 88 89 90 92 99 102 110 112 119 123 124 136 137 138 146 147 148 156 168 180 193 216 217 218 224 236 237 238 239 240 248 249 250 254 255 256 287 288 290 291 306 312 314 337 354 383 386 387 388 389 390 397 406 419 455 456 457 458 460 461 478 479 480 482 483 484 485 486 487 488 490 491 492 557 558 560 564 567 569 y 581 registraron $\geq 70\%$ de mortalidad a 300 ppm.

Ejemplo C: *Nilaparvata lugens*

Para las pruebas se utilizó el método de inmersión de semilla, donde la cantidad requerida por el compuesto se ponderó y se disolvió en un tubo que contenía solución de solvente. El tubo se colocó en un vórtice a 2000 rpm para mezclarse

de forma correcta y luego se diluyó con una solución Tritón-X de 0,01% en la concentración de prueba deseada. Las semillas de arrozal se sumergieron en la solución de compuesto durante 10 segundos, se secaron a la sombra durante 20 min y luego las semillas se colocaron en tubos de ensayo de vidrio con las raíces mantenidas en agua. 15 ninfas de tercer instar de *Nilaparvata lugens* se liberaron en cada tubo de ensayo y los tubos se mantuvieron en una cámara de crecimiento vegetal a una temperatura de 25 °C y humedad relativa de 75%. Las observaciones de las ninfas vivas, moribundas y muertas se registraron 72 h después de la liberación. El porcentaje de mortalidad se calculó mediante la combinación de ninfas moribundas y muertas y la comparación del resultado con uno de los controles no tratados. Los compuestos 1 2 3 4 5 7 8 9 11 12 13 14 16 19 20 21 23 26 27 28 29 30 32 33 38 41 42 51 64 71 72 73 78 86 87 92 93 104 105 111 112 113 114 115 125 126 127 137 146 147 148 152 153 155 181 193 194 202 206 236 238 240 331 337 343 347 354 355 356 357 358 359 360 367 385 386 387 388 389 391 392 394 396 397 402 406 417 419 446 447 450 454 457 461 462 464 470 471 474 y 475 registraron $\geq 70\%$ de mortalidad a 300 ppm. Habiendo descrito la invención en referencia a determinadas realizaciones preferidas, otras realizaciones se harán evidentes para un experto en la materia a partir de la consideración de la memoria.