

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 836 399**

51 Int. Cl.:

C07D 231/12 (2006.01) **A61K 31/506** (2006.01)
C07D 401/12 (2006.01) **A61K 31/4155** (2006.01)
C07D 401/14 (2006.01)
C07D 403/12 (2006.01)
C07D 401/04 (2006.01)
C07D 409/12 (2006.01)
A61P 33/00 (2006.01)
A01N 43/56 (2006.01)
A61K 31/4439 (2006.01)
A61K 31/415 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

- 86 Fecha de presentación y número de la solicitud internacional: **09.03.2016 PCT/EP2016/054955**
 87 Fecha y número de publicación internacional: **15.09.2016 WO16142394**
 96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **09.03.2016 E 16708677 (6)**
 97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **09.09.2020 EP 3268353**

54 Título: **Derivados de pirazolilo como agentes de control de plagas**

30 Prioridad:

10.03.2015 EP 15158341

45 Fecha de publicación y mención en BOPI de la traducción de la patente:
25.06.2021

73 Titular/es:

**BAYER ANIMAL HEALTH GMBH (100.0%)
Kaiser-Wilhelm-Allee 10
51373 Leverkusen, DE**

72 Inventor/es:

**SCHWARZ, HANS-GEORG;
MAUE, MICHAEL;
HALLENBACH, WERNER;
GÖRGENS, ULRICH;
PORTZ, DANIELA;
ILG, KERSTIN;
KÖBBERLING, JOHANNES y
TURBERG, ANDREAS**

74 Agente/Representante:

GONZÁLEZ PECES, Gustavo Adolfo

ES 2 836 399 T3

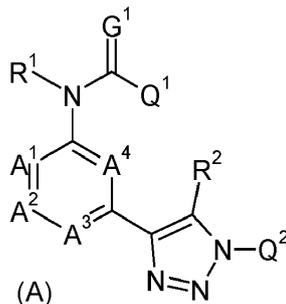
Aviso: En el plazo de nueve meses a contar desde la fecha de publicación en el Boletín Europeo de Patentes, de la mención de concesión de la patente europea, cualquier persona podrá oponerse ante la Oficina Europea de Patentes a la patente concedida. La oposición deberá formularse por escrito y estar motivada; sólo se considerará como formulada una vez que se haya realizado el pago de la tasa de oposición (art. 99.1 del Convenio sobre Concesión de Patentes Europeas).

DESCRIPCIÓN

Derivados de pirazolilo como agentes de control de plagas

La presente solicitud se refiere a nuevos derivados de pirazolilo, a procedimientos para su preparación y a su uso para combatir plagas animales, sobre todo de artrópodos y especialmente de insectos y arácnidos.

- 5 El documento de patente WO2011113756-A1 describe determinados derivados de triazolilo como compuestos insecticidas. A este respecto, la fórmula general (A) comprende en sus definiciones de A¹ a A⁴ CX (X representa hidrógeno, halógeno, ciano, alquiloxi C₁-C₄, alquilo C₁-C₄ o haloalquilo C₁-C₄) o nitrógeno, en donde Q² significa determinados sustituyentes de fenilo o piridilo.



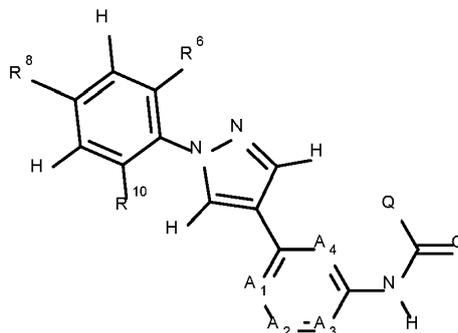
- 10 Los modernos productos fitosanitarios y ectoparasiticidas veterinarios deben cumplir muchos requisitos, por ejemplo con respecto a la dosis, persistencia y extensión de su acción, y uso posible. Hay problemas de toxicidad, capacidad de combinación con otros principios activos o auxiliares de formulación, así como problemas del coste que se debe dedicar para la síntesis de un principio activo. Además pueden aparecer resistencias. Por todos estos motivos, la búsqueda de nuevos productos fitosanitarios o parasiticidas veterinariamente eficaces nunca se ha considerado completa y existe una necesidad continua de nuevos compuestos con propiedades mejoradas en comparación con los compuestos conocidos al menos con respecto a aspectos individuales.
- 15

El objetivo de la presente invención era proporcionar compuestos mediante los cuales se ampliara el espectro de agentes de control de plagas en distintos aspectos y/o mejorara su actividad.

- 20 Se encontró ahora sorprendentemente que determinados derivados de pirazolilo, así como sus N-óxidos y sales del estado de la técnica, presentan propiedades biológicas superiores y son especialmente adecuados para combatir plagas animales y, por lo tanto, se pueden utilizar especialmente bien en el sector agroquímico y en el sector de la salud animal.

Sumario

Un aspecto de la presente invención se refiere al compuesto de la fórmula (I) el compuesto de la fórmula (I')



(I')

- 25 donde

- A₁ representa CR², en donde R² representa hidrógeno,
- A₂ representa CR³ o N, en donde R³ representa hidrógeno,
- A₃ representa CR⁴ o N, en donde R⁴ representa hidrógeno, Cl, F o alquilo C₁-C₃ o -N(alquilo C₁-C₃)₂,
- 30 A₄ representa CR⁵, en donde R⁵ representa hidrógeno o F,

R⁶ representa Cl, Br o alquilo C₁-C₃,

R⁸ representa alquilo C₁-C₄ perfluorado,

R¹⁰ representa Cl, alquilo C₁-C₃ o alquilo C₁-C₃ perfluorado,

5 Q representa (a) cicloalquilo C₃-C₆ opcionalmente sustituido con un sustituyente seleccionado del grupo constituido por halógeno, alquilo C₁-C₃ y ciano, (b) heterociclilo C₂-C₅ opcionalmente sustituido con un sustituyente seleccionado del grupo constituido por halógeno o ciano, (c) un arilo sustituido con 0, 1 o 2 sustituyentes V o un heteroarilo de 5 o 6 miembros sustituido con 0, 1, 2, 3 o 4 sustituyentes V, en donde V representa, independientemente entre sí, halógeno, ciano, representa alquilo C₁-C₆ opcionalmente halogenado, representa alcoxi C₁-C₆ opcionalmente halogenado,

10 así como sales, N-óxidos y formas tautómeras de los compuestos de la fórmula (I').

Una forma de realización preferida adicional se refiere a un compuesto como se describe en el párrafo [0006], en donde Q representa

15 ciclopropilo C₁-C₃ o tietanilo (tiaciclobutanilo) opcionalmente sustituido con ciano o alquilo, o fenilo sustituido con 0, 1 o 2 sustituyentes V seleccionados, independientemente entre sí, del grupo constituido por F, Cl, alcoxi C₁-C₃ (como metoxi y etoxi), alquilo C₁-C₃ (como metilo), alquilo C₁-C₃ halogenado (como CF₃) y ciano, o piridilo, pirimidinilo, tiofenilo, tienilo u oxazolilo sustituido con 0, 1 o 2 sustituyentes V seleccionados, independientemente entre sí, del grupo constituido por F, Cl, alquilo C₁-C₃ (como metilo), alquilo C₁-C₃ halogenado (como CF₃) y ciano.

20 Una forma de realización preferida adicional se refiere a un compuesto como se describe en uno de los párrafos [0006] a [0007], en donde

A₃ representa CR⁴ o N, en donde R⁴ representa hidrógeno, Cl, F, o alquilo C₁-C₃ (como CH₃) o-N(alquilo C₁-C₃)₂ (como -N(CH₃)₂),

B₁ representa CR⁶,

25 R⁶ representa Cl, Br o alquilo C₁-C₃ (como CH₃),

R⁸ representa alquilo C₁-C₄ perfluorado como CF₃, C₂F₅, C₃F₇, C₄F₉,

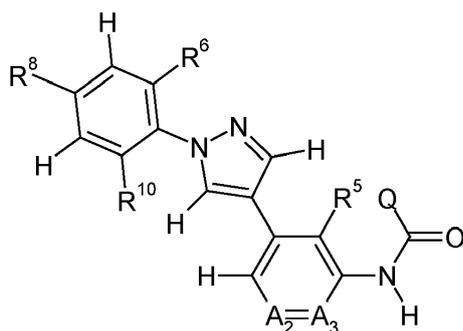
R¹⁰ representa Cl, alquilo C₁-C₃ (como metilo) o alquilo C₁-C₃ perfluorado (como CF₃),

30 Q representa (a) cicloalquilo C₃-C₆ opcionalmente sustituido con un sustituyente seleccionado del grupo constituido por halógeno, alquilo C₁-C₃ y ciano (como, por ejemplo, ciclopropilo opcionalmente sustituido con ciano o alquilo C₁-C₃), (b) heterociclilo C₂-C₅ opcionalmente sustituido con un sustituyente seleccionado del grupo constituido por halógeno o ciano como, por ejemplo, tietanilo (tiaciclobutanilo) opcionalmente sustituido con ciano o alquilo C₁-C₃, (c) un arilo sustituido con 0, 1 o 2 sustituyentes V o un heteroarilo de 5 o 6 miembros sustituido con 0, 1, 2, 3 o 4 sustituyentes V, en donde V representa, independientemente entre sí, halógeno (por ejemplo, F, Cl), ciano, alquilo C₁-C₆ opcionalmente halogenado, alcoxi C₁-C₆ opcionalmente halogenado (como fenilo opcionalmente sustituido con 0, 1 o 2 sustituyentes V seleccionados, independientemente entre sí, del grupo constituido por halógeno (como F, Cl), alcoxi C₁-C₃ (como metoxi y etoxi), alquilo C₁-C₃ (como metilo), alquilo C₁-C₃ halogenado (como CF₃) y ciano o piridilo, pirimidinilo, tienilo, oxazolilo o tiofenilo opcionalmente sustituido con 0, 1 o 2 sustituyentes V seleccionados, independientemente entre sí, del grupo constituido por halógeno (como F, Cl), alquilo C₁-C₃ (como metilo), alquilo C₁-C₃ halogenado (como CF₃) y ciano).

35

40

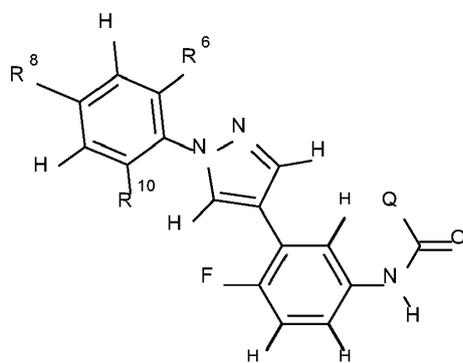
Una forma de realización preferida adicional se refiere a un compuesto como se describe en uno de los párrafos [0006] a [0008], en donde un compuesto de la fórmula (I') es un compuesto de la fórmula (Ia):



(Ia)

donde A_2 , A_3 , R^5 , R^6 , R^8 , R^{10} y Q se definen como se describe en uno de los párrafos [0006] a [0008].

Un aspecto adicional de la presente invención se refiere a un compuesto de la fórmula (Ib)



(Ib)

5 donde

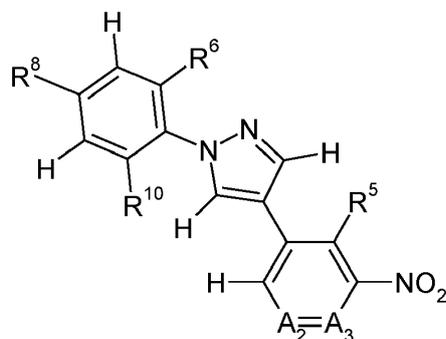
R^6 representa Cl, Br o alquilo C_1-C_3 ,

R^8 representa alquilo C_1-C_6 perfluorado,

R^{10} representa Cl, alquilo C_1-C_3 o alquilo C_1-C_3 perfluorado, y

10 Q representa cicloalquilo C_3-C_6 opcionalmente sustituido con un sustituyente seleccionado del grupo constituido por halógeno, alquilo C_1-C_3 y ciano, heterociclilo C_2-C_5 opcionalmente sustituido con un sustituyente seleccionado del grupo constituido por halógeno o ciano, representa un arilo sustituido con 0, 1 o 2 sustituyentes V o representa un heteroarilo de 5 o 6 miembros sustituido con 0, 1, 2, 3 o 4 sustituyentes V, en donde V representa, independientemente entre sí, halógeno, ciano, representa alquilo C_1-C_6 opcionalmente halogenado, representa alcoxi C_1-C_6 opcionalmente halogenado.

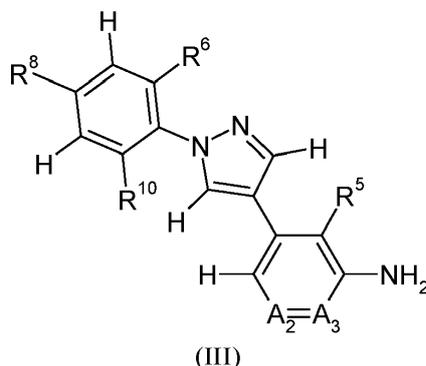
15 Un aspecto adicional se refiere a un compuesto de la fórmula (II)



(II)

donde A_2 , A_3 , R^5 , R^6 , R^8 y R^{10} se definen como se describe en uno de los párrafos [0006] a [0008].

Un aspecto adicional se refiere a un compuesto de la fórmula (III)



donde A_2 , A_3 , R^5 , R^6 , R^8 y R^{10} se definen como se describe en uno de los párrafos [0006] a [0008].

5 Un aspecto adicional se refiere a composiciones farmacéuticas que contienen por lo menos un compuesto como se describe en uno de los párrafos [0006] a [0008].

Un aspecto adicional se refiere a los compuestos que se describen en uno de los párrafos [0006] a [0008] para su uso como fármaco.

Un aspecto adicional se refiere al uso de los compuestos que se describen en uno de los párrafos [0006] a [0008] para la preparación de composiciones farmacéuticas para combatir parásitos en animales.

10 Un aspecto adicional se refiere al uso de los compuestos que se describen en uno de los párrafos [0006] a [0008] para la protección de material de propagación de plantas, preferiblemente para la protección de semillas.

Definiciones

El experto en la técnica es consciente de que las expresiones "un" o "una" como se usan en la presente solicitud pueden significar, dependiendo de la situación "un/una (1)", "un/una (1) o más" o "al menos un/una (1)".

15 La expresión "opcionalmente sustituido" significa, si no se especifican sustituyentes específicos, que el grupo correspondiente puede estar sustituido una vez o varias veces con un sustituyente M^1 , en donde en el caso de sustituciones múltiples los sustituyentes M^1 pueden ser idénticos o diferentes.

Es evidente para el experto que en la presente solicitud los ejemplos mencionados no se deben considerar como limitantes, sino que simplemente describen más detalladamente algunas formas de realización.

20 Las expresiones " (C_n-C_m) " o " C_n-C_m " son intercambiables entre sí y se refieren al número mínimo y máximo de átomos de carbono en un grupo orgánico. Alquilo " (C_1-C_6) " o " C_1-C_6 " se refiere, por ejemplo, a un grupo alquilo con 1, 2, 3, 4, 5 o 6 átomos de carbono. Las expresiones " (C_n) " o " C_n " son igualmente intercambiables y se refieren al número de átomos de carbono en un grupo orgánico. Por ejemplo, las expresiones "cicloalquilo C_3 " o "alquilo (C_3)" se refieren a ciclopropilo.

25 En las definiciones de los símbolos especificadas en las fórmulas anteriores se usaron términos genéricos que en general son representativos de los siguientes sustituyentes:

Según la invención, "alquilo" representa, por sí mismo o como constituyente de un grupo químico, hidrocarburos de cadena lineal o ramificados, preferiblemente con 1 a 6 átomos de carbono, con especial preferencia con 1, 2, 3 o 4 átomos de carbono como, por ejemplo, metilo, etilo, n-propilo, isopropilo, n-butilo, isobutilo, s-butilo, t-butilo. Los alquilos según la invención se pueden sustituir opcionalmente con uno o varios radicales M^1 iguales o distintos.

30

Según la invención, "alqueno" representa, por sí mismo o como constituyente de un grupo químico, hidrocarburos de cadena lineal o ramificados, preferiblemente con 2 a 6 átomos de carbono, con especial preferencia con 2, 3 o 4 átomos de carbono, y al menos un doble enlace como, por ejemplo, vinilo, 2-propeno, 2-butenilo, 3-butenilo, 1-metil-2-propeno, 2-metil-2-propeno, 2-penteno, 3-penteno, 4-penteno, etc. Los alquenos según la invención se pueden sustituir opcionalmente con uno o varios radicales M^1 iguales o distintos.

35

Según la invención, "alquino" representa, por sí mismo o como constituyente de un grupo químico, hidrocarburos de cadena lineal o ramificados, preferiblemente con 2 a 6 átomos de carbono, con especial preferencia con 2, 3 o 4 átomos de carbono, y al menos un triple enlace como, por ejemplo, etino, 2-propino, 2-butino, 3-butino, 1-metil-2-propino, 2-pentino, 3-pentino, 4-pentino, 1-metil-3-butino, etc. Los alquinos según la invención se pueden sustituir opcionalmente con uno o varios radicales M^1 iguales o distintos.

40

Según la invención, "cicloalquilo" representa, por sí mismo o como constituyente de un grupo químico, hidrocarburos

mono-, bi- o tricíclicos, preferiblemente con 3 a 10 carbonos como, por ejemplo, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, biciclo[2.2.1]heptilo, biciclo[2.2.2]octilo o adamantilo, con especial preferencia cicloalquilo con 3, 4, 5, 6 o 7 átomos de carbono como, por ejemplo, ciclopropilo o ciclobutilo. Los cicloalquilos según la invención se pueden sustituir opcionalmente con uno o varios radicales M¹ iguales o distintos.

5 Según la invención, "alquilcicloalquilo" representa alquilcicloalquilos mono-, bi- o tricíclicos, preferiblemente con 4 a 10 o 4 a 7 átomos de carbono, con especial preferencia alquilcicloalquilos con 4, 5 o 7 átomos de carbono como, por ejemplo, etilciclopropilo o 4-metil-ciclohexilo, en donde el alquilcicloalquilo se une a la estructura básica por el cicloalquilo. Los alquilcicloalquilos según la invención se pueden sustituir opcionalmente con uno o varios radicales M¹ iguales o distintos.

10 Según la invención, "cicloalquilalquilo" representa cicloalquilalquilos mono-, bi- o tricíclicos, preferiblemente con 4 a 10 o 4 a 7 átomos de carbono, con especial preferencia cicloalquilalquilos con 4, 5 o 7 átomos de carbono como, entre otros, ciclopropilmetilo o ciclobutilmetilo, en donde el alquilcicloalquilo se une a la estructura básica por el alquilo. Los cicloalquilalquilos según la invención se pueden sustituir opcionalmente con uno o varios radicales M¹ iguales o distintos.

15 Según la invención, "alcoxi" representa O-alquilo de cadena lineal o ramificado, preferiblemente con 1 a 6 átomos de carbono, más preferiblemente grupos alcoxi con 1 a 4 átomos de carbono como, por ejemplo, metoxi, etoxi, n-propoxi, isopropoxi, n-butoxi, isobutoxi, s-butoxi o t-butoxi. Los grupos alcoxi según la invención se pueden sustituir opcionalmente con uno o varios radicales M¹ iguales o distintos.

20 Según la invención, "alquilsulfanilo" representa S-alquilo de cadena lineal o ramificado, preferiblemente con 1 a 6 átomos de carbono, más preferiblemente grupos alquilsulfanilo con 1 a 4 átomos de carbono como, por ejemplo, metiltio, etiltio, n-propiltio, isopropiltio, n-butiltio, isobutiltio, s-butiltio y t-butiltio. Los grupos alquilsulfanilo según la invención se pueden sustituir opcionalmente con uno o varios radicales M¹ iguales o distintos.

25 Según la invención, "alquilsulfinilo" representa alquilsulfinilo de cadena lineal o ramificado, preferiblemente con 1 a 6 átomos de carbono, más preferiblemente grupos alquilsulfinilo con 1 a 4 átomos de carbono como, por ejemplo, metilsulfinilo, etilsulfinilo, n-propilsulfinilo, isopropilsulfinilo, n-butilsulfinilo, isobutilsulfinilo, s-butilsulfinilo y t-butilsulfinilo. Los grupos alquilsulfinilo según la invención se pueden sustituir opcionalmente con uno o varios radicales M¹ iguales o distintos.

30 Según la invención, "alquilsulfonilo" representa preferiblemente alquilsulfonilo de cadena lineal o ramificado, preferiblemente con 1 a 6 átomos de carbono, más preferiblemente grupos alquilsulfonilo con 1 a 4 átomos de carbono como, por ejemplo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, n-propilsulfonilo, isopropilsulfonilo, n-butilsulfonilo, isobutilsulfonilo, s-butilsulfonilo y t-butilsulfonilo. Los grupos alquilsulfonilo según la invención se pueden sustituir opcionalmente con uno o varios radicales M¹ iguales o distintos.

35 Según la invención, "acilo" representa radicales que contienen un grupo X¹-C(=O)-X², en donde X¹ y X² representan, independientemente entre sí, un radical orgánico como se define en la presente solicitud o representan hidrógeno o representan un enlace con la estructura básica de un compuesto de la fórmula (I)., Por "acilo" se entienden especialmente ácidos orgánicos, ésteres, aldehídos, alquilcarbonilo (alquil-C(=O)-) y amidas. En el caso de X¹ y X² se trata preferiblemente respectivamente, independientemente entre sí, de un grupo opcionalmente sustituido con uno o varios radicales M¹ iguales o distintos seleccionados de alquilo, alquilenilo (-C_nH_{2n}-), alcoxi, alcoxileno (-O-C_nH_{2n}-), amino, mono- o di-alquilamino o hidrógeno o un radical X¹ o X² representa un enlace con la estructura
40 básica de un compuesto de la fórmula (I).

Según la invención, "alquilcarbonilo" representa alquil-C(=O)- de cadena lineal o ramificado, preferiblemente con 2 a 7 átomos de carbono (incluyendo los átomos de C del grupo C(=O)-), más preferiblemente alquilcarbonilos con 2 a 5 átomos de carbono (alquil (C₁-C₄)-C(=O)-), como metilcarbonilo, etilcarbonilo, n-propilcarbonilo, isopropilcarbonilo, s-butilcarbonilo y t-butilcarbonilo. Los alquilcarbonilos según la invención se pueden sustituir opcionalmente con uno o
45 varios radicales M¹ iguales o distintos.

Según la invención, "cicloalquilcarbonilo" representa cicloalquilcarbonilo de cadena lineal o ramificado, preferiblemente con 3 a 10 átomos de carbono en la parte de cicloalquilo, más preferiblemente cicloalquilcarbonilo con 3, 5 o 7 átomos de carbono en la parte de cicloalquilo como, por ejemplo, ciclopropilcarbonilo, ciclobutilcarbonilo, ciclopentilcarbonilo, ciclohexilcarbonilo, cicloheptilcarbonilo, ciclooctilcarbonilo, biciclo[2.2.1]heptilo, biciclo[2.2.2]octilcarbonilo y adamantilcarbonilo. Los grupos cicloalquilcarbonilo según la invención se pueden
50 sustituir opcionalmente con uno o varios radicales M¹ iguales o distintos.

Según la invención, "alcoxicarbonilo" representa, por sí mismo o como constituyente de un grupo químico, alcoxicarbonilo de cadena lineal o ramificado, preferiblemente con 1 a 6 átomos de carbono, más preferiblemente con 1, 2, 3 o 4 átomos de carbono en la parte alcoxi como, por ejemplo, metoxicarbonilo, etoxicarbonilo, n-propoxicarbonilo, isopropoxicarbonilo, s-butoxicarbonilo y t-butoxicarbonilo. Los grupos alcoxicarbonilo según la
55 invención se pueden sustituir opcionalmente con uno o varios radicales M¹ iguales o distintos.

Según la invención, "halógeno" representa flúor (F), cloro (Cl), bromo (Br) o yodo (I).

Las expresiones "haloalquilo", "haloalqueno", "haloalquino", "haloalquilcarbonilo", "haloalcoxi", "haloalcoxicarbonilo", "haloalquilsulfanilo", "haloalquilsulfino" o "haloalquilsulfonilo" o "alquilo halogenado", "alqueno halogenado", "alquino halogenado", "alquilcarbonilo halogenado", "alcoxi halogenado", "alcoxicarbonilo halogenado", "alquilsulfanilo halogenado", "alquilsulfino halogenado" o "alquilsulfonilo halogenado", como se usan en el presente documento, se refieren a un grupo alquilo, alqueno, alquino, alquilcarbonilo, alcoxi, alcoxicarbonilo, alquilsulfanilo, alquilsulfino o alquilsulfonilo (respectivamente preferiblemente con uno a 6 átomos de carbono o más, preferiblemente con uno, dos, tres o cuatro átomos de carbono) químicamente sustituido con al menos un halógeno y se incorporan bajo el término grupo "sustituido". Los grupos halógeno pueden estar sustituidos una vez o varias veces con halógeno hasta el máximo número posible de sustituyentes (perhalogenados) (por ejemplo, C(halógeno)₃, C₂(halógeno)₅, C₃(halógeno)₇, C₄(halógeno)₉). En el caso de sustitución múltiple con halógeno, los átomos de halógeno pueden ser iguales o diferentes y pueden estar todos unidos a uno o a varios átomos de carbono. A este respecto, el halógeno representa especialmente flúor, cloro, bromo o yodo, preferiblemente flúor o cloro y con especial preferencia flúor. En una forma de realización preferida, los grupos perhalogenados están máximamente sustituidos con solo un tipo de halógeno, por ejemplo, metilo perfluorado (trifluorometilo; CF₃) o etilo perfluorado (pentafluoroetilo; C₂F₅) o propilo perfluorado (heptafluoropropilo; C₃F₇). El número de sustituyentes de halógeno en un grupo halogenado con C_m átomos (en donde m asciende preferiblemente a 1, 2, 3, 4, 5 o 6) se encuentra entre 1 y 2*m+1 (por ejemplo, 1, 2 o 3 cuando m = 1; 1, 2, 3, 4, 5 cuando m = 2; 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7 cuando m = 3, 1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9 cuando m = 4, etc.). Algunos ejemplos de "alquilo halogenado", "alqueno halogenado", "alquino halogenado", "alquilcarbonilo halogenado", "alcoxi halogenado", "alcoxicarbonilo halogenado", "alquilsulfanilo halogenado", "alquilsulfino halogenado" o "alquilsulfonilo halogenado" son triclorometilo (CCl₃), trifluorometilo (CF₃), clorodifluorometilo (CClF₂), diclorofluorometilo (CCl₂F), 2,2-difluoroetilo (F₂HCCH₂), 2,2,2-trifluoroetilo (F₃CCH₂), pentafluoroetilo (C₂F₅), 2,2-difluoretenilo (CHCF₂), 2-cloroetino (CHCCl), trifluorometoxi -OCF₃, difluorometoxi -OCHF₂, 1,1,2,2-tetrafluoretileno, 2-cloro-1,1,2-trifluoroetilsulfino, triclorometilsulfonilo, etc. Los grupos halógeno según la invención se pueden sustituir opcionalmente, cuando se especifique, con uno o varios radicales M¹ iguales o distintos, sin embargo, al menos un sustituyente de halógeno debe estar presente en la estructura básica. Un ejemplo de un haloalquilo sustituido con M¹ es 2-ciano-2,2-difluoroetilo (C(CN)F₂CH₂).

Un grupo amino (-NH₂) se puede sustituir opcionalmente con uno o varios radicales M¹ iguales o distintos.

Amino sustituido como amino mono- o disustituido significa un radical del grupo de los radicales amino sustituidos que están *N*-sustituidos, por ejemplo, por uno o dos radicales iguales o distintos del grupo alquilo, hidroxilo, amino, alcoxi, acilo y arilo; preferiblemente *N*-mono- y *N,N*-dialquilamino (por ejemplo, metilamino, etilamino, *N,N*-dimetilamino, *N,N*-dietilamino, *N,N*-di-*n*-propilamino, *N,N*-diisopropilamino o *N,N*-dibutilamino), grupos *N*-mono- o *N,N*-dialcoxialquilamino (por ejemplo, *N*-metoximetilamino, *N*-metoxietilamino, *N,N*-Di-(metoximetil)-amino o *N,N*-di-(metoxietil)-amino), *N*-mono- y *N,N*-diarilamino, como anilina opcionalmente sustituida, acilamino, *N,N*-diacilamino, *N*-alquil-*N*-arilamino, *N*-alquil-*N*-acilamino, así como *N*-heterociclos saturados; a este respecto se prefieren radicales alquilo con 1 a 4 átomos de C; arilo es a este respecto preferiblemente fenilo o fenilo opcionalmente sustituido; para acilo son válidos a este respecto la definición mencionada anteriormente, preferiblemente alquil (C₁-C₄)-C(=O)-.

Amino sustituido también incluye compuestos de amonio cuaternario (sales) con cuatro sustituyentes orgánicos en el átomo de nitrógeno.

Según la invención, "hidroxialquilo" representa alcohol de cadena lineal o ramificado, preferiblemente con 1 a 6 átomos de carbono, más preferiblemente con 1, 2, 3 o 4 átomos de carbono como, por ejemplo, metanol, etanol, *n*-propanol, isopropanol, *n*-butanol, isobutanol, *s*-butanol y *t*-butanol. Los grupos hidroxialquilo según la invención se pueden sustituir con uno o varios radicales M¹ iguales o distintos

Según la invención, "alquilaminocarbonilo" representa alquilaminocarbonilo de cadena lineal o ramificado con preferiblemente 1 a 6 átomos de carbono, más preferiblemente 1, 2, 3 o 4 átomos de carbono en la parte alquilo como, por ejemplo, metilaminocarbonilo (-CONHCH₃), etilaminocarbonilo, *n*-propilaminocarbonilo, isopropilaminocarbonilo, *s*-butilaminocarbonilo y *t*-butilaminocarbonilo. Los grupos alquilaminocarbonilo según la invención se pueden sustituir opcionalmente con uno o varios radicales M¹ iguales o distintos.

Según la invención, "*N,N*-dialquilamino-carbonilo" (-C(=O)N(alquilo)₂) representa *N,N*-dialquilaminocarbonilo de cadena lineal o ramificado con preferiblemente 1 a 6 átomos de carbono por alquilo, más preferiblemente 1, 2, 3 o 4 átomos de carbono por alquilo como, por ejemplo, *N,N*-dimetilamino-carbonilo (-C(=O)N(CH₃)₂), *N,N*-dietilamino-carbonilo, *N,N*-di(*n*-propilamino)-carbonilo, *N,N*-di(isopropilamino)-carbonilo y *N,N*-di(*s*-butilamino)-carbonilo. Los grupos *N,N*-dialquilamino-carbonilo según la invención se pueden sustituir opcionalmente con uno o varios radicales M¹ iguales o distintos.

"Carbociclo", a menos que se defina de otro modo en otro sitio, es especialmente un cicloalquilo, cicloalqueno o arilo. Un carbociclo es especialmente un arilo mono- bi- o tricíclico C₆ a C₁₄. Un carbociclo se puede sustituir opcionalmente con uno o varios radicales M¹ iguales o distintos.

Según la invención, "arilo" representa un sistema aromático mono-, bi- o policíclico con preferiblemente 6 a 14, especialmente 6 a 10 átomos de carbono en el anillo como, por ejemplo, fenilo, naftilo, antrilo, fenantrenilo, preferiblemente fenilo. Además, arilo también representa sistemas policíclicos como tetrahidronaftilo, indenilo,

indanilo, fluorenilo, bifenilo, en donde el sitio de unión está en el sistema aromático. Los grupos arilo según la invención se pueden sustituir opcionalmente con uno o varios radicales M^1 iguales o distintos.

Según la invención, "arilalquilo" representa un radical alquilo sustituido con un arilo con preferiblemente 6 a 14, especialmente 6 a 10 átomos de carbono en el anillo en la parte arilo y 1 a 6, especialmente 1 a 4 átomos de carbono en la parte alquilo. Arilalquilo se puede sustituir con uno o varios radicales iguales o distintos en la parte alquilo y/o arilo. Los ejemplos de dichos arilalquilos son, entre otros, bencilo y 1-feniletilo. Los grupos arilalquilo según la invención se pueden sustituir opcionalmente con uno o varios radicales M^1 iguales o distintos.

Según la invención, "heterociclo", "anillo heterocíclico" o "sistema de anillos heterocíclico" representa un sistema de anillos carbocíclico con al menos un anillo, en el que al menos un átomo de carbono está sustituido por un heteroátomo, preferiblemente por un heteroátomo del grupo N, O, S, P, B, Si, Se y que está saturado, insaturado o es heteroaromático y a este respecto sin sustituir o puede estar sustituido con un sustituyente Z, en donde el sitio de unión se localiza en un átomo del anillo. Si no se define de otro modo, el anillo heterocíclico contiene preferiblemente 3 a 9 átomos de anillo, especialmente 3 a 6 átomos de anillo, y uno o varios, preferiblemente 1 a 4, especialmente 1, 2 o 3 heteroátomos en el anillo heterocíclico, preferiblemente del grupo N, O y S, en donde, sin embargo, dos átomos de oxígeno no deben estar directamente adyacentes. Los anillos heterocíclicos no contienen normalmente más de 4 átomos de nitrógeno, y/o no más de 2 átomos de oxígeno y/o no más de 2 átomos de azufre. Si el radical heterociclilo o el anillo heterocíclico se sustituye opcionalmente, se puede condensar con otros anillos carbocíclicos o heterocíclicos. En caso de heterociclilo opcionalmente sustituido, la invención también comprende sistemas policíclicos como, por ejemplo, 8-aza-biciclo[3.2.1]octanilo o 1-aza-biciclo[2.2.1]heptilo. En caso de heterociclilo opcionalmente sustituido, la invención también comprende sistemas espirocíclicos como, por ejemplo, 1-oxa-5-aza-espiro[2.3]hexilo. Los grupos "heterociclo", "anillo heterocíclico" o "sistema de anillos heterocíclico" según la invención se pueden sustituir opcionalmente con uno o varios radicales M^1 iguales o distintos.

Según la invención, los grupos heterociclilo son, por ejemplo, piperidinilo, piperazinilo, morfolinilo, tiomorfolinilo, dihidropiranilo, tetrahidropiranilo, dioxanilo, pirrolinilo, pirrolidinilo, imidazolinilo, imidazolidinilo, tiazolidinilo, oxazolidinilo, dioxolanilo, dioxolilo, pirazolidinilo, tetrahidrofuranilo, dihidrofuranilo, oxetanilo, oxiranilo, azetidino, aziridinilo, oxazetidino, oxaziridinilo, oxazepanilo, oxazinano, azepanilo, oxopirrolidinilo, dioxopirrolidinilo, oxomorfolinilo, oxopiperazinilo y oxepanilo.

Heteroarileno, es decir, sistemas heteroaromáticos, tiene un significado particular. Según la invención, la expresión heteroarilo representa compuestos heteroaromáticos, es decir, compuestos heterocíclicos aromáticos completamente insaturados, que se encuentran en la definición anterior de heterociclos. Preferiblemente anillos de 5 a 7 miembros con 1 a 3, preferiblemente 1 o 2 heteroátomos iguales o distintos del grupo anteriormente mencionado. Según la invención, heteroarilos son, por ejemplo, furilo, tienilo, pirazolilo, imidazolilo, 1,2,3- y 1,2,4-triazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, 1,2,3-, 1,3,4-, 1,2,4- y 1,2,5-oxadiazolilo, azepinilo, pirrolilo, piridilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, 1,3,5-, 1,2,4- y 1,2,3-triazinilo, 1,2,4-, 1,3,2-, 1,3,6- y 1,2,6-oxazinilo, oxepinilo, tiepinilo, 1,2,4-triazolonilo y 1,2,4-diazepinilo. Los grupos heteroarilo según la invención pueden además estar opcionalmente sustituidos con uno o varios radicales M^1 iguales o distintos.

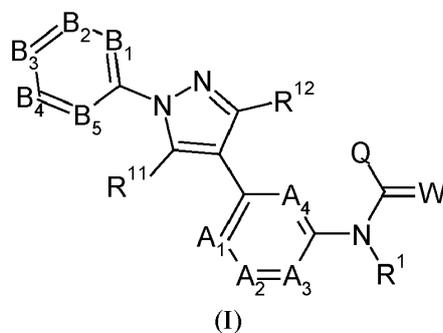
Grupo "sustituido" o grupo "sustituido con al menos un radical M^1 " en el sentido de la presente invención, como un radical alquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilo, arilo, fenilo, bencilo, heterociclilo, heteroarilo o amino opcionalmente sustituido, etc., es, en general, un grupo que contiene al menos una proporción que contiene hidrocarburo o que contiene nitrógeno-hidrógeno, en la que el hidrógeno está sustituido por otro átomo o un grupo de átomos M^1 . El término "grupos sustituidos" también comprende grupos "halogenados" que pueden estar opcionalmente sustituidos con uno o varios M^1 , en tanto que al menos un sustituyente sea un halógeno. Un grupo sustituido deriva de cuerpos básicos sin sustituir, en donde el cuerpo básico está sustituido con uno o varios sustituyentes M^1 , preferiblemente 1, 2 o 3 radicales M^1 , y el/los sustituyentes M^1 se seleccionan respectivamente, independientemente entre sí, del grupo constituido por halógeno, hidroxilo, nitro, formilo, carboxilo, ciano, amino, isociano, azido, alquilo (C_1-C_4), haloalquilo (C_1-C_4), alquenilo (C_2-C_4), alquinilo (C_2-C_4), cicloalquil (C_3-C_6)-alcoxi (C_1-C_4), haloalcoxi (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4)-alcoxi (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4)-alquilo (C_1-C_6), *N*-alcoxi (C_1-C_4)-imino-alquilo (C_1-C_3)-, alquil (C_1-C_4)-sulfanilo, haloalquil (C_1-C_4)-sulfanilo, alcoxi (C_1-C_4)-carbonilo, alquil (C_1-C_4)-carbonilo, carbamoilo, alquil C_1-C_4 -carbamoilo, cicloalquil C_3-C_7 -carbamoilo, mono- y *N,N*-dialquil (C_1-C_4)-aminocarbonilo, amino, acil (C_1-C_6)-amino, mono- y *N,N*-dialquil (C_1-C_4)-amino, trialquil (C_1-C_4)-sililo, cicloalquil (C_3-C_6)-arilo C_6 , heterociclilo con 3 a 6 átomos de anillo, en donde cada uno de los últimos grupos cíclicos mencionados también se puede unir mediante heteroátomos o un grupo CH_2 divalente funcional, o C_2H_4 , alquil (C_1-C_4)-sulfinilo, en donde están comprendidos enantiómeros del grupo alquil (C_1-C_4)-sulfinilo, alquil (C_1-C_4)-sulfonilo, alquil (C_1-C_4)-fosfinilo, (C_1-C_4)-alquil (C_1-C_4)-sulfanil-alquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4)-alquilo (C_1-C_4), mono- y *N,N*-dialquil (C_1-C_4)-aminoalquilo (C_1-C_4) e hidroxialquilo (C_1-C_4). Los radicales M^1 mencionados a modo de ejemplo pueden estar sin sustituir u opcionalmente sustituidos (como, por ejemplo, alquilo o amino), si contienen porciones que contienen hidrocarburo o que contienen nitrógeno-hidrógeno, con uno o varios, preferiblemente 1, 2 o 3 radicales M^2 , en donde M^2 , independientemente entre sí, se selecciona del grupo constituido por amino, hidroxilo, halógeno, nitro, ciano, isociano, mercapto, isotiocianato, carboxilo y carbonamida. Los grupos sustituidos también comprenden grupos sustituidos explícitamente mencionados. "Haloalquilo" está comprendido, por ejemplo, por la expresión alquilo "sustituido" y representa una forma de realización preferida de un alquilo sustituido. Esto también es análogamente válido para todos los otros grupos sustituidos.

Si dos o más radicales forman uno o varios anillos, entonces estos pueden ser carbocíclicos, heterocíclicos, saturados, parcialmente saturados, insaturados, por ejemplo también aromáticos y polisustituídos.

- 5 Fenilo opcionalmente sustituido es preferiblemente fenilo que está sin sustituir o está mono- o polisustituido, preferiblemente mono-, di- o trisustituido, con radicales idénticos o diferentes seleccionados del grupo halógeno, ciano, isociano, nitro, alquilo (C₁-C₄), alqueniilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, alcoxi (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄)-alcoxi (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄)-alquilo (C₁-C₄), cicloalquilo (C₃-C₆), haloalquilo (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄), alquil (C₁-C₄)-sulfanilo, haloalquil (C₁-C₄)-sulfanilo opcionalmente sustituido con al menos un radical M¹, por ejemplo, está sustituido con o-, m- y p-tolilo, dimetilfenilo, 2-, 3- y 4-clorofenilo, 2-, 3- y 4-fluorofenilo, 2-, 3- y 4-trifluorometil- y -triclorometilfenilo, 2,4-, 3,5-, 2,5- y 2,3-diclorofenilo, o-, m- y p-metoxifenilo.
- 10 Cicloalquilo opcionalmente sustituido es preferiblemente cicloalquilo que está sin sustituir o está mono- o polisustituido, preferiblemente hasta trisustituido, con radicales idénticos o diferentes seleccionados del grupo halógeno, haloalquilo, ciano, alquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄)-alcoxi (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄)-alquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄) y haloalcoxi (C₁-C₄).
- 15 Heterociclilo opcionalmente sustituido es preferiblemente heterociclilo que está sin sustituir o está mono- o polisustituido, preferiblemente hasta trisustituido, con radicales idénticos o diferentes del grupo halógeno, ciano, alquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄)-alcoxi (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄)-alquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄), nitro y oxo, especialmente está mono- o polisustituido con radicales del grupo halógeno, alquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄) y oxo, muy especialmente está sustituido con uno o dos radicales alquilo (C₁-C₄).
- 20 Ejemplos de heteroarilos sustituidos con alquilo son furilmetilo, tienilmetilo, pirazolilmetilo, imidazolilmetilo, 1,2,3- y 1,2,4-triazolilmetilo, isoxazolilmetilo, tiazolilmetilo, isotiazolilmetilo, 1,2,3-, 1,3,4-, 1,2,4- y 1,2,5-oxadiazolilmetilo, azepinilmetilo, pirrolilmetilo, piridilmetilo, piridazinilmetilo, pirimidinilmetilo, pirazinilmetilo, 1,3,5-, 1,2,4- y 1,2,3-triazinilmetilo, 1,2,4-, 1,3,2-, 1,3,6- y 1,2,6-oxazinilmetilo, oxepinilmetilo, tiepinilmetilo y 1,2,4-diazepinilmetilo.
- 25 No están comprendidas aquellas combinaciones que contravienen las leyes de la naturaleza y, por tanto, descartaría el experto en la técnica basándose en su conocimiento experto. Por ejemplo, se excluyen estructuras de anillo con tres o varios átomos de O adyacentes.

Descripción detallada

En el presente documento se describen derivados de pirazolilo de la fórmula general (I)



30 donde

R¹ representa hidrógeno, alquilo C₁-C₆ opcionalmente sustituido, alqueniilo C₃-C₆, alquinilo C₃-C₆, cicloalquilo C₃-C₇, alquil C₁-C₆-carbonilo, alcoxi C₁-C₆-carbonilo, arilalquilo (C₁-C₃), heteroarilalquilo (C₁-C₃);

las agrupaciones químicas

- 35 A₁ representa CR² o nitrógeno (N),
 A₂ representa CR³ o N,
 A₃ representa CR⁴ o N,
 A₄ representa CR⁵ o N,
 B₁ representa CR⁶ o N,
 B₂ representa CR⁷ o N,
 40 B₃ representa CR⁸ o N,
 B₄ representa CR⁹ o N, y
 B₅ representa CR¹⁰ o N,

en donde no más de tres de las agrupaciones químicas A₁ a A₄ representan simultáneamente nitrógeno y no más de tres de las agrupaciones B₁ a B₅ representan simultáneamente nitrógeno;

	R ² , R ³ , R ⁴ , R ⁵ , R ⁶ , R ⁷ , R ⁹ y R ¹⁰	representan, independientemente entre sí, hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, alquilo C ₁ -C ₆ opcionalmente sustituido, cicloalquilo C ₃ -C ₇ , alcoxi C ₁ -C ₆ , <i>N</i> -(alcoxi C ₁ -C ₆)-imino-alquilo C ₁ -C ₃ , alquil C ₁ -C ₆ -sulfanilo, alquil C ₁ -C ₆ -sulfinilo, alquil C ₁ -C ₆ -sulfonilo, <i>N</i> -(alquil C ₁ -C ₆)amino o <i>N,N</i> -di-(alquil C ₁ -C ₆)amino, alquil C ₁ -C ₆ -sulfonil-amino, <i>N</i> -(alquil C ₁ -C ₆)-alquil C ₁ -C ₆ -sulfonil-amino;
5	R ⁸	representa halógeno, ciano, nitro, respectivamente alquilo C ₁ -C ₆ opcionalmente sustituido, cicloalquilo C ₃ -C ₆ , alcoxi C ₁ -C ₆ , <i>N</i> -alcoxi C ₁ -C ₆ -imino-alquilo C ₁ -C ₃ , alquil C ₁ -C ₆ -sulfanilo, alquil C ₁ -C ₆ -sulfinilo, alquil C ₁ -C ₆ -sulfonilo, <i>N</i> -alquil C ₁ -C ₆ -amino o <i>N,N</i> -di-alquil C ₁ -C ₆ -amino, representa preferiblemente halógeno, ciano, nitro o haloalquilo C ₁ -C ₆ ;
10	R ¹¹ y R ¹²	representan, independientemente entre sí, hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, amino o un alquilo C ₁ -C ₆ opcionalmente sustituido con halógeno, alquiloxi C ₁ -C ₆ , alquil C ₁ -C ₆ -carbonilo, alquil C ₁ -C ₆ -sulfanilo, alquil C ₁ -C ₆ -sulfinilo, alquil C ₁ -C ₆ -sulfonilo;
15	W	representa oxígeno o azufre;
	Q	representa hidrógeno, amino o las agrupaciones alquilo C ₁ -C ₆ , alqueno C ₂ -C ₆ , alquinilo C ₂ -C ₆ , cicloalquilo C ₃ -C ₆ , heterociclilo C ₂ -C ₅ , alcoxi C ₁ -C ₄ , alquil C ₁ -C ₆ -cicloalquilo C ₃ -C ₆ , cicloalquil C ₃ -C ₆ -alquilo C ₁ -C ₆ , aril-alquilo (C ₁ -C ₃), heteroaril-alquilo (C ₁ -C ₃), alcoxi C ₁ -C ₄ -carbonilo opcionalmente sustituidas de una a siete veces, independientemente entre sí, con halógeno, ciano, alcoxi y alcocicarbonilo o una agrupación <i>N</i> -alquil C ₁ -C ₄ -amino, <i>N</i> -alquil C ₁ -C ₄ -carbonilamino, <i>N,N</i> -di-alquil C ₁ -C ₄ -amino, alquil C ₁ -C ₄ -sulfonilamino; o
20	Q	representa un arilo sustituido con 0, 1, 2, 3 o 4 sustituyentes V o representa un heteroarilo de 5 o 6 miembros sustituido con 0, 1, 2, 3 o 4 sustituyentes V, en donde
25	V	representa, independientemente entre sí, halógeno, ciano, nitro, o representa alquilo C ₁ -C ₆ , alqueno C ₂ -C ₄ , alquinilo C ₂ -C ₄ , cicloalquilo C ₃ -C ₆ , alcoxi C ₁ -C ₆ , <i>N</i> -alcoxi C ₁ -C ₆ -imino-alquilo C ₁ -C ₃ , alquil C ₁ -C ₆ -sulfanilo, alquil C ₁ -C ₆ -sulfinilo, alquil C ₁ -C ₆ -sulfonilo, <i>N,N</i> -di-(alquil C ₁ -C ₆)amino opcionalmente sustituido de una a siete veces, independientemente entre sí, con halógeno, ciano, alcoxi y alcocicarbonilo;
30		

así como sales, N-óxidos y formas tautómeras de los compuestos de la fórmula (I).

B

35 Se describen además compuestos de la fórmula (I), en la que B₁ representa CR⁶, B₂ representa CR⁷, B₃ representa CR⁸, B₄ representa CR⁹ y B₅ representa CR¹⁰.

Se describen además compuestos de la fórmula (I), en la que B₁ representa CR⁶, B₂ representa CR⁷, B₃ representa CR⁸, B₄ representa CR⁹ y B₅ representa CR¹⁰ y R⁸ representa halógeno o alquilo C₁-C₆ halogenado, preferiblemente alquilo C₁-C₆ halogenado, más preferiblemente alquilo C₁-C₆ perhalogenado, todavía más preferiblemente alquilo C₁-C₆ perfluorado como CF₃, C₂F₅, C₃F₇, C₄F₉.

40 Se describen además compuestos de la fórmula (I), en la que B₁ representa CR⁶, B₂ representa CR⁷, B₃ representa CR⁸, B₄ representa CR⁹ y B₅ representa CR¹⁰ y R⁷ y R⁹ representan, independientemente entre sí, hidrógeno o alquilo C₁-C₆ opcionalmente sustituido, preferiblemente representa hidrógeno.

45 Se describen además compuestos de la fórmula (I), en la que B₁ representa CR⁶, B₂ representa CR⁷, B₃ representa CR⁸, B₄ representa CR⁹ y B₅ representa CR¹⁰ y R⁶ y R¹⁰ representan, independientemente entre sí, hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo C₁-C₆ opcionalmente sustituido, opcionalmente representa alcoxi C₁-C₆ sustituido, más preferiblemente halógeno o alquilo C₁-C₆ opcionalmente halogenado o alcoxi C₁-C₆ opcionalmente halogenado, todavía más preferiblemente F, Cl, I, Br, alquilo C₁-C₃ o peralquilo C₁-C₃ halogenado, con especial preferencia Cl, Br, alquilo C₁-C₃ como CH₃, o alquilo C₁-C₃ perfluorado como CF₃, o alcoxi C₁-C₃ como -O-CH₃, o alcoxi C₁-C₃ perfluorado como -O-CF₃. Una forma de realización todavía más preferible se refiere a compuestos de la fórmula (I), en la que B₁ representa CR⁶, B₂ representa CR⁷, B₃ representa CR⁸, B₄ representa CR⁹ y B₅ representa CR¹⁰ y R⁶ y R¹⁰ representan, independientemente entre sí, hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo C₁-C₆ opcionalmente sustituido, más preferiblemente halógeno o alquilo C₁-C₆ opcionalmente halogenado, todavía más preferiblemente F, Cl, I, Br, alquilo C₁-C₃ o peralquilo C₁-C₃ halogenado, con especial preferencia Cl, Br, alquilo C₁-C₃ como CH₃ o alquilo C₁-C₃ perfluorado como CF₃.

55 Se describen además compuestos de la fórmula (I), en la que B₁ representa CR⁶, B₂ representa CR⁷, B₃ representa CR⁸, B₄ representa CR⁹ y B₅ representa CR¹⁰ y R⁶, R⁷, R⁸, R⁹ y R¹⁰ son como se definen en los párrafos [0057] a [0061], preferiblemente donde R⁸ representa alquilo C₁-C₆ perfluorado como CF₃, C₂F₅, C₃F₇, C₄F₉, R⁷ y R⁹ representan respectivamente hidrógeno, R⁶ y R¹⁰ representan, independientemente entre sí, Cl, Br, alquilo C₁-C₃ como CH₃ o alquilo C₁-C₃ perfluorado como CF₃ o alcoxi C₁-C₃ como -O-CH₃, o alcoxi C₁-C₃ perfluorado como -O-CF₃.

60

Se describen además compuestos de la fórmula (I), en la que B₁ representa CR⁶, B₂ representa CR⁷, B₃ representa CR⁸, B₄ representa CR⁹ y B₅ representa CR¹⁰ y R⁶, R⁷, R⁸, R⁹ y R¹⁰ son como se definen en los párrafos [0057] a [0062], preferiblemente donde R⁸ representa alquilo C₁-C₆ perfluorado como CF₃, C₂F₅, C₃F₇, C₄F₉, R⁷ y R⁹ representan respectivamente hidrógeno, R⁶ representa Cl, Br, alquilo C₁-C₃ como CH₃ y R¹⁰ representa Cl, alquilo C₁-C₃ como CH₃ o alquilo C₁-C₃ perfluorado como CF₃.

R¹¹ R¹²

Se describen además compuestos de la fórmula (I), en la que R¹¹ y R¹² representan, independientemente entre sí, hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, amino o un alquilo C₁-C₆ opcionalmente sustituido con halógeno, más preferiblemente representa hidrógeno, halógeno o un alquilo C₁-C₆ opcionalmente sustituido con halógeno, todavía más preferiblemente representa hidrógeno o alquilo C₁-C₃, con especial preferencia representa hidrógeno.

Se describen además compuestos de la fórmula (I), en la que B₁ representa CR⁶, B₂ representa CR⁷, B₃ representa CR⁸, B₄ representa CR⁹ y B₅ representa CR¹⁰ y R⁶, R⁷, R⁸, R⁹ y R¹⁰ son como se definen en los párrafos [0057] a [0063], y R¹¹ y R¹² son como se definen en el párrafo [0064].

Se describen además compuestos de la fórmula (I), en la que B₁ representa CR⁶, B₂ representa CR⁷, B₃ representa CR⁸, B₄ representa CR⁹ y B₅ representa CR¹⁰ y R⁶, R⁷, R⁸, R⁹ y R¹⁰ son como se definen en los párrafos [0057] a [0063], y R¹¹ y R¹² representan respectivamente hidrógeno.

W

Se describen además compuestos de la fórmula (I), en la que W representa oxígeno.

Se describen además compuestos de la fórmula (I), en la que W representa oxígeno, en la que B₁ representa CR⁶, B₂ representa CR⁷, B₃ representa CR⁸, B₄ representa CR⁹ y B₅ representa CR¹⁰ y R⁶, R⁷, R⁸, R⁹ y R¹⁰ son como se definen en los párrafos [0057] a [0063], y R¹¹ y R¹² son como se definen en el párrafo [0064] o más preferiblemente como se definen en el párrafo [0065].

A

Se describen además compuestos de la fórmula (I), en la que A₁ representa CR², A₂ representa CR³ o N, A₃ representa CR⁴ o N y A₄ representa CR⁵.

Se describen además compuestos de la fórmula (I), en la que A₁ representa CR², A₂ representa CR³ o N, A₃ representa CR⁴ o N y A₄ representa CR⁵ y R² representa hidrógeno, o alquilo C₁-C₆ opcionalmente sustituido, preferiblemente representa hidrógeno o alquilo C₁-C₆, con especial preferencia representa hidrógeno.

Se describen además compuestos de la fórmula (I), en la que A₁ representa CR², A₂ representa CR³ o N, A₃ representa CR⁴ o N y A₄ representa CR⁵ y R² representa hidrógeno, o alquilo C₁-C₆ opcionalmente sustituido, preferiblemente representa hidrógeno o alquilo C₁-C₆, con especial preferencia representa hidrógeno y R³, R⁴ y R⁵ representan, independientemente entre sí, hidrógeno, halógeno, CN, alquilo C₁-C₆ opcionalmente sustituido, alcoxi C₁-C₆ opcionalmente sustituido o *N,N*-di-alquil C₁-C₆-amino opcionalmente sustituido, más preferiblemente representa hidrógeno, halógeno como Cl o F, alquilo C₁-C₆ como alquilo C₁-C₃ (por ejemplo, CH₃), alquilo C₁-C₆ halogenado como alquilo C₁-C₃ halogenado (por ejemplo, -CF₃) o *N,N*-di-alquil C₁-C₆-amino como *N,N*-di-alquilo C₁-C₃-amino (por ejemplo, *N,N*-di-metilamino).

Se describen además compuestos de la fórmula (I), en la que W representa oxígeno, en la que B₁ representa CR⁶, B₂ representa CR⁷, B₃ representa CR⁸, B₄ representa CR⁹ y B₅ representa CR¹⁰ y R⁶, R⁷, R⁸, R⁹ y R¹⁰ son como se definen en los párrafos [0057] a [0063], preferiblemente como en el párrafo [0063], y R¹¹ y R¹² son como se definen en el párrafo [0064], o más preferiblemente como en el párrafo [0065], A₁ representa CR², A₂ representa CR³ o N, A₃ representa CR⁴ o N y A₄ representa CR⁵, en donde R², R³, R⁴ y R⁵ son como se definen en los párrafos [0070] o [0071], preferiblemente como en el párrafo [0071].

Q

Se describen además compuestos de la fórmula (I), en la que Q representa hidrógeno, alquilo C₁-C₆ opcionalmente sustituido, cicloalquilo C₃-C₆ opcionalmente sustituido, heterocicliilo C₂-C₅ opcionalmente sustituido, alquil C₁-C₆-cicloalquilo C₃-C₆ opcionalmente sustituido, aril-alquilo (C₁-C₃) opcionalmente sustituido, heteroaril-alquilo (C₁-C₃) opcionalmente sustituido, un arilo sustituido con 0, 1, 2, 3 o 4 sustituyentes V o un heteroarilo de 5 o 6 miembros sustituido con 0, 1, 2, 3 o 4 sustituyentes V.

Se describen además compuestos de la fórmula (I), en la que Q representa hidrógeno, alquilo C₁-C₆ opcionalmente sustituido con uno, dos o tres sustituyentes seleccionados del grupo constituido por oxo, ciano, nitro, amino, representa alquilo C₁-C₆ halogenado, cicloalquilo C₃-C₆ opcionalmente sustituido con uno, dos o tres sustituyentes seleccionados del grupo constituido por halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₃ y amino, heterocicliilo C₂-C₅ opcionalmente sustituido con uno, dos o tres sustituyentes seleccionados del grupo constituido por halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₃ y amino, aril-alquilo (C₁-C₃) opcionalmente sustituido con uno, dos o tres sustituyentes

seleccionados del grupo constituido por halógeno, ciano, nitro, amino, heteroaril-alquilo (C₁-C₃) opcionalmente sustituido con uno, dos o tres sustituyentes seleccionados del grupo constituido por halógeno, ciano, nitro, amino, representa un arilo sustituido con 0, 1, 2, 3 o 4 sustituyentes V o representa un heteroarilo de 5 o 6 miembros sustituido con 0, 1, 2, 3 o 4 sustituyentes V, en donde V representa, independientemente entre sí, halógeno, ciano, 5
alquilo C₁-C₆ opcionalmente sustituido de una a tres veces, independientemente entre sí, con ciano, alcoxi y alcoxicarbonilo, representa alquilo C₁-C₆ halogenado, representa alcoxi C₁-C₆ opcionalmente sustituido de una a tres veces, independientemente entre sí, con ciano, alcoxi y alcoxicarbonilo, representa alcoxi C₁-C₆ halogenado.

Se describen además compuestos de la fórmula (I), en la que Q representa alquilo C₁-C₆ opcionalmente sustituido con uno, dos o tres sustituyentes seleccionados del grupo constituido por oxo, ciano, nitro, amino, representa alquilo 10
C₁-C₆ halogenado, cicloalquilo C₃-C₆ opcionalmente sustituido con uno, dos o tres sustituyentes seleccionados del grupo constituido por halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₃ y amino, heterociclilo C₂-C₅ opcionalmente sustituido con uno, dos o tres sustituyentes seleccionados del grupo constituido por halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₃ y amino, representa un arilo sustituido con 0, 1, 2, 3 o 4 sustituyentes V o representa un heteroarilo de 5 o 6 miembros sustituido con 0, 1, 2, 3 o 4 sustituyentes V, en donde V representa, independientemente entre sí, halógeno, ciano, 15
representa alquilo C₁-C₆, representa alquilo C₁-C₆ halogenado, representa alcoxi C₁-C₆, representa alcoxi C₁-C₆ halogenado.

Se describen además compuestos de la fórmula (I), en la que Q representa cicloalquilo C₃-C₆ opcionalmente sustituido con uno, dos o tres sustituyentes seleccionados del grupo constituido por halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁- 20
C₃ y amino, heterociclilo C₂-C₅ opcionalmente sustituido con uno, dos o tres sustituyentes seleccionados del grupo constituido por halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₃ y amino, representa un arilo sustituido con 0, 1, 2, 3 o 4 sustituyentes V o representa un heteroarilo de 5 o 6 miembros sustituido con 0, 1, 2, 3 o 4 sustituyentes V, en donde V representa, independientemente entre sí, halógeno, ciano, representa alquilo C₁-C₆, representa alquilo C₁-C₆ halogenado, representa alcoxi C₁-C₆, representa alcoxi C₁-C₆ halogenado.

Se describen además compuestos de la fórmula (I), en la que Q representa cicloalquilo C₃-C₆ opcionalmente sustituido con un sustituyente seleccionado del grupo constituido por halógeno, alquilo C₁-C₃ y ciano (como, por 25
ejemplo, ciclopropilo opcionalmente sustituido con ciano o alquilo C₁-C₃), heterociclilo C₂-C₅ opcionalmente sustituido con un sustituyente seleccionado del grupo constituido por halógeno o ciano como, por ejemplo, tietanilo (tiaclobutanilo) opcionalmente sustituido con ciano o alquilo C₁-C₃, un arilo sustituido con 0, 1 o 2 sustituyentes V o un heteroarilo de 5 o 6 miembros sustituido con 0, 1, 2, 3 o 4 sustituyentes V, en donde V representa, independientemente entre sí, halógeno (por ejemplo, F, Cl), ciano, representa alquilo C₁-C₆, representa alcoxi C₁-C₆ 30
(como fenilo opcionalmente sustituido con 0, 1 o 2 sustituyentes V seleccionados, independientemente entre sí, del grupo constituido por halógeno (como F, Cl), alcoxi C₁-C₃ (como metoxi y etoxi), alquilo C₁-C₃ (como metilo), alquilo C₁-C₃ halogenado (como CF₃) y ciano, o piridilo, pirimidinilo y tiofenilo opcionalmente sustituido con 0, 1 o 2 sustituyentes V seleccionados, independientemente entre sí, del grupo constituido por halógeno (como F, Cl), alquilo 35
C₁-C₃ (como metilo), alquilo C₁-C₃ halogenado (como CF₃) y ciano), o piridilo, pirimidinilo, tienilo, oxazolilo o tiofenilo opcionalmente sustituido con 0, 1 o 2 sustituyentes V seleccionados, independientemente entre sí, del grupo constituido por halógeno (como F, Cl), alquilo C₁-C₃ (como metilo), alquilo C₁-C₃ halogenado (como CF₃) y ciano.

Se describen además compuestos de la fórmula (I), en la que W representa oxígeno, en la que B₁ representa CR⁶, B₂ representa CR⁷, B₃ representa CR⁸, B₄ representa CR⁹ y B₅ representa CR¹⁰ y R⁶, R⁷, R⁸, R⁹ y R¹⁰ son como se 40
definen en los párrafos [0057] a [0063], y R¹¹ y R¹² son como se definen en el párrafo [0064] o más preferiblemente como se definen en el párrafo [0065], A₁ representa CR², A₂ representa CR³ o N, A₃ representa CR⁴ o N y A₄ representa CR⁵ en donde R², R³, R⁴ y R⁵ son como se definen en los párrafos [0070] o [0071] y Q es como se define en los párrafos [0073] a [0077].

Se describen además compuestos de la fórmula (I), en la que W representa oxígeno, en la que B₁ representa CR⁶, B₂ representa CR⁷, B₃ representa CR⁸, B₄ representa CR⁹ y B₅ representa CR¹⁰ y R⁶, R⁷, R⁸, R⁹ y R¹⁰ son como se 45
definen en el párrafo [0063], y R¹¹ y R¹² como se definen en el párrafo [0065], A₁ representa CR², A₂ representa CR³ o N, A₃ representa CR⁴ o N y A₄ representa CR⁵ en donde R², R³, R⁴ y R⁵ son como se definen en el párrafo [0077] y Q es como se define en el párrafo [0077].

R¹

Se describen además compuestos de la fórmula (I), en la que R¹ representa hidrógeno, alquilo C₁-C₃ o cicloalquilo 50
C₃-C₆.

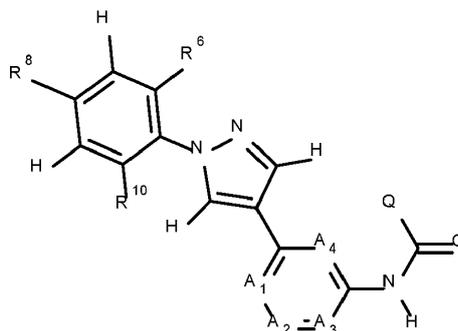
Se describen además compuestos de la fórmula (I), en la que R¹ representa hidrógeno.

Se describen además compuestos de la fórmula (I), en la que W representa oxígeno, en la que B₁ representa CR⁶, B₂ representa CR⁷, B₃ representa CR⁸, B₄ representa CR⁹ y B₅ representa CR¹⁰ y R⁶, R⁷, R⁸, R⁹ y R¹⁰ son como se 55
definen en los párrafos [0057] a [0063], y R¹¹ y R¹² son como se definen en el párrafo [0064] o más preferiblemente como se definen en el párrafo [0065], A₁ representa CR², A₂ representa CR³ o N, A₃ representa CR⁴ o N y A₄ representa CR⁵, en donde R², R³, R⁴ y R⁵ son como se definen en los párrafos [0070] o [0071] y Q es como se define en los párrafos [0073] a [0077] y R¹ representa hidrógeno, alquilo C₁-C₃ o cicloalquilo C₃-C₆.

5 Se describen además compuestos de la fórmula (I), en la que W representa oxígeno, en la que B₁ representa CR⁶, B₂ representa CR⁷, B₃ representa CR⁸, B₄ representa CR⁹ y B₅ representa CR¹⁰ y R⁶, R⁷, R⁸, R⁹ y R¹⁰ son como se definen en los párrafos [0057] a [0063], y R¹¹ y R¹² son como se definen en el párrafo [0063] o más preferiblemente como se define en el párrafo [0065], A₁ representa CR², A₂ representa CR³ o N, A₃ representa CR⁴ o N y A₄ representa CR⁵, en donde R², R³, R⁴ y R⁵ son como se definen en los párrafos [0070] o [0071] y Q como se define en los párrafos [0073] a [0077] y R¹ representa hidrógeno.

10 Se describen además compuestos de la fórmula (I), en la que W representa oxígeno, en la que B₁ representa CR⁶, B₂ representa CR⁷, B₃ representa CR⁸, B₄ representa CR⁹ y B₅ representa CR¹⁰ y R⁶, R⁷, R⁸, R⁹ y R¹⁰ son como se definen en el párrafo [0063], y R¹¹ y R¹² son como se definen en el párrafo [0065], A₁ representa CR², A₂ representa CR³ o N, A₃ representa CR⁴ o N y A₄ representa CR⁵, en donde R², R³, R⁴ y R⁵ son como se definen en el párrafo [0071] y Q es como se define en el párrafo [0077] y R¹ representa hidrógeno.

Se describen además compuestos de la fórmula (I')



(I')

donde A₁, A₂, A₃, A₄, R⁶, R⁸, R¹⁰ y Q se definen como se describe en la presente solicitud, preferiblemente donde

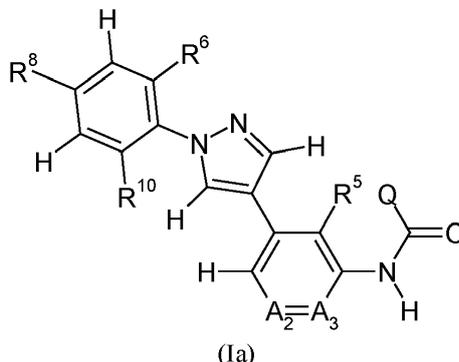
- 15 A₁ representa CR²,
 A₂ representa CR³ o N,
 A₃ representa CR⁴ o N,
 A₄ representa CR⁵
 R² representa hidrógeno,
 20 R³ representa hidrógeno o alquilo C₁-C₃, con especial preferencia representa hidrógeno,
 R⁴ representa hidrógeno, halógeno, CN o alquilo C₁-C₆ opcionalmente sustituido o -N(alquilo C₁-C₃)₂, con especial preferencia representa hidrógeno, Cl, F, o alquilo C₁-C₃ (como CH₃) o -N(alquilo C₁-C₃)₂ (como -N(CH₃)₂),
 R⁵ representa hidrógeno o halógeno, con especial preferencia representa hidrógeno o F,
 25 R⁶ representa hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo C₁-C₆ opcionalmente sustituido, más preferiblemente representa halógeno o alquilo C₁-C₆ opcionalmente halogenado, todavía más preferiblemente representa F, Cl, I, Br, alquilo C₁-C₃ (como metilo) o alquilo C₁-C₃ perhalogenado, con especial preferencia representa Cl, Br o alquilo C₁-C₃ (como CH₃),
 R⁸ representa halógeno o haloalquilo C₁-C₆, preferiblemente representa haloalquilo C₁-C₆, más preferiblemente
 30 representa alquilo C₁-C₆ perhalogenado, todavía más preferiblemente representa alquilo C₁-C₆ perfluorado como alquilo C₁-C₄ perfluorado: CF₃, C₂F₅, C₃F₇, C₄F₉,
 R¹⁰ representa hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo C₁-C₆ opcionalmente sustituido, más preferiblemente
 representa halógeno o alquilo C₁-C₆ opcionalmente halogenado o alcoxi C₁-C₆ opcionalmente halogenado
 (como OCF₃ o OCHF₂), todavía más preferiblemente representa F, Cl, Br, alquilo C₁-C₃ (como metilo, etilo)
 35 o alquilo C₁-C₃ perhalogenado, con especial preferencia representa Cl, alquilo C₁-C₃ (como metilo, etilo) o alquilo C₁-C₃ perfluorado (como CF₃), y
 Q
 representa cicloalquilo C₃-C₆ opcionalmente sustituido con un sustituyente seleccionado del grupo
 constituido por halógeno, alquilo C₁-C₃ y ciano (como, por ejemplo, ciclopropilo opcionalmente sustituido
 con ciano o alquilo C₁-C₃), heterociclilo C₂-C₅ opcionalmente sustituido con un sustituyente seleccionado del
 grupo constituido por halógeno o ciano como, por ejemplo, tietanilo (tiaclobutanilo) opcionalmente
 40 sustituido con ciano o alquilo C₁-C₃, un arilo sustituido con 0, 1 o 2 sustituyentes V o un heteroarilo de 5 o 6
 miembros sustituido con 0, 1, 2, 3 o 4 sustituyentes V, en donde V representa, independientemente entre sí,
 halógeno (por ejemplo, F, Cl), ciano, alquilo C₁-C₆ opcionalmente halogenado, alcoxi C₁-C₆ opcionalmente
 halogenado (como fenilo opcionalmente sustituido con 0, 1 o 2 sustituyentes V seleccionados,
 independientemente entre sí, del grupo constituido por halógeno (como F, Cl), alcoxi C₁-C₃ (como metoxi y
 45 etoxi), alquilo C₁-C₃ (como metilo), alquilo C₁-C₃ halogenado (como CF₃) y ciano, o piridilo, pirimidinilo o
 tiofenilo opcionalmente sustituido con 0, 1 o 2 sustituyentes V seleccionados, independientemente entre sí,
 del grupo constituido por halógeno (como F, Cl), alquilo C₁-C₃ (como metilo), alquilo C₁-C₃ halogenado
 (como CF₃) y ciano, o piridilo, pirimidinilo, tienilo, oxazolilo o tiofenilo opcionalmente sustituido con 0, 1 o 2

sustituyentes V seleccionados, independientemente entre sí, del grupo constituido por halógeno (como F, Cl), alquilo C₁-C₃ (como metilo), alquilo C₁-C₃ halogenado (como CF₃) y ciano.

Se describen además compuestos de la fórmula (I') donde

- 5 A₁ representa CR², en donde R² representa hidrógeno,
 A₂ representa CR³ o N, en donde R³ representa hidrógeno,
 A₃ representa CR⁴ o N, en donde R⁴ representa hidrógeno, Cl, F, o alquilo C₁-C₃ (como CH₃) o -N(alquilo C₁-C₃)₂ (como -N(CH₃)₂),
 A₄ representa CR⁵ en donde R⁵ representa hidrógeno o F,
 R⁶ representa Cl, Br o alquilo C₁-C₃ (como CH₃),
 10 R⁸ representa alquilo C₁-C₆ perhalogenado, todavía más preferiblemente representa alquilo C₁-C₄ perfluorado como CF₃, C₂F₅, C₃F₇, C₄F₉,
 R¹⁰ representa Cl, alquilo C₁-C₃ (como metilo) o alquilo C₁-C₃ perfluorado (como CF₃), y
 Q representa (a) cicloalquilo C₃-C₆ opcionalmente sustituido con un sustituyente seleccionado del grupo constituido por halógeno, alquilo C₁-C₃ y ciano (como, por ejemplo, ciclopropilo opcionalmente sustituido con ciano o alquilo C₁-C₃), (b) heterociclilo C₂-C₅ opcionalmente sustituido con un sustituyente seleccionado del grupo constituido por halógeno o ciano como, por ejemplo, tietanilo (tiaciclobutanilo) opcionalmente sustituido con ciano o alquilo C₁-C₃, (c) un arilo sustituido con 0, 1 o 2 sustituyentes V o un heteroarilo de 5 o 6 miembros sustituido con 0, 1, 2, 3 o 4 sustituyentes V, en donde V representa, independientemente entre sí, halógeno (por ejemplo, F, Cl), ciano, alquilo C₁-C₆ opcionalmente halogenado, alcoxi C₁-C₆ opcionalmente halogenado (como fenilo opcionalmente sustituido con 0, 1 o 2 sustituyentes V seleccionados, independientemente entre sí, del grupo constituido por halógeno (como F, Cl), alcoxi C₁-C₃ (como metoxi y etoxi), alquilo C₁-C₃ (como metilo), alquilo C₁-C₃ halogenado (como CF₃) y ciano o piridilo, pirimidinilo, tienilo, oxazolilo o tiofenilo opcionalmente sustituido con 0, 1 o 2 sustituyentes V seleccionados, independientemente entre sí, del grupo constituido por halógeno (como F, Cl), alquilo C₁-C₃ (como metilo), alquilo C₁-C₃ halogenado (como CF₃) y ciano).

Se describen además compuestos de la fórmula (Ia)

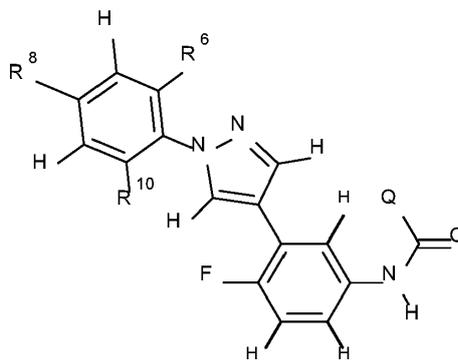


donde A₂, A₃, R⁵, R⁶, R⁸, R¹⁰ y Q se definen como se describe en la presente solicitud, preferiblemente donde

- 30 A₂ representa CR³ o N,
 A₃ representa CR⁴ o N,
 R³ representa hidrógeno o alquilo C₁-C₃, con especial preferencia representa hidrógeno,
 R⁴ representa hidrógeno, halógeno, CN o alquilo C₁-C₆ opcionalmente sustituido, con especial preferencia representa hidrógeno, Cl, F, o alquilo C₁-C₃, o
 35 R⁴ representa hidrógeno, halógeno, CN, alquilo C₁-C₆ opcionalmente sustituido o -N(alquilo C₁-C₃)₂, con especial preferencia representa hidrógeno, Cl, F, alquilo C₁-C₃ (como CH₃), o -N(alquilo C₁-C₃)₂ (como -N(CH₃)₂),
 R⁵ representa hidrógeno o halógeno, con especial preferencia representa hidrógeno o F,
 R⁶ representa hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo C₁-C₆ opcionalmente sustituido, más preferiblemente representa halógeno o alquilo C₁-C₆ opcionalmente halogenado, todavía más preferiblemente representa F, Cl, I, Br, alquilo C₁-C₃ (como metilo) o alquilo C₁-C₃ perhalogenado, con especial preferencia representa Cl, Br o alquilo C₁-C₃ (como CH₃),
 R⁸ representa halógeno o haloalquilo C₁-C₆, preferiblemente representa haloalquilo C₁-C₆, más preferiblemente representa alquilo C₁-C₆ perhalogenado, todavía más preferiblemente representa alquilo C₁-C₆ perfluorado como CF₃, C₂F₅, C₃F₇, C₄F₉,
 45 R¹⁰ representa hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo C₁-C₆ opcionalmente sustituido, más preferiblemente representa halógeno o alquilo C₁-C₆ opcionalmente halogenado o alcoxi C₁-C₆ opcionalmente halogenado (como OCF₃ o OCHF₂), todavía más preferiblemente representa F, Cl, Br, alquilo C₁-C₃ (como metilo, etilo) o alquilo C₁-C₃ perhalogenado, con especial preferencia representa Cl, alquilo C₁-C₃ (como metilo, etilo) o alquilo C₁-C₃ perfluorado (como CF₃), y

Q representa cicloalquilo C₃-C₆ opcionalmente sustituido con un sustituyente seleccionado del grupo constituido por halógeno, alquilo C₁-C₃ y ciano (como, por ejemplo, ciclopropilo opcionalmente sustituido con ciano o alquilo C₁-C₃), heterociclilo C₂-C₅ opcionalmente sustituido con un sustituyente seleccionado del grupo constituido por halógeno o ciano como, por ejemplo, tetanilo (tiaciclobutanilo) opcionalmente sustituido con ciano o alquilo C₁-C₃, un arilo sustituido con 0, 1 o 2 sustituyentes V o un heteroarilo de 5 o 6 miembros sustituido con 0, 1, 2, 3 o 4 sustituyentes V, en donde V representa, independientemente entre sí, halógeno (por ejemplo, F, Cl), ciano, alquilo C₁-C₆ opcionalmente halogenado, alcoxi C₁-C₆ opcionalmente halogenado (como fenilo opcionalmente sustituido con 0, 1 o 2 sustituyentes V seleccionados, independientemente entre sí, del grupo constituido por halógeno (como F, Cl), alcoxi C₁-C₃ (como metoxi y etoxi), alquilo C₁-C₃ (como metilo), alquilo C₁-C₃ halogenado (como CF₃) y ciano o piridilo, pirimidinilo y tiofenilo opcionalmente sustituido con 0, 1 o 2 sustituyentes V seleccionados, independientemente entre sí, del grupo constituido por halógeno (como F, Cl), alquilo C₁-C₃ (como metilo), alquilo C₁-C₃ halogenado (como CF₃) y ciano).

Se describen además compuestos de la fórmula (Ib)



(Ib)

donde R⁶, R⁸, R¹⁰ y Q se definen como se describe en la presente solicitud, preferiblemente donde

R⁶ representa hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo C₁-C₆ opcionalmente sustituido, más preferiblemente representa halógeno o alquilo C₁-C₆ opcionalmente halogenado, todavía más preferiblemente representa F, Cl, I, Br, alquilo C₁-C₃ (como metilo) o alquilo C₁-C₃ perhalogenado, con especial preferencia representa Cl, Br o alquilo C₁-C₃ (como CH₃), de manera muy especialmente preferida representa CH₃ o Br,

R⁸ representa halógeno o haloalquilo C₁-C₆, preferiblemente representa haloalquilo C₁-C₆, más preferiblemente representa alquilo C₁-C₆ perhalogenado, todavía más preferiblemente representa alquilo C₁-C₆ perfluorado como CF₃, C₂F₅, C₃F₇, C₄F₉, de manera muy especialmente preferida representa C₃F₇,

R¹⁰ representa hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo C₁-C₆ opcionalmente sustituido, más preferiblemente representa halógeno o alquilo C₁-C₆ opcionalmente halogenado o alcoxi C₁-C₆ opcionalmente halogenado (como OCF₃ o OCHF₂), todavía más preferiblemente representa F, Cl, Br, alquilo C₁-C₃ (como metilo, etilo) o alquilo C₁-C₃ perhalogenado, con especial preferencia representa Cl, alquilo C₁-C₃ (como metilo, etilo) o alquilo C₁-C₃ perfluorado (como CF₃), de manera muy especialmente preferida representa CF₃, y

Q representa cicloalquilo C₃-C₆ opcionalmente sustituido con un sustituyente seleccionado del grupo constituido por halógeno, alquilo C₁-C₃ y ciano (como, por ejemplo, ciclopropilo opcionalmente sustituido con ciano o alquilo C₁-C₃), heterociclilo C₂-C₅ opcionalmente sustituido con un sustituyente seleccionado del grupo constituido por halógeno o ciano como, por ejemplo, tetanilo (tiaciclobutanilo) opcionalmente sustituido con ciano o alquilo C₁-C₃, un arilo sustituido con 0, 1 o 2 sustituyentes V o un heteroarilo de 5 o 6 miembros sustituido con 0, 1, 2, 3 o 4 sustituyentes V, en donde V representa, independientemente entre sí, halógeno (por ejemplo, F, Cl), ciano, alquilo C₁-C₆ opcionalmente halogenado, alcoxi C₁-C₆ opcionalmente halogenado (como fenilo opcionalmente sustituido con 0, 1 o 2 sustituyentes V seleccionados, independientemente entre sí, del grupo constituido por halógeno (como F, Cl), alcoxi C₁-C₃ (como metoxi y etoxi), alquilo C₁-C₃ (como metilo), alquilo C₁-C₃ halogenado (como CF₃) y ciano, o piridilo, tienilo, fenilo u oxazolilo opcionalmente sustituido con 0, 1 o 2 sustituyentes V seleccionados, independientemente entre sí, del grupo constituido por halógeno (como F, Cl), alquilo C₁-C₃ (como metilo), alquilo C₁-C₃ halogenado (como CF₃) y ciano), preferiblemente representa un piridilo, tienilo, fenilo u oxazolilo con 0, 1 o 2 sustituyentes V sustituido, en donde V representa respectivamente, independientemente entre sí, F, Cl, CN, alcoxi C₁-C₃ (como metoxi).

Isómeros

Dependiendo de la naturaleza de los sustituyentes, los compuestos de fórmula (I) pueden existir como isómeros

geométricos y/u ópticamente activos o mezclas isoméricas correspondientes en diferente composición. Estos estereoisómeros son, por ejemplo, enantiómeros, diaestereómeros, atropisómeros o isómeros geométricos. La invención comprende, por tanto, isómeros geométricos, así como también mezclas discrecionales de estos isómeros.

5 **Procedimiento y usos**

Se describen además procedimientos para combatir plagas animales, en las que los compuestos de fórmula (I) se dejan actuar sobre las plagas animales y/o su hábitat. El combate de las plagas animales se lleva a cabo preferentemente en la agricultura y la silvicultura, y en la protección de materiales. Entre estos se excluyen preferiblemente los procedimientos para el tratamiento quirúrgico o terapéutico del cuerpo humano o animal y los procedimientos de diagnóstico que se llevan a cabo en el cuerpo humano o animal.

Se describe además el uso de los compuestos de la fórmula (I) como agentes de control de plagas, especialmente productos fitosanitarios.

En el marco de la presente solicitud, el término agentes de control de plagas también comprende siempre el término productos fitosanitarios.

Los compuestos de la fórmula (I), dada la buena tolerancia por parte de las plantas, toxicidad favorable con animales de sangre caliente y buena compatibilidad medioambiental, son adecuados para la protección de plantas y órganos de las plantas de los factores de estrés bióticos y abióticos, para aumentar los rendimientos de recogida, mejorar la calidad del material recogido y para combatir plagas animales, especialmente insectos, arácnidos, helmintos, nematodos y moluscos que se encuentran en la agricultura, en la horticultura, en la cría de animales, en acuicultura, en bosques, en jardines y en instalaciones recreativas, en la protección de materiales y de productos almacenados, así como en el sector de la higiene.

En el contexto de la presente solicitud de patente, por el término "higiene" se entiende la totalidad de todas las medidas, procedimientos y modos de actuar que tienen el objetivo de evitar enfermedades, especialmente enfermedades infecciosas, y sirven para preservar la salud de seres humanos, animales y/o el medioambiente y/o para mantener la limpieza. Entre esto se encuentran según la invención especialmente las medidas para la purificación, desinfección y esterilización, por ejemplo, de superficies textiles o duras, particularmente de vidrio, madera, hormigón, porcelana, cerámica, plástico o también de metal(es), y su limpieza de plagas sanitarias o sus heces. Según la invención se excluyen correspondientemente a su vez los procedimientos para el tratamiento quirúrgico o terapéutico del cuerpo humano o animal y procedimientos de diagnóstico que se realizan en el cuerpo humano o animal.

El término "sector de la higiene" comprende en consecuencia todos los sectores, campos técnicos y utilidades comerciales en las que dichas medidas, procedimientos y modos de actuar son de importancia para la higiene como, por ejemplo, la higiene en cocinas, panaderías, aeropuertos, baños, piscinas, centros comerciales, hoteles, hospitales, establos, etc.

Por el término "plaga sanitaria" se entiende en consecuencia una o varias plagas animales cuya presencia en el sector de la higiene es problemática, especialmente por motivos de salud. En consecuencia, el principal objetivo es evitar o minimizar las plagas sanitarias o el contacto con ellas en el sector de la higiene. Esto se puede realizar especialmente mediante la aplicación de un agente de control de plagas, en donde el agente se puede utilizar tanto profilácticamente como también solo en el caso de infestación para combatir la plaga. También es posible utilizar agentes que provocan que se evite o reduzca el contacto con la plaga. Como plagas sanitarias se consideran, por ejemplo, los organismos mencionados a continuación.

El término "protección de la higiene" comprende en consecuencia todas las acciones para el mantenimiento y/o la mejora de dichas medidas, procedimientos y modos de actuar.

Los compuestos de la fórmula (I) se pueden utilizar preferiblemente como agentes de control de plagas. Son activos contra especies normalmente sensibles y resistentes, así como contra todos los estadios de desarrollo o estadios de desarrollo individuales. A las plagas anteriormente mencionadas pertenecen:

Plagas del filo de los artrópodos, especialmente de la clase de los arácnidos, por ejemplo, *Acarus* spp., por ejemplo, *Acarus siro*, *Aceria kuko*, *Aceria sheldoni*, *Aculops* spp., *Aculus* spp., por ejemplo, *Aculus fockeui*, *Aculus schlechtendali*, *Amblyomma* spp., *Amphitetranychus viennensis*, *Argas* spp., *Boophilus* spp., *Brevipalpus* spp., por ejemplo, *Brevipalpus phoenicis*, *Bryobia graminum*, *Bryobia praetiosa*, *Centruroides* spp., *Chorioptes* spp., *Dermanyssus gallinae*, *Dermatophagoides pteronyssinus*, *Dermatophagoides farinae*, *Dermacentor* spp., *Eotetranychus* spp., por ejemplo, *Eotetranychus hicoriae*, *Epitrimerus pyri*, *Eutetranychus* spp., por ejemplo, *Eutetranychus banksi*, *Eriophyes* spp., por ejemplo, *Eriophyes pyri*, *Glycyphagus domesticus*, *Halotydeus destructor*, *Hemitarsonemus* spp., por ejemplo, *Hemitarsonemus latus* (=Polyphagotarsonemus latus), *Hyalomma* spp., *Ixodes* spp., *Latrodectus* spp., *Loxosceles* spp., *Neutrombicula autumnalis*, *Nuphersa* spp., *Oligonychus* spp., por ejemplo, *Oligonychus coniferarum*, *Oligonychus ilicis*, *Oligonychus indicus*, *Oligonychus mangiferus*, *Oligonychus pratensis*, *Oligonychus punicae*, *Oligonychus yothersi*, *Ornithodoros* spp.,

- Ornithonyssus spp., Panonychus spp., por ejemplo, Panonychus citri (=Metatetranychus citri), Panonychus ulmi (=Metatetranychus ulmi), Phyllocoptruta oleivora, Platytranychus multidigituli, Polyphagotarsonemus latus, Psoroptes spp., Rhipicephalus spp., Rhizoglyphus spp., Sarcoptes spp., Scorpio maurus, Steneotarsonemus spp., Steneotarsonemus pinki, Tarsonemus spp., por ejemplo, Tarsonemus confusus, Tarsonemus pallidus, Tetranychus spp., por ejemplo, Tetranychus canadensis, Tetranychus cinnabarinus, Tetranychus turkestanii, Tetranychus urticae, Trombicula alfreddugesi, Vaejovis spp., Vasates lycopersici;
- de la clase de los quilópodos, por ejemplo, Geophilus spp., Scutigera spp.;
- del orden o de la clase de los colémbolos, por ejemplo, Onychiurus armatus; Sminthurus viridis;
- de la clase de los diplópodos, por ejemplo, Blaniulus guttulatus;
- de la clase de los insectos, por ejemplo, del orden de los Blattodea, por ejemplo, Blatta orientalis, Blattella asahinai, Blattella germanica, Leucophaea maderae, Panchlora spp., Parcoblatta spp., Periplaneta spp., por ejemplo, Periplaneta americana, Periplaneta australasiae, Supella longipalpa;
- del orden de los coleópteros, por ejemplo, Acalymma vittatum, Acanthoscelides obtectus, Adoretus spp., Agelastica alni, Agriotes spp., por ejemplo, Agriotes linneatus, Agriotes mancus, Alphitobius diaperinus, Amphimallon solstitialis, Anobium punctatum, Anoplophora spp., Anthonomus spp., por ejemplo, Anthonomus grandis, Anthrenus spp., Apion spp., Apogonia spp., Atomaria spp., por ejemplo, Atomaria linearis, Attagenus spp., Baris caerulescens, Bruchidius obtectus, Bruchus spp., por ejemplo, Bruchus pisorum, Bruchus rufimanus, Cassida spp., Cerotoma trifurcata, Ceutorrhynchus rapae, Chaetocnema spp., por ejemplo, Chaetocnema confinis, Ceutorrhynchus quadridens, Ceutorrhynchus rapae, Chaetocnema spp., por ejemplo, Chaetocnema confinis, Chaetocnema denticulata, Chaetocnema ectypa, Cleonus mendicus, Conoderus spp., Cosmopolites spp., por ejemplo, Cosmopolites sordidus, Costelytra zealandica, Ctenicera spp., Curculio spp., por ejemplo, Curculio caryae, Curculio caryatipes, Curculio obtusus, Curculio sayi, Cryptolestes ferrugineus, Cryptolestes pusillus, Cryptorhynchus lapathi, Cryptorhynchus mangiferae, Cylindrocopturus spp., Cylindrocopturus adpersus, Cylindrocopturus furnissi, Dermestes spp., Diabrotica spp., por ejemplo, Diabrotica balteata, Diabrotica barberi, Diabrotica undecimpunctata howardi, Diabrotica undecimpunctata undecimpunctata, Diabrotica virgifera virgifera, Diabrotica virgifera zeaee, Dichrocrocis spp., Dieladisa armigera, Diloboderus spp., Epilachna spp., por ejemplo, Epilachna borealis, Epilachna varivestis, Eplitrix spp., por ejemplo, Eplitrix cucumeris, Eplitrix fuscata, Eplitrix hirtipennis, Eplitrix subcrinita, Eplitrix tuberis, Faustinus spp., Gibbium psyllodes, Gnathocerus cornutus, Hellula undalis, Heteronychus arator, Heteronyx spp., Hylamorphia elegans, Hylotrupes bajulus, Hypera postica, Hypomeces squamosus, Hypothenemus spp., por ejemplo, Hypothenemus hampei, Hypothenemus obscurus, Hypothenemus pubescens, Lachnosterna consanguinea, Lasioderma serricorne, Latheticus oryzae, Lathridius spp., Lema spp., Leptinotarsa decemlineata, Leucoptera spp., por ejemplo, Leucoptera coffeella, Lissorhoptrus oryzophilus, Lixus spp., Luperomorpha xanthodera, Luperodes spp., Lyctus spp., Megascelis spp., Melanotus spp., por ejemplo, Melanotus longulus oregonensis, Meligethes aeneus, Melolontha spp., por ejemplo, Melolontha melolontha, Migdolus spp., Monochamus spp., Naupactus xanthographus, Necrobia spp., Niptus hololeucus, Oryctes rhinoceros, Oryzaephilus surinamensis, Oryzaphagus oryzae, Otiorhynchus spp., por ejemplo, Otiorhynchus cribricollis, Otiorhynchus ligustici, Otiorhynchus ovatus, Otiorhynchus rugosostriatus, Otiorhynchus sulcatus, Oxycetonia jucunda, Phaedon cochleariae, Phyllophaga spp., Phyllophaga helleri, Phyllostreta spp., por ejemplo, Phyllostreta armoraciae, Phyllostreta pusilla, Phyllostreta ramosa, Phyllostreta striolata, Popillia japonica, Premnotrypes spp., Prosthephanus truncatus, Psylliodes spp., por ejemplo, Psylliodes affinis, Psylliodes chrysocephala, Psylliodes punctulata, Ptinus spp., Rhizobius ventralis, Rhizopertha dominica, Sitophilus spp., por ejemplo, Sitophilus granarius, Sitophilus linearis, Sitophilus oryzae, Sitophilus zeamais, Sphenophorus spp., Stegobium paniceum, Sternechus spp., por ejemplo, Sternechus paludatus, Symphyletes spp., Tanyemecus spp., por ejemplo, Tanyemecus dilaticollis, Tanyemecus indicus, Tanyemecus palliatus, Tenebrio molitor, Tenebrioides mauretanicus, Tribolium spp., por ejemplo, Tribolium audax, Tribolium castaneum, Tribolium confusum, Trogoderma spp., Tychius spp., Xylotrechus spp., Zabrus spp., por ejemplo, Zabrus tenebrioides;
- del orden de los dípteros, por ejemplo, Aedes spp., por ejemplo, Aedes aegypti, Aedes albopictus, Aedes sticticus, Aedes vexans, Agromyza spp., por ejemplo, Agromyza frontella, Agromyza parvicornis, Anastrepha spp., Anopheles spp., por ejemplo, Anopheles quadrimaculatus, Anopheles gambiae, Asphondylia spp., Bactrocera spp., por ejemplo, Bactrocera cucurbitae, Bactrocera dorsalis, Bactrocera oleae, Bibio hortulanus, Calliphora erythrocephala, Calliphora vicina, Ceratitis capitata, Chironomus spp., Chrysomya spp., Chrysops spp., Chrysozona pluvialis, Cochliomya spp., Contarinia spp., por ejemplo, Contarinia johnsoni, Contarinia nasturtii, Contarinia pyrivora, Contarinia schulzi, Contarinia sorghicola, Contarinia tritici, Cordylobia anthropophaga, Cricotopus sylvestris, Culex spp., por ejemplo, Culex pipiens, Culex quinquefasciatus, Culicoides spp., Culiseta spp., Cuterebra spp., Dacusoleae, Dasineura spp., por ejemplo, Dasineura brassicae, Delia spp., por ejemplo, Delia antiqua, Delia coarctata, Delia florilega, Delia platura, Delia radicum, Dermatobia hominis, Drosophila spp., por ejemplo, Drosophila melanogaster, Drosophila suzukii, Echinocnemeus spp., Fannia spp., Gasterophilus spp., Glossina spp., Haematopota spp., Hydrellia spp., Hydrellia griseola, Hylemya spp., Hippobosca spp., Hypoderma spp., Liriomyza spp., por ejemplo, Liriomyza brassicae, Liriomyza huidobrensis, Liriomyza sativae, Lucilia spp., por ejemplo, Lucilia cuprina, Lutzomyia spp., Mansonia spp.,

Musca spp., por ejemplo, *Musca domestica*, *Musca domestica vicina*, *Oestrus* spp., *Oscinella* frit, *Paratanytarsus* spp., *Paralauterborniella* subcineta, *Pegomya* spp., por ejemplo, *Pegomya betae*, *Pegomya hyoscyami*, *Pegomya rubivora*, *Phlebotomus* spp., *Phorbia* spp., *Phormia* spp., *Piophilha casei*, *Prodiptosis* spp., *Psilarosae*, *Rhagoletis* spp., por ejemplo, *Rhagoletis cingulata*, *Rhagoletis completa*, *Rhagoletis fausta*, *Rhagoletis indifferens*, *Rhagoletis mendax*, *Rhagoletis pomonella*, *Sarcophaga* spp., *Simulium* spp., por ejemplo, *Simulium meridionale*, *Stomoxys* spp., *Tabanus* spp., *Tetanops* spp., *Tipula* spp., por ejemplo, *Tipula paludosa*, *Tipula simplex*;

del orden de los hemípteros, por ejemplo, *Acizzia acaciaebaileyanae*, *Acizzia dodonaeae*, *Acizzia uncatoides*, *Acrida turrata*, *Acyrtosiphon* spp., por ejemplo, *Acyrtosiphon pisum*, *Acrogonia* spp., *Aeneolamia* spp., *Agonoscena* spp., *Aleyrodes prolella*, *Aleurolobus barodensis*, *Aleurothrixus floccosus*, *Allocairidara malayensis*, *Amrasca* spp., por ejemplo, *Amrasca bigutulla*, *Amrasca devastans*, *Anuraphis cardui*, *Aonidiella* spp., por ejemplo, *Aonidiella aurantii*, *Aonidiella citrina*, *Aonidiella inornata*, *Aphanostigma piri*, *Aphis* spp., por ejemplo, *Aphis citricola*, *Aphis craccivora*, *Aphis fabae*, *Aphis forbesi*, *Aphis glycines*, *Aphis gossypii*, *Aphis hederarum*, *Aphis illinoisensis*, *Aphis middletoni*, *Aphis nasturtii*, *Aphis nerii*, *Aphis pomi*, *Aphis spiraeicola*, *Aphis viburniphila*, *Arboridia apicalis*, *Arytainilla* spp., *Aspidiella* spp., *Aspidiotus* spp., por ejemplo, *Aspidiotus nerii*, *Atanus* spp., *Aulacorthum solani*, *Bemisia tabaci*, *Blastosylla occidentalis*, *Boreioglycaspis melaleucae*, *Brachycaudus helichrysi*, *Brachycolus* spp., *Brevicoryne brassicae*, *Cacopsylla* spp., por ejemplo, *Cacopsylla pyricola*, *Calligypona marginata*, *Carneocephala fulgida*, *Ceratovacuna lanigera*, *Cercopidae*, *Ceroplastes* spp., *Chaetosiphon fragaefolii*, *Chionaspis tegalensis*, *Chlorita onukii*, *Chondracris rosea*, *Chromaphis juglandicola*, *Chrysomphalus ficus*, *Cicadulina mbila*, *Cocomytilus halli*, *Coccus* spp., por ejemplo, *Coccus hesperidum*, *Coccus longulus*, *Coccus pseudomagnoliarum*, *Coccus viridis*, *Cryptomyzus ribis*, *Cryptoneossa* spp., *Ctenarytaina* spp., *Dalbulus* spp., *Dialeurodes citri*, *Diaphorina citri*, *Diaspis* spp., *Drosicha* spp., *Dysaphis* spp., por ejemplo, *Dysaphis apiifolia*, *Dysaphis plantaginea*, *Dysaphis tulipae*, *Dysmicoccus* spp., *Empoasca* spp., por ejemplo, *Empoasca abrupta*, *Empoasca fabae*, *Empoasca maligna*, *Empoasca solana*, *Empoasca stvensi*, *Eriosoma* spp., por ejemplo, *Eriosoma americanum*, *Eriosoma lanigerum*, *Eriosoma pyricola*, *Erythroneura* spp., *Eucalyptolyma* spp., *Euphyllura* spp., *Euscelis bilobatus*, *Ferrisia* spp., *Geococcus coffeae*, *Glycaspis* spp., *Heteropsylla cubana*, *Heteropsylla spinulosa*, *Homalodisca coagulata*, *Hyalopterus arundinis*, *Hyalopterus pruni*, *Icerya* spp., por ejemplo, *Icerya purchasi*, *Idiocerus* spp., *Idioscopus* spp., *Laodelphax striatellus*, *Lecanium* spp., por ejemplo, *Lecanium corni* (= *Parthenolecanium corni*), *Lepidosaphes* spp., por ejemplo, *Lepidosaphes ulmi*, *Lipaphis erysimi*, *Lycorma delicatula*, *Macrosiphum* spp., por ejemplo, *Macrosiphum euphorbiae*, *Macrosiphum lillii*, *Macrosiphum rosae*, *Macrosteles facifrons*, *Mahanarva* spp., *Melanaphis sacchari*, *Metcalfiella* spp., *Metcalfa pruinosa*, *Metopolophium dirhodum*, *Monellia costalis*, *Monelliopsis pecanis*, *Myzus* spp., por ejemplo, *Myzus ascalonicus*, *Myzus cerasi*, *Myzus ligustri*, *Myzus ornatus*, *Myzus persicae*, *Myzus nicotianae*, *Nasonovia ribisnigri*, *Nephotettix* spp., por ejemplo, *Nephotettix cincticeps*, *Nephotettix nigropictus*, *Nilaparvata lugens*, *Oncometopia* spp., *Orthezia praelonga*, *Oxya chinensis*, *Pachyosylla* spp., *Parabemisia myricae*, *Paratrioza* spp., por ejemplo, *Paratrioza cockerelli*, *Parlatoria* spp., *Pemphigus* spp., por ejemplo, *Pemphigus bursarius*, *Pemphigus populiveneris*, *Peregrinus maidis*, *Phenacoccus* spp., por ejemplo, *Phenacoccus madeirensis*, *Phloeomyzus passerinii*, *Phorodon humuli*, *Phylloxera* spp., por ejemplo, *Phylloxera devastatrix*, *Phylloxera notabilis*, *Pinnaspis aspidistrae*, *Planococcus* spp., por ejemplo, *Planococcus citri*, *Prosopidopsylla flava*, *Protopulvinaria pyriformis*, *Pseudaulacaspis pentagona*, *Pseudococcus* spp., por ejemplo, *Pseudococcus calceolariae*, *Pseudococcus comstocki*, *Pseudococcus longispinus*, *Pseudococcus maritimus*, *Pseudococcus viburni*, *Psyllopsis* spp., *Psylla* spp., por ejemplo, *Psylla buxi*, *Psyllamali*, *Psylla pyri*, *Pteromalus* spp., *Pyrilla* spp., *Quadraspidotus* spp., por ejemplo, *Quadraspidotus juglansregiae*, *Quadraspidotus ostreaeformis*, *Quadraspidotus perniciosus*, *Quesada gigas*, *Rastrococcus* spp., *Rhopalosiphum* spp., por ejemplo, *Rhopalosiphum maidis*, *Rhopalosiphum oxyacanthae*, *Rhopalosiphum padi*, *Rhopalosiphum rufiabdominale*, *Saissetia* spp., por ejemplo, *Saissetia coffeae*, *Saissetia miranda*, *Saissetia neglecta*, *Saissetia oleae*, *Scaphoideus titanus*, *Schizaphis graminum*, *Selenaspidus articulatus*, *Sitobion avenae*, *Sogata* spp., *Sogatella furcifera*, *Sogatodes* spp., *Stictocephala festina*, *Siphoninus phillyreae*, *Tenalaphara malayensis*, *Tetragonocephala* spp., *Tinocallis caryaefoliae*, *Tomaspis* spp., *Toxoptera* spp., por ejemplo, *Toxoptera aurantii*, *Toxoptera citricidus*, *Trialeurodes vaporariorum*, *Trioza* spp., por ejemplo, *Trioza diospyri*, *Typhlocyba* spp., *Unaspis* spp., *Viteus vitifolii*, *Zygina* spp.;

del suborden de los heterópteros, por ejemplo, *Anasa tristis*, *Antestiopsis* spp., *Boisea* spp., *Blissus* spp., *Calocoris* spp., *Campylomma livida*, *Cavelerius* spp., *Cimex* spp., por ejemplo, *Cimex adjunctus*, *Cimex hemipterus*, *Cimex lectularius*, *Cimex pilosellus*, *Collaria* spp., *Creontiades dilutus*, *Dasyneus piperis*, *Dichelops furcatus*, *Diconocoris hewetti*, *Dysdercus* spp., *Euschistus* spp., por ejemplo, *Euschistus heros*, *Euschistus servus*, *Euschistus tristigmus*, *Euschistus variolarius*, *Eurygaster* spp., *Halyomorpha halys*, *Heliopeltis* spp., *Horcias nobilellus*, *Leptocorisa* spp., *Leptocorisa varicornis*, *Leptoglossus occidentalis*, *Leptoglossus phyllopus*, *Lygocoris* spp., por ejemplo, *Lygocoris pabulinus*, *Lygus* spp., por ejemplo, *Lygus elisus*, *Lygus hesperus*, *Lygus lineolaris*, *Macropes excavatus*, *Monalonion atratum*, *Nezara* spp., por ejemplo, *Nezara viridula*, *Oebalus* spp., *Piesma quadrata*, *Piezodorus* spp., por ejemplo, *Piezodorus guildinii*, *Psallus* spp., *Pseudacysta perseae*, *Rhodnius* spp., *Sahlbergella singularis*, *Scaptocoris castanea*, *Scotinophora* spp., *Stephanitis nashi*, *Tibraca* spp., *Triatoma* spp.;

del orden de los himenópteros, por ejemplo, *Acromyrmex* spp., *Athalia* spp., por ejemplo, *Athalia rosae*, *Atta*

spp., *Diprion* spp., por ejemplo, *Diprion similis*, *Hoplocampa* spp., por ejemplo, *Hoplocampa cookei*, *Hoplocampa testudinea*, *Lasius* spp., *Linepithema humile*, *Monomorium pharaonis*, *Sirex* spp., *Solenopsis invicta*, *Tapinoma* spp., *Urocerus* spp., *Vespa* spp., por ejemplo, *Vespa crabro*, *Xeris* spp.;

del orden de los isópodos, por ejemplo, *Armadillidium vulgare*, *Oniscus asellus*, *Porcellio scaber*;

5 del orden de los isópteros, por ejemplo, *Coptotermes* spp., por ejemplo, *Coptotermes formosanus*, *Comitermes cumulans*, *Cryptotermes* spp., *Incisitermes* spp., *Microtermes obesi*, *Odontotermes* spp., *Reticulitermes* spp., por ejemplo, *Reticulitermes flavipes*, *Reticulitermes hesperus*;

del orden de los lepidópteros, por ejemplo, *Achroia grisella*, *Acronicta major*, *Adoxophyes* spp., por ejemplo, *Adoxophyes orana*, *Aedia leucomelas*, *Agrotis* spp., por ejemplo, *Agrotis segetum*, *Agrotis ipsilon*, *Alabama* spp., por ejemplo, *Alabama argillacea*, *Amyelois transitella*, *Anarsia* spp., *Anticarsia* spp., por ejemplo, *Anticarsia gemmatalis*, *Argyroploce* spp., *Barathra brassicae*, *Borbo cinnara*, *Bucculatrix thurberiella*, *Bupalus piniarius*, *Busseola* spp., *Cacoecia* spp., *Caloptilia theivora*, *Capua reticulana*, *Carpocapsa pomonella*, *Carposina niponensis*, *Cheimatobia brumata*, *Chilo* spp., por ejemplo, *Chilo plejadellus*, *Chilo suppressalis*, *Choristoneura* spp., *Clysia ambiguella*, *Cnaphalocerus* spp., *Cnaphalocrocis medinalis*, *Cnephasia* spp., *Conopomorpha* spp., *Conotrachelus* spp., *Copitarsia* spp., *Cydia* spp., por ejemplo, *Cydia nigricana*, *Cydia pomonella*, *Dalaca noctuides*, *Diaphania* spp., *Diatraea saccharalis*, *Earias* spp., *Ecdytolopha aurantium*, *Elasmopalpus lignosellus*, *Eldana saccharina*, *Ephestia* spp., por ejemplo, *Ephestia elutella*, *Ephestia kuehniella*, *Epinotia* spp., *Epiphyas postvittana*, *Etiella* spp., *Eulia* spp., *Eupoecilia ambiguella*, *Euproctis* spp., por ejemplo, *Euproctis chrysorrhoea*, *Euxoa* spp., *Feltia* spp., *Galleria mellonella*, *Gracillaria* spp., *Grapholitha* spp., por ejemplo, *Grapholitha molesta*, *Grapholitha prunivora*, *Hedylepta* spp., *Helicoverpa* spp., por ejemplo, *Helicoverpa armigera*, *Helicoverpa zea*, *Heliothis* spp., por ejemplo, *Heliothis virescens*, *Hofmannophila pseudopretella*, *Homoeosoma* spp., *Homona* spp., *Hyponomeuta padella*, *Kakivoria flavofasciata*, *Laphygma* spp., *Leucinodes orbonalis*, *Leucoptera* spp., por ejemplo, *Leucoptera coffeefla*, *Lithocolletis* spp., por ejemplo, *Lithocolletis blancardella*, *Lithophane antennata*, *Lobesia* spp., por ejemplo, *Lobesia botrana*, *Loxagrotis albicosta*, *Lymantria* spp., por ejemplo, *Lymantria dispar*, *Lyonetia* spp., por ejemplo, *Lyonetia clerkella*, *Malacosoma neustria*, *Maruca testulalis*, *Mamestra brassicae*, *Melanitis leda*, *Mocis* spp., *Monopis obviella*, *Mythimna separata*, *Nemapogon cloacellus*, *Nymphula* spp., *Oiketicus* spp., *Oria* spp., *Orthaga* spp., *Ostrinia* spp., por ejemplo, *Ostrinia nubilalis*, *Oulema melanopus*, *Oulema oryzae*, *Panolis flammea*, *Parnara* spp., *Pectinophora* spp., por ejemplo, *Pectinophora gossypiella*, *Perileucoptera* spp., *Phthorimaea* spp., por ejemplo, *Phthorimaea operculella*, *Phyllocnistis citrella*, *Phyllonorycter* spp., por ejemplo, *Phyllonorycter blancardella*, *Phyllonorycter crataegella*, *Pieris* spp., por ejemplo, *Pieris rapae*, *Platynota stultana*, *Plodia interpunctella*, *Plusia* spp., *Plutella xylostella* (= *Plutella maculipennis*), *Prays* spp., *Prodenia* spp., *Protoparce* spp., *Pseudaletia* spp., por ejemplo, *Pseudaletia unipuncta*, *Pseudoplusia includens*, *Pyrausta nubilalis*, *Rachiplusia nu*, *Schoenobius* spp., por ejemplo, *Schoenobius bipunctifer*, *Scirpophaga* spp., por ejemplo, *Scirpophaga innotata*, *Scotia segetum*, *Sesamia* spp., por ejemplo, *Sesamia inferens*, *Sparganothis* spp., *Spodoptera* spp., por ejemplo, *Spodoptera eradiana*, *Spodoptera exigua*, *Spodoptera frugiperda*, *Spodoptera praefica*, *Stathmopoda* spp., *Stomopteryx subscivella*, *Synanthedon* spp., *Tecia solanivora*, *Thermesia gemmatalis*, *Tinea cloacella*, *Tinea pellionella*, *Tineola bisselliella*, *Tortrix* spp., *Trichophaga tapetzella*, *Trichoplusia* spp., por ejemplo, *Trichoplusia ni*, *Tryporyza incertulas*, *Tuta absoluta*, *Virachola* spp.;

40 del orden de los ortópteros o saltatorios, por ejemplo, *Acheta domesticus*, *Dichroplus* spp., *Gryllotalpa* spp., por ejemplo, *Gryllotalpa gryllotalpa*, *Hieroglyphus* spp., *Locusta* spp., por ejemplo, *Locusta migratoria*, *Melanoplus* spp., por ejemplo, *Melanoplus devastator*, *Paratlanticus ussuriensis*, *Schistocerca gregaria*;

del orden de los fitópteros, por ejemplo, *Damalinia* spp., *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Phylloxera vastatrix*, *Phthirus pubis*, *Trichodectes* spp.;

45 del orden de los psocópteros, por ejemplo, *Lepinotus* spp., *Liposcelis* spp.;

del orden de los sifonápteros, por ejemplo, *Ceratophyllus* spp., *Ctenocephalides* spp., por ejemplo, *Ctenocephalides canis*, *Ctenocephalides felis*, *Pulex irritans*, *Tunga penetrans*, *Xenopsylla cheopis*;

del orden de los tisanópteros, por ejemplo, *Anaphothrips obscurus*, *Baliothrips biformis*, *Drepanothrips reuteri*, *Enneothrips flavens*, *Frankliniella* spp., por ejemplo, *Frankliniella fusca*, *Frankliniella occidentalis*, *Frankliniella schultzei*, *Frankliniella tritici*, *Frankliniella vaccinii*, *Frankliniella williamsi*, *Heliothrips* spp., *Hercinothrips femoralis*, *Rhipiphorothers cruentatus*, *Scirtothrips* spp., *Taeniothrips cardamomi*, *Thrips* spp., por ejemplo, *Thrips palmi*, *Thrips tabaci*;

del orden de los zigentoma (=tisanuros), por ejemplo, *Ctenolepisma* spp., *Lepisma saccharina*, *Lepismodes inquilinus*, *Thermobia domestica*;

55 de la clase de los sínfilos, por ejemplo, *Scutigera* spp., por ejemplo, *Scutigera immaculata*;

plagas del filo de los moluscos, especialmente de la clase de los bivalvos, por ejemplo, *Dreissena* spp.;

así como de la clase de los gastrópodos, por ejemplo, *Arion* spp., por ejemplo, *Arion ater rufus*, *Biomphalaria* spp., *Bulinus* spp., *Deroceras* spp., por ejemplo, *Deroceras laeve*, *Galba* spp., *Lymnaea* spp., *Oncomelania* spp., *Pomacea* spp., *Succinea* spp.;

5 parásitos animales y humanos de los filos de los platihelminths y nematodos, por ejemplo, *Aelurostrongylus* spp., *Amidostomum* spp., *Ancylostoma* spp., *Angiostrongylus* spp., *Anisakis* spp., *Anoplocephala* spp., *Ascaris* spp., *Ascaridia* spp., *Baylisascaris* spp., *Brugia* spp., *Bunostomum* spp., *Capillaria* spp., *Chabertia* spp., *Clonorchis* spp., *Cooperia* spp., *Crenosoma* spp., *Cyathostoma* spp., *Dicrocoelium* spp., *Dictyocaulus* spp., *Diphyllobothrium* spp., *Dipylidium* spp., *Dirofilaria* spp., *Dracunculus* spp., *Echinococcus* spp., *Echinostoma* spp., *Enterobius* spp., *Eucoleus* spp., *Fasciola* spp., *Fascioloides* spp., *Fasciolopsis* spp., *Filaroides* spp.,
10 *Gongylonema* spp., *Gyrodactylus* spp., *Habronema* spp., *Haemonchus* spp., *Heligmosomoides* spp., *Heterakis* spp., *Hymenolepis* spp., *Hyostrongylus* spp., *Litomosoides* spp., *Loa* spp., *Metastrongylus* spp., *Metorchis* spp., *Mesocestoides* spp., *Moniezia* spp., *Muellerius* spp., *Necator* spp., *Nematodirus* spp., *Nippostrongylus* spp., *Oesophagostomum* spp., *Ollulanus* spp., *Onchocerca* spp., *Opisthorchis* spp., *Oslerus* spp., *Ostertagia* spp., *Oxyuris* spp., *Paracapillaria* spp., *Parafilaria* spp., *Paragonimus* spp., *Paramphistomum* spp., *Paranoplocephala* spp., *Parascaris* spp., *Passalurus* spp., *Protostrongylus* spp., *Schistosoma* spp., *Setaria* spp., *Spirocerca* spp., *Stephanofilaria* spp., *Stephanurus* spp., *Strongyloides* spp., *Strongylus* spp., *Syngamus* spp., *Taenia* spp., *Teladorsagia* spp., *Thelazia* spp., *Toxascaris* spp., *Toxocara* spp., *Trichinella* spp., *Trichobilharzia* spp., *Trichostrongylus* spp., *Trichuris* spp., *Uncinaria* spp., *Wuchereria* spp.;

20 plagas de las plantas del filo de los nematodos, es decir, nematodos parasitarios de las plantas, especialmente *Aglenchus* spp., por ejemplo, *Aglenchus agricola*, *Anguina* spp., por ejemplo, *Anguina tritici*, *Aphelenchoides* spp., por ejemplo, *Aphelenchoides arachidis*, *Aphelenchoides fragariae*, *Belonolaimus* spp., por ejemplo, *Belonolaimus gracilis*, *Belonolaimus longicaudatus*, *Belonolaimus nortoni*, *Bursaphelenchus* spp., por ejemplo, *Bursaphelenchus cocophilus*, *Bursaphelenchus eremus*, *Bursaphelenchus xylophilus*, *Cacopaurus* spp., por ejemplo, *Cacopaurus pestis*, *Criconemella* spp., por ejemplo, *Criconemella curvata*, *Criconemella onoensis*, *Criconemella ornata*, *Criconemella rusium*, *Criconemella xenoplax* (= *Mesocriconema xenoplax*), *Criconemoides* spp., por ejemplo, *Criconemoides ferniae*, *Criconemoides onoense*, *Criconemoides ornatum*, *Ditylenchus* spp., por ejemplo, *Ditylenchus dipsaci*, *Dolichodorus* spp., *Globodera* spp., por ejemplo, *Globodera pallida*, *Globodera rostochiensis*, *Helicotylenchus* spp., por ejemplo, *Helicotylenchus dihystra*, *Hemicriconemoides* spp., *Hemicyclophora* spp., *Heterodera* spp., por ejemplo, *Heterodera avenae*, *Heterodera glycines*, *Heterodera schachtii*, *Hoplolaimus* spp., *Longidorus* spp., por ejemplo, *Longidorus africanus*, *Meloidogyne* spp., por ejemplo, *Meloidogyne chitwoodi*, *Meloidogyne fallax*, *Meloidogyne hapla*, *Meloidogyne incognita*, *Meloinema* spp., *Nacobbus* spp., *Neotylenchus* spp., *Paraphelenchus* spp., *Paratrichodorus* spp., por ejemplo, *Paratrichodorus minor*, *Pratylenchus* spp., por ejemplo, *Pratylenchus penetrans*, *Pseudohalenchus* spp., *Psilenchus* spp., *Punctodera* spp., *Quinisulcius* spp., *Radopholus* spp., por ejemplo, *Radopholus citrophilus*, *Radopholus similis*, *Rotylenchulus* spp., *Rotylenchus* spp., *Scutellonema* spp., *Subanguina* spp.,
30 *Trichodorus* spp., por ejemplo, *Trichodorus obtusus*, *Trichodorus primitivus*, *Tylenchorhynchus* spp., por ejemplo, *Tylenchorhynchus annulatus*, *Tylenchulus* spp., por ejemplo *Tylenchulus semipenetrans*, *Xiphinema* spp., por ejemplo, *Xiphinema index*.

Se puede combatir además, del subreino de los protozoos, el orden de los coccidios, por ejemplo, *Eimeria* spp.

40 Los compuestos de la fórmula (I) también se pueden usar opcionalmente en determinadas concentraciones o tasas de aplicación, como herbicidas, protectores, reguladores del crecimiento o agentes para mejorar las propiedades de las plantas, como microbicidas o gametocidas, por ejemplo como fungicidas, antimicóticos, bactericidas, viricidas (incluyendo agentes contra viroides) o como agentes contra MLO (organismos de tipo *Mycoplasma*) y RLO (organismos de tipo *Rickettsia*). También se pueden utilizar opcionalmente como productos intermedios o
45 precursores para la síntesis de otros principios activos.

Formulaciones

Se describen además formulaciones y formas de aplicación preparadas a partir de las mismas como agentes de control de plagas como, por ejemplo, caldos para rociado, goteo y pulverización, que comprenden al menos un compuesto de la fórmula (I). Opcionalmente, las formas de aplicación contienen agentes de control de plagas
50 adicionales y/o adyuvantes que mejoran la acción como promotores de la penetración, por ejemplo, aceites vegetales como, por ejemplo, aceite de colza, aceite de girasol, aceites minerales como, por ejemplo, aceites de parafina, ésteres alquílicos de ácidos grasos vegetales como, por ejemplo, éster metílico de aceite de colza o de aceite de soja o alcoxilatos de alcanol y/o agentes de extensión como, por ejemplo, alquilsiloxanos y/o sales, por ejemplo, sales de amonio o fosfonio orgánicas o inorgánicas como, por ejemplo, sulfato de amonio o
55 hidrogenofosfato de diamonio y/o promotores de la retención como, por ejemplo, sulfosuccinato de diocilo o polímeros de hidroxipropil-guar y/o humectantes como, por ejemplo, glicerina y/o fertilizantes como, por ejemplo, fertilizantes que contienen amonio, potasio o fósforo.

Las formulaciones habituales son, por ejemplo, líquidos solubles en agua (SL), concentrados en emulsión (EC), emulsiones en agua (EW), concentrados en suspensión (SC, SE, FS, OD), gránulos dispersables en agua (WG),
60 gránulos (GR) y concentrados en cápsula (CS); estos tipos de formulación y otros tipos de formulación posibles se

describen, por ejemplo, por Crop Life International y en Pesticide Specifications, Manual on development and use of FAO and WHO specifications for pesticides, FAO Plant Production and Protection Papers - 173, preparado por la FAO/WHO Joint Meeting on Pesticide Specifications, 2004, ISBN: 9251048576. Opcionalmente, las formulaciones contienen, además de uno o varios compuestos de la fórmula (I), principios activos agroquímicos adicionales.

- 5 Se trata preferiblemente de formulaciones o formas de aplicación que contienen auxiliares como, por ejemplo, extensores, disolventes, promotores de la espontaneidad, vehículos, emulsionantes, dispersantes, agentes de protección de las heladas, biocidas, espesantes y/o auxiliares adicionales como, por ejemplo, adyuvantes. Un adyuvante en este contexto es un componente que mejora el efecto biológico de la formulación, sin que el propio componente tenga un efecto biológico. Los ejemplos de adyuvantes son agentes que fomentan la retención, el comportamiento de extensión, la fijación a la superficie de la hoja o la penetración.

Estas formulaciones se preparan de manera conocida, por ejemplo, mezclando los compuestos de la fórmula (I) con auxiliares como, por ejemplo, extensores, disolventes y/o vehículos sólidos y/u otros auxiliares como, por ejemplo, sustancias tensioactivas. La preparación de las formulaciones se realiza o en instalaciones adecuadas o también antes o durante la aplicación.

- 15 Como auxiliares se pueden usar aquellas sustancias que son adecuadas para conferir a la formulación de los compuestos de la fórmula (I) o a las formas de aplicación preparadas a partir de estas formulaciones (como, por ejemplo, agentes de control de plagas listos para uso como caldos de pulverización o desinfectantes de semillas) propiedades especiales, como determinadas propiedades físicas, técnicas y/o biológicas.

- 20 Como extensores son adecuados, por ejemplo, agua, líquidos químicos orgánicos polares y apolares, por ejemplo, de las clases de los hidrocarburos aromáticos y no aromáticos (como parafinas, alquilbencenos, alquilnaftalenos, clorobencenos), de los alcoholes y polioles (que opcionalmente también pueden estar sustituidos, eterificados y/o esterificados), de las cetonas (como acetona, ciclohexanona), ésteres (también grasas y aceites) y (poli)-éteres, de las aminas, amidas, lactamas simples y sustituidas (como N-alquilpirrolidonas) y lactonas, de las sulfonas y de los sulfóxidos (como sulfóxido de dimetilo).

- 25 En caso de uso de agua como extensor, también se pueden usar, por ejemplo, disolventes orgánicos como disolventes auxiliares. Como disolventes líquidos se consideran esencialmente: aromáticos como xileno, tolueno o alquilnaftalenos, hidrocarburos aromáticos clorados o alifáticos clorados como clorobencenos, cloroetilenos o cloruro de metileno, hidrocarburos alifáticos, como ciclohexano o parafinas, por ejemplo, fracciones del petróleo, aceites minerales y vegetales, alcoholes como butanol o glicol, así como sus éteres y ésteres, cetonas como acetona, metiletilcetona, metilisobutilcetona o ciclohexanona, disolventes fuertemente polares como dimetilformamida y sulfóxido de dimetilo, así como agua.

- 30 En principio se pueden usar todos los disolventes adecuados. Los disolventes adecuados son, por ejemplo, hidrocarburos aromáticos como, por ejemplo, xileno, tolueno o alquilnaftalenos, hidrocarburos aromáticos o alifáticos clorados como, por ejemplo, clorobenceno, cloroetileno o cloruro de metileno, hidrocarburos alifáticos como, por ejemplo, ciclohexano, parafinas, fracciones del petróleo, aceites minerales y vegetales, alcoholes como, por ejemplo, metanol, etanol, iso-propanol, butanol o glicol, así como sus éteres y ésteres, cetonas como, por ejemplo, acetona, metiletilcetona, metilisobutilcetona o ciclohexanona, disolventes fuertemente polares como sulfóxido de dimetilo, así como agua.

- 35 En principio se pueden utilizar todos los vehículos adecuados. Como vehículos se consideran especialmente: por ejemplo, sales de amonio y polvos de roca naturales como caolines, arcillas, talco, caliza, cuarzo, atapulgita, montmorillonita o tierra de diatomeas y polvo de roca sintético, como ácido silícico altamente disperso, óxido de aluminio y silicatos naturales o sintéticos, resinas, ceras y/o fertilizantes sólidos. También se pueden usar mezclas de dichos vehículos. Como vehículos para gránulos se consideran: por ejemplo, rocas naturales rotas y fraccionadas como calcita, mármol, piedra pómez, sepiolita, dolomita, así como gránulos sintéticos de polvos inorgánicos y orgánicos, así como gránulos de material orgánico como serrín, papel, cáscaras de coco, mazorcas de maíz y tallos de tabaco.

También se pueden utilizar extensores o disolventes gaseosos licuados. Especialmente son adecuados aquellos extensores o vehículos que son gaseosos a temperatura normal y a presión normal, por ejemplo, gases propulsores de aerosoles como hidrocarburos halogenados, así como butano, propano, nitrógeno y dióxido de carbono.

- 50 Los ejemplos de emulsionantes y/o agentes generadores de espumas, agentes dispersantes o humectantes con propiedades iónicas o no iónicas o mezclas de estas sustancias tensioactivas son sales de ácido poliacrílico, sales de ácido lignosulfónico, sales de ácido fenolsulfónico o ácido naftalenosulfónico, policondensados de óxido de etileno con alcoholes grasos o con ácidos grasos o con aminas grasas, con fenoles sustituidos (preferiblemente alquilfenoles o arilfenoles), sales de ésteres sulfosuccínicos, derivados de taurina (preferiblemente tauratos de alquilo), ésteres de ácido fosfórico de alcoholes o fenoles polietoxilados, ésteres de ácidos grasos de poliolenos y derivados de los compuestos que contienen sulfonatos y fosfatos, por ejemplo, ésteres alquilarilpoliglicólicos, alquilsulfonatos, alquilsulfatos, arilsulfonatos, hidrolizados de proteína, lejías residuales de sulfito con lignina y metilcelulosa. Es ventajosa la presencia de una sustancia tensioactiva si uno de los compuestos de la fórmula (I) y/o

uno de los vehículos inertes es insoluble en agua y si la aplicación se realiza en agua.

Como auxiliares adicionales, en las formulaciones y las formas de aplicación derivadas de las mismas pueden estar presentes colorantes como pigmentos inorgánicos, por ejemplo, óxido de hierro, óxido de titanio, azul de Prusia y colorantes orgánicos como colorantes de alizarina, azoicos y de ftalocianina metálica, y nutrientes y oligonutrientes de hierro, manganeso, boro, cobre, cobalto, molibdeno y cinc.

Además, pueden estar contenidos estabilizadores como estabilizadores del frío, conservantes, antioxidantes, fotoestabilizadores, u otros agentes que mejoran la estabilidad química y/o física. Además, pueden estar contenidos generadores de espuma o antiespumantes.

Además, las formulaciones y las formas de aplicación derivadas de las mismas también pueden contener, como auxiliares adicionales, agentes adherentes como carboximetilcelulosa, polímeros naturales y sintéticos en forma de polvos, gránulos o látex como goma arábiga, poli(alcohol vinílico) y poli(acetato de vinilo), así como fosfolípidos naturales tales como cefalinas y lecitinas y fosfolípidos sintéticos. Los auxiliares adicionales pueden ser aceites minerales y vegetales.

Opcionalmente aún pueden estar contenidos auxiliares adicionales en las formulaciones y las formas de aplicación derivadas de las mismas. Dichos aditivos son, por ejemplo, fragancias, coloides protectores, aglutinantes, adhesivos, espesantes, agentes tixotrópicos, penetrantes, promotores de la retención, estabilizadores, secuestrantes, formadores de complejos, humectantes, agentes de extensión. En general, los compuestos de la fórmula (I) se pueden combinar con cualquier aditivo sólido o líquido que se usa habitualmente para fines de formulación.

Como promotores de la retención se consideran todas aquellas sustancias que reducen la tensión superficial dinámica como, por ejemplo, sulfosuccinato de dioctilo o las que aumentan la viscoelasticidad como, por ejemplo, polímeros de hidroxipropil-guar.

Como penetrantes se consideran en el presente contexto todas aquellas sustancias que se utilizan normalmente para mejorar la penetración de los principios activos agroquímicos en las plantas. Los penetrantes se definen en este contexto por el hecho de poder penetrar del caldo de aplicación (generalmente acuoso) y/o de la capa de pulverización en la cutícula de las plantas y de esta manera pueden aumentar la movilidad de sustancias (movilidad) de los principios activos en la cutícula. Se puede utilizar el procedimiento descrito en la bibliografía (Baur et al., 1997, Pesticide Science 51, 131-152) para determinar esta propiedad. A modo de ejemplo se mencionan alcoxilatos de alcohol como, por ejemplo, etoxilato graso de coco (10) o etoxilato de isotridecilo (12), ésteres de ácidos grasos como, por ejemplo, éster metílico de aceite de colza o de aceite de soja, alcoxilatos de aminas grasas como, por ejemplo, etoxilato de amina de sebo (15) o sales de amonio y/o fosfonio como, por ejemplo, sulfato de amonio o hidrogenofosfato de diamonio.

Las formulaciones contienen preferiblemente entre 0,00000001 y 98 % en peso del compuesto de la fórmula (I), con especial preferencia entre 0,01 y 95 % en peso del compuesto de la fórmula (I), de manera muy especialmente preferida entre 0,5 y 90 % en peso del compuesto de la fórmula (I), referido al peso de la formulación.

El contenido del compuesto de la fórmula (I) en las formas de aplicación preparadas a partir de las formulaciones (especialmente agentes de control de plagas) puede variar en amplios intervalos. La concentración del compuesto de la fórmula (I) en las formas de aplicación puede encontrarse normalmente entre 0,00000001 y 95 % en peso del compuesto de la fórmula (I), preferiblemente entre 0,00001 y 1 % en peso, referido al peso de la forma de aplicación. La aplicación se produce en un modo habitual apropiado para las formas de aplicación.

40 Mezclas

Los compuestos de la fórmula (I) también se pueden usar en mezcla con uno o varios fungicidas, bactericidas, acaricidas, molusquicidas, nematocidas, insecticidas, agentes microbiológicos, organismos beneficiosos, herbicidas, fertilizantes, repelentes de aves, fitotónicos, esterilizantes, protectores, semioquímicos y/o reguladores del crecimiento de las plantas adecuados para así, por ejemplo, ampliar el espectro de acción, prolongar el periodo de acción, aumentar la velocidad de la acción, evitar la repelencia o prevenir desarrollos de resistencia. Además, dichas combinaciones de principios activos pueden mejorar el crecimiento de la planta y/o la tolerancia a factores abióticos como, por ejemplo, altas o bajas temperaturas, a la sequedad o a un elevado contenido de sales en el agua o el suelo. También se puede mejorar el comportamiento de florecimiento y de frutos, optimizar la capacidad de germinación y el desarrollo de raíces, facilitar la recogida y aumentar los rendimientos de recogida, influir en la maduración, aumentar la calidad y/o el valor nutritivo de los productos recogidos, prolongar la vida útil de almacenamiento y/o mejorar la procesabilidad de los productos recogidos.

Además, los compuestos de la fórmula (I) se pueden presentar en mezcla con principios activos o semioquímicos adicionales, como atrayentes y/o repelentes de aves y/o activadores de las plantas y/o reguladores del crecimiento y/o fertilizantes. Los compuestos de la fórmula (I) se pueden utilizar igualmente en mezclas con agentes para mejorar las propiedades de las plantas como, por ejemplo, el crecimiento, el rendimiento y la calidad del material recogido.

Los compuestos de la fórmula (I) se pueden presentar en forma de formulaciones o en las formas de aplicación preparadas a partir de estas formulaciones en mezcla con compuestos adicionales, preferiblemente los que se describen a continuación.

- 5 Si uno de los compuestos mencionados a continuación puede ocurrir en formas tautómeras distintas, también están comprendidas estas formas, aunque no se mencionaron explícitamente en cada caso.

Insecticidas / acaricidas / nematocidas

Los principios activos mencionados aquí con su "nombre común" son conocidos y se describen, por ejemplo, en el manual de pesticidas ("The Pesticide Manual" 16ª Ed., British Crop Protection Council 2012) o se pueden buscar en internet (por ejemplo, <http://www.alanwood.net/pesticides>).

- 10 (1) Inhibidores de la acetilcolinesterasa (AChE) como, por ejemplo, carbamatos, por ejemplo, alanicarb, aldicarb, bendiocarb, benfuracarb, butocarboxim, butoxicarboxim, carbarilo, carbofuran, carbosulfan, etiofencarb, fenobucarb, formetanatos, furatiocarb, isoprocarb, metiocarb, metomilo, metolcarb, oxamilo, pirimicarb, propoxur, tiodicarb, tiofanox, triazamatos, trimetacarb, XMC y xililcarb u organofosfatos, por ejemplo, acefato, azametifos, azinfos-etilo, azinfos-metilo, cadusafos, cloretoxifos, clorfenvinfos, clormefos, clorpirifos, clorpirifos-metilo, cumafos, cianofos, demeton-s-metilo, diazinon, diclorovos/ddvp, dicrotofos, dimetoatos dimetoato, dimetilvinfos, disulfoton, EPN, etion, etoprofos, famfur, fenamifos, fenitrotrion, fention, fostiazato, heptenofos, imiciafos, isofenfos, o-(metoxiaminotio-fosforil)salicilato de isopropilo, isoxation, malation, mecarbam, metamidofos, metidation, mevinfos, monocrotofos, naled, ometoato, oxidemeton-metilo, paration, paration-metilo, fentoato, forato, fosalona, fosmet, fosfamidon, foxim, pirimifos-metilo, profenofos, propetamfos, protiofos, piraclafos, piridafention, quinalfos, sulfotep, tebutirimfos, temefos, terbufos, tetraclorovinfos, tiometon, triazofos, triclofon y vamidotion.
- 15 (2) Antagonistas de los canales de cloruro controlados por GABA como, por ejemplo, ciclodieno-organoclorados, por ejemplo, clordano y endosulfan o fenilpirazoles (fiproles), por ejemplo, etiprol y fipronilo.
- 25 (3) Moduladores de los canales de sodio / bloqueadores de los canales de sodio dependientes del voltaje como, por ejemplo, piretroides, por ejemplo, acrinatrina, aletrina, d-cis-trans aletrina, d-trans aletrina, bifentrina, bioaletrina, isómero S-ciclopentilo de bioaletrina, bioresmetrina, cicloprotrina, ciflutrina, beta-ciflutrina, cihalotrina, lambda-cihalotrina, gamma-cihalotrina, cipermetrina, alfa-cipermetrina, beta-cipermetrina, theta-cipermetrina, zeta-cipermetrina, cifenotrina [isómeros (1R)-trans], deltametrina, empentrina [isómeros (EZ)-(1R)], esfenvalerato, etofenprox, fenpropatrina, fenvalerato, flucitrinato, flumetrina, tau-fluvalinato, halfenprox, imiprotrina, kadetrina, momfluorotrina, permetrina, fenotrina [isómero (1R)-trans], praletrina, piretrina (piretrum), resmetrina, silafluofeno, teflutrina, tetrametrina, tetrametrina [isómeros (1R)], tralometrina y transflutrina o DDT o metoxiclor.
- 30 (4) Agonistas de los receptores nicotínicos de acetilcolina (nAChR) como, por ejemplo, neonicotinoides, por ejemplo, acetamiprid, clotianidina, dinotefuran, imidacloprid, nitenpiram, tiacloprid y tiametoxam o nicotina o sulfoxaflor o flupiradifurona.
- 35 (5) Activadores alostéricos de los receptores nicotínicos de acetilcolina (nAChR) como, por ejemplo, espinosinas, por ejemplo, espinetoram y espinosad.
- (6) Activadores de los canales de cloruro como, por ejemplo, avermectinas/milbemicinas, por ejemplo, abamectina, benzoato de emamectina, lepimectina y milbemectina.
- 40 (7) Miméticos de la hormona juvenil como, por ejemplo, análogos de la hormona juvenil, por ejemplo, hidropreno, kinopreno y metopreno o fenoxicarb o piriproxifeno.
- (8) Principios activos con mecanismos de acción desconocidos o no específicos como, por ejemplo, haluros de alquilo, por ejemplo, bromuro de metilo y otros haluros de alquilo; o cloropicrina o fluoruro de sulfurilo o bórax o tartrato de antimonio y potasio.
- 45 (9) Antinutritivos selectivos, por ejemplo, pimetrozina o flonicamid.
- (10) Inhibidores del crecimiento de ácaros, por ejemplo, clofentezina, hexitiazox y diflovidazina o etoxazol.
- 50 (11) Disruptores microbianos de la membrana intestinal de insectos, por ejemplo, *Bacillus thuringiensis* subespecie israelensis, *Bacillus sphaericus*, *Bacillus thuringiensis* subespecie aizawai, *Bacillus thuringiensis* subespecie kurstaki, *Bacillus thuringiensis* subespecie tenebrionis y proteínas vegetales BT: Cry1Ab, Cry1ac, Cry1Fa, Cry2Ab, mCry3A, Cry3Ab, Cry3Bb, Cry34/35Ab1.
- (12) Inhibidores de la fosforilación oxidativa, disruptores de ATP como, por ejemplo, diafenthiuron o compuestos de organoestaño, por ejemplo, azociclotina, cihexatina y óxido de fenbutatina o propargita o tetradifon.
- (13) Desacopladores de la fosforilación oxidativa mediante interrupción del gradiente de protones H como, por

ejemplo, clorfenapir, DNOC y sulfluramida.

(14) Antagonistas de los receptores nicotínicos de acetilcolina como, por ejemplo, bensultap, clorhidrato de cartap, tiociclám y tiosultap-sodio.

5 (15) Inhibidores de la biosíntesis de quitina, tipo 0, como, por ejemplo, bistrifluron, clorfluazuron, diflubenzuron, flucicloxuron, flufenoxuron, hexaflumuron, lufenuron, novaluron, noviflumuron, teflubenzuron y triflumuron.

(16) Inhibidores de la biosíntesis de quitina, tipo 1, como, por ejemplo, buprofezina.

(17) Inhibidores de la muda (especialmente en dípteros, es decir, insectos dípteros) como, por ejemplo, ciromazina.

10 (18) Agonistas de los receptores de ecdisona como, por ejemplo, cromafenozida, halofenozida, metoxifenozida y tebufenozida.

(19) Agonistas octopaminérgicos como, por ejemplo, amitraz.

(20) Inhibidores del transporte de electrones en el complejo III como, por ejemplo, hidrametilnona o acequinocilo o fluacripirim.

15 (21) Inhibidores del transporte de electrones en el complejo I, por ejemplo, acaricidas de METI, por ejemplo, fenazaquina, fenpiroximato, pirimidifeno, piridaben, tebufenpirad y tolfenpirad o rotenona (Derris).

(22) Bloqueadores de los canales de sodio dependientes del voltaje, por ejemplo, indoxacarb o metaflumizona.

(23) Inhibidores de la acetil-CoA-carboxilasa como, por ejemplo, derivados de ácidos tetrónicos y tetrámicos, por ejemplo, espirodiclofeno, espiromesifeno y espirotetramato.

20 (24) Inhibidores del transporte de electrones en el complejo IV como, por ejemplo, fosfinas, por ejemplo, fosfuro de aluminio, fosfuro de calcio, fosfina y fosfuro de cinc o cianida.

(25) Inhibidores del transporte de electrones en el complejo II como, por ejemplo, cienopirafeno y ciflumetofeno

(28) Efectores de los receptores de rianodiana como, por ejemplo, diamidas, por ejemplo, clorantraniliprol, ciantraniliprol y flubendiamida.

25 Principios activos adicionales con mecanismo de acción desconocido o no claro como, por ejemplo, afidopiropen, afoxolaner, azadiractina, benclotiaz, benzoximato, bifenazato, broflanilida, bromopropilato, quinometionato, criolita, ciclaniliprol, cicloxaprid, cihalodiamida, dicloromezotiaz, dicofol, diflovidazin, flometoquin, fluensulfona, flufenerim, flufenoxistrobina, flufiprol, fluhexafon, fluopiram, fluralaner, fufenozida, guadipir, heptaflutrina, imidacloprid, iprodiona, lotilaner, meperflutrina, paichongding, piflubumida, piridililo, pirifluquinazon, piriminoestrobina, sarolaner, tetrametilflutrina, tetraniliprol, tetracloroantraniliprol, tiozafafeno, triflumezopirim y yodometano; preparados
30 adicionales basados en *Bacillus firmus* (I-1582, BioNeem, Votivo), así como los siguientes compuestos activos conocidos: 1-[2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfinil]fenil]-3-(trifluorometil)-1H-1,2,4-triazol-5-amina (conocida del documento de patente WO2006/043635), {1'-[(2E)-3-(4-clorofenil)prop-2-en-1-il]-5-fluoro-espiro[indol-3,4'-piperidin]-1(2H)-il]}(2-cloropiridin-4-il)metanona (conocida del documento de patente WO2003/106457), 2-cloro-N-[2-
35 {-(2E)-3-(4-clorofenil)prop-2-en-1-il]piperidin-4-il]-4-(trifluorometil)fenil]isonicotinamida (conocida del documento de patente WO2006/003494), 3-(2,5-dimetilfenil)-4-hidroxi-8-metoxi-1,8-diazaespiro[4.5]dec-3-en-2-ona (conocida del documento de patente WO2009/049851), carbonato de 3-(2,5-dimetilfenil)-8-metoxi-2-oxo-1,8-diazaespiro[4.5]dec-3-en-4-iletilo (conocido del documento de patente WO2009/049851), 4-(but-2-in-1-iloxi)-6-(3,5-dimetilpiperidin-1-il)-5-fluoropirimidina (conocida del documento de patente WO2004/099160), 4-(but-2-in-1-iloxi)-6-(3-clorofenil)pirimidina (conocida del documento de patente WO2003/076415), PF1364 (Reg. CAS N° 1204776-60-2), 2-[2-({[3-bromo-1-(3-cloropiridin-2-il)-1H-pirazol-5-il]carbonil}amino)-5-cloro-3-metilbenzoil]-2-metilhidracinacarboxilato de metilo (conocido del documento de patente WO2005/085216), 2-[2-({[3-bromo-1-(3-cloropiridin-2-il)-1H-pirazol-5-il]carbonil}amino)-5-ciano-3-metilbenzoil]-2-etilhidracinacarboxilato de metilo (conocido del documento de patente WO2005/085216), 2-[2-({[3-bromo-1-(3-cloropiridin-2-il)-1H-pirazol-5-il]carbonil}amino)-5-ciano-3-metilbenzoil]-2-metilhidracinacarboxilato de metilo (conocido del documento de patente WO2005/085216), 2-[3,5-dibromo-2-({[3-bromo-1-(3-cloropiridin-2-il)-1H-pirazol-5-il]carbonil}amino)benzoil]-2-etilhidracinacarboxilato de metilo (conocido del documento de patente WO2005/085216), N-[2-(5-amino-1,3,4-tiadiazol-2-il)-4-cloro-6-metilfenil]-3-bromo-1-(3-cloropiridin-2-il)-1H-pirazol-5-carboxamida (conocida del documento de patente CN102057925), 8-cloro-N-[(2-cloro-5-metoxifenil)sulfonyl]-6-(trifluorometil)imidazo[1,2-a]piridin-2-carboxamida (conocida del documento de patente WO2010/129500), 4-[5-(3,5-diclorofenil)-5-(trifluorometil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-2-metil-N-(1-oxidotietan-3-il)benzamida (conocida del documento de patente WO2009/080250), N-[(2E)-1-[(6-cloropiridin-3-il)metil]piridin-2(1H)-iliden]-2,2,2-trifluoroacetamida (conocida del documento de patente WO2012/029672), 1-[(2-cloro-1,3-tiazol-5-il)metil]-4-oxo-3-fenil-4H-pirido[1,2-a]pirimidin-1-ilo-2-olato (conocido del documento de patente WO2009/099929), 1-[(6-cloropiridin-3-il)metil]-4-oxo-3-fenil-4H-pirido[1,2-a]pirimidin-1-ilo-2-olato (conocido del documento de patente WO2009/099929), 4-(3-[2,6-dicloro-4-[(3,3-dicloroprop-2-en-1-il)oxi]fenoxi]propoxi)-2-metoxi-6-(trifluorometil)pirimidina (conocida del

documento de patente CN101337940), N-[2-(terc-butilcarbamoil)-4-cloro-6-metilfenil]-1-(3-cloropiridin-2-il)-3-(fluorometoxi)-1H-pirazol-5-carboxamida (conocida del documento de patente WO2008/134969, [2-(2,4-diclorofenil)-3-oxo-4-oxaesp[ro]4.5]dec-1-en-1-il]carbonato de butilo (conocido del documento de patente CN 102060818), 4-[5-(3,5-diclorofenil)-5-(trifluorometil)-4H-isoxazol-3-il]-N-[(Z)-metoxiiminometil]-2-metilbenzamida (conocida del documento de patente WO2007/026965), (3E)-3-[1-[(6-cloro-3-piridil)metil]-2-piridiliden]-1,1,1-trifluoropropan-2-ona (conocida del documento de patente WO2013/144213), N-(metilsulfonil)-6-[2-(piridin-3-il)-1,3-tiazol-5-il]piridin-2-carboxamida (conocida del documento de patente WO2012/000896), N-[3-(bencilcarbamoil)-4-clorofenil]-1-metil-3-(pentafluoroetil)-4-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-carboxamida (conocida del documento de patente WO2010/051926).

Fungicidas

10 Los principios activos especificados aquí con su "nombre común" son conocidos, por ejemplo, se describen en "Pesticide Manual" o en internet (por ejemplo, <http://www.alanwood.net/pesticides>).

15 Todos los componentes de mezcla fungicidas citados de las clases (1) a (15) pueden formar opcionalmente sales con bases o ácidos correspondientes, siempre y cuando estén presentes grupos funcionales adecuados. Además, para los componentes de mezcla fungicidas citados de las clases (1) a (15) también se incluyen formas tautómeras, siempre y cuando sea posible la tautomería.

1) Inhibidores de la biosíntesis de ergosterol, por ejemplo (1.01) aldimorf, (1.02) azaconazol, (1.03) bitertanol, (1.04) bromuconazol, (1.05) ciproconazol, (1.06) diclobutrazol, (1.07) difenoconazol, (1.08) diniconazol, (1.09) diniconazol-M, (1.10) dodemorf, (1.11) acetato de dodemorf, (1.12) epoxiconazol, (1.13) etaconazol, (1.14) fenarimol, (1.15) fenbuconazol, (1.16) fenhexamida, (1.17) fenpropidin, (1.18) fenpropimorf, (1.19) fluquinconazol, (1.20) flurprimidol, (1.21) flusilazol, (1.22) flutriafol, (1.23) furconazol, (1.24) furconazol-cis, (1.25) hexaconazol, (1.26) imazalilo, (1.27) sulfato de imazalilo, (1.28) imibenconazol, (1.29) ipconazol, (1.30) metconazol, (1.31) miclobutanilo, (1.32) naftifina, (1.33) nuarimol, (1.34) oxpoconazol, (1.35) paclobutrazol, (1.36) pefurazoato, (1.37) penconazol, (1.38) piperalina, (1.39) procloraz, (1.40) propiconazol, (1.41) protioconazol, (1.42) piributicarb, (1.43) pirifenox, (1.44) quinconazol, (1.45) simeconazol, (1.46) espiroxamina, (1.47) tebuconazol, (1.48) terbinafin, (1.49) tetraconazol, (1.50) triadimefon, (1.51) triadimenol, (1.52) tridemorf, (1.53) triflumizol, (1.54) triforin, (1.55) triticonazol, (1.56) uniconazol, (1.57) uniconazol-p, (1.58) viniconazol, (1.59) voriconazol, (1.60) 1-(4-clorofenil)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-il)cicloheptanol, (1.61) éster metílico del ácido 1-(2,2-dimetil-2,3-dihidro-1H-inden-1-il)-1H-imidazol-5-carboxílico, (1.62) N'-[5-(difluorometil)-2-metil-4-[3-(trimetilsilil)propoxil]fenil]-N-etil-N-metilimidofornamida, (1.63) N-etil-N-metil-N'-[2-metil-5-(trifluorometil)-4-[3-(trimetilsilil)propoxil]fenil]imidofornamida, (1.64) O-[1-(4-metoxifenoxi)-3,3-dimetilbutan-2-il]-1H-imidazol-1-carbotioato, (1.65) pirisoxazol, (1.66) 2-[[3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.67) 1-[[3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-1H-1,2,4-triazol-5-iltiocianato, (1.68) 5-(alilsulfanil)-1-[[3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-1H-1,2,4-triazol, (1.69) 2-[1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.70) 2-[[rel(2R,3S)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.71) 2-[[rel(2R,3R)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.72) 1-[[rel(2R,3S)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-1H-1,2,4-triazol-5-iltiocianato, (1.73) 1-[[rel(2R,3R)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-1H-1,2,4-triazol-5-iltiocianato, (1.74) 5-(alilsulfanil)-1-[[rel(2R,3S)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-1H-1,2,4-triazol, (1.75) 5-(alilsulfanil)-1-[[rel(2R,3R)-3-(2-clorofenil)-2-(2,4-difluorofenil)oxiran-2-il]metil]-1H-1,2,4-triazol, (1.76) 2-[(2S,4S,5S)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.77) 2-[(2R,4S,5S)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.78) 2-[(2R,4R,5R)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.79) 2-[(2S,4R,5R)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.80) 2-[(2S,4S,5R)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.81) 2-[(2R,4S,5R)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.82) 2-[(2R,4R,5S)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.83) 2-[(2S,4R,5S)-1-(2,4-diclorofenil)-5-hidroxi-2,6,6-trimetilheptan-4-il]-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-tiona, (1.84) 2-[4-(4-clorofenoxi)-2-(trifluorometil)fenil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)butan-2-ol, (1.85) 2-[4-(4-clorofenoxi)-2-(trifluorometil)fenil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)butan-2-ol, (1.86) 2-[4-(4-clorofenoxi)-2-(trifluorometil)fenil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)pentan-2-ol, (1.87) 2-[2-cloro-4-(4-clorofenoxi)fenil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)butan-2-ol, (1.88) 2-[2-cloro-4-(2,4-diclorofenoxi)fenil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)propan-2-ol, (1.89) (2R)-2-(1-clorociclopropil)-4-[(1R)-2,2-diclorociclopropil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)butan-2-ol, (1.90) (2R)-2-(1-clorociclopropil)-4-[(1S)-2,2-diclorociclopropil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)butan-2-ol, (1.91) (2S)-2-(1-clorociclopropil)-4-[(1S)-2,2-diclorociclopropil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)butan-2-ol, (1.92) (2S)-2-(1-clorociclopropil)-4-[(1R)-2,2-diclorociclopropil]-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)butan-2-ol, (1.93) (1S,2R,5R)-5-(4-clorobencil)-2-(clorometil)-2-metil-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)metil]ciclopentanol, (1.94) (1R,2S,5S)-5-(4-clorobencil)-2-(clorometil)-2-metil-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)metil]ciclopentanol, (1.95) 5-(4-clorobencil)-2-(clorometil)-2-metil-1-(1H-1,2,4-triazol-1-il)metil]ciclopentanol.

60 2) Inhibidores de la cadena respiratoria en el complejo I o II, por ejemplo (2.01) bixafeno, (2.02) boscalid, (2.03) carboxin, (2.04) diflumentorim, (2.05) fenfuram, (2.06) fluopiram, (2.07) flutolanilo, (2.08) fluxaproxad, (2.09) furametpir, (2.10) furmeciclox, (2.11) isopirazam (mezcla del racemato syn-epimérico 1RS,4SR,9RS y racemato

- anti-epimérico 1RS,4SR,9SR), (2.12) isopirazam (racemato anti-epimérico 1RS,4SR,9SR), (2.13) isopirazam (enantiómero anti-epimérico 1R,4S,9S), (2.14) isopirazam (enantiómero anti-epimérico 1S,4R,9R), (2.15) isopirazam (racemato syn-epimérico 1RS,4SR,9RS), (2.16) isopirazam (enantiómero syn-epimérico 1R,4S,9R), (2.17) isopirazam (enantiómero syn-epimérico 1S,4R,9S), (2.18) mepronilo, (2.19) oxicarboxin, (2.20) penflufeno, (2.21) pentiopirad, (2.22) sedaxano, (2.23) tifluzamida, (2.24) 1-metil-N-[2-(1,1,2,2-tetrafluoroetoxi)fenil]-3-(trifluorometil)-H-pirazol-4-carboxamida, (2.25) 3-(difluorometil)-1-metil-N-[2-(1,1,2,2-tetrafluoroetoxi)fenil]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.26) 3-(difluorometil)-N-[4-fluoro-2-(1,1,2,3,3,3-hexafluoropropoxi)fenil]-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.27) N-[1-(2,4-diclorofenil)-1-metoxipropan-2-il]-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.28) 5,8-difluoro-N-[2-(2-fluoro-4-{4-(trifluorometil)piridin-2-il}oxi)fenil]etil]quinazolin-4-amina, (2.29) benzovindiflupir, (2.30) N-[(1S,4R)-9-(diclorometileno)-1,2,3,4-tetrahidro-1,4-metanonaftalen-5-il]-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.31) N-[(1R,4S)-9-(diclorometileno)-1,2,3,4-tetrahidro-1,4-metanonaftalen-5-il]-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.32) 3-(difluorometil)-1-metil-N-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.33) 1,3,5-trimetil-N-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.34) 1-metil-3-(trifluorometil)-N-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.35) 1-metil-3-(trifluorometil)-N-[(3R)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.36) 1-metil-3-(trifluorometil)-N-[(3S)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.37) 3-(difluorometil)-1-metil-N-[(3S)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.38) 3-(difluorometil)-1-metil-N-[(3R)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.39) 1,3,5-trimetil-N-[(3R)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.40) 1,3,5-trimetil-N-[(3S)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.41) benodanilo, (2.42) 2-cloro-N-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)piridin-3-carboxamida, (2.43) isofetamida, (2.44) 1-metil-3-(trifluorometil)-N-[2'-(trifluorometil)bifenil-2-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.45) N-(4'-clorobifenil-2-il)-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.46) N-(2',4'-diclorobifenil-2-il)-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.47) 3-(difluorometil)-1-metil-N-[4'-(trifluorometil)bifenil-2-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.48) N-(2',5'-difluorobifenil-2-il)-1-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.49) 3-(difluorometil)-1-metil-N-[4'-(prop-1-in-1-il)bifenil-2-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.50) 5-fluoro-1,3-dimetil-N-[4'-(prop-1-in-1-il)bifenil-2-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.51) 2-cloro-N-[4'-(prop-1-in-1-il)bifenil-2-il]nicotinamida, (2.52) 3-(difluorometil)-N-[4'-(3,3-dimetilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.53) N-[4'-(3,3-dimetilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]-5-fluoro-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.54) 3-(difluorometil)-N-(4'-etinilbifenil-2-il)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.55) N-(4'-etinilbifenil-2-il)-5-fluoro-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.56) 2-cloro-N-(4'-etinilbifenil-2-il)nicotinamida, (2.57) 2-cloro-N-[4'-(3,3-dimetilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]nicotinamida, (2.58) 4-(difluorometil)-2-metil-N-[4'-(trifluorometil)bifenil-2-il]-1,3-tiazol-5-carboxamida, (2.59) 5-fluoro-N-[4'-(3-hidroxi-3-metilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.60) 2-cloro-N-[4'-(3-hidroxi-3-metilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]nicotinamida, (2.61) 3-(difluorometil)-N-[4'-(3-metoxi-3-metilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.62) 5-fluoro-N-[4'-(3-metoxi-3-metilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.63) 2-cloro-N-[4'-(3-metoxi-3-metilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]nicotinamida, (2.64) 1,3-dimetil-N-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.65) 1,3-dimetil-N-[(3R)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.66) 1,3-dimetil-N-[(3S)-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.67) 3-(difluorometil)-N-metoxi-1-metil-N-[1-(2,4,6-triclorofenil)propan-2-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.68) 3-(difluorometil)-N-(7-fluoro-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.69) 3-(difluorometil)-N-[(3R)-7-fluoro-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (2.70) 3-(difluorometil)-N-[(3S)-7-fluoro-1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il]-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida.
- 3) Inhibidores de la cadena respiratoria en el complejo III, por ejemplo (3.01) ametotradin, (3.02) amisulbrom, (3.03) azoxistrobina, (3.04) ciazofamid, (3.05) coumetoxistrobina, (3.06) coumoxistrobina, (3.07) dimoxistrobina, (3.08) enoxastrobina, (3.09) famoxadon, (3.10) fenamido, (3.11) flufenoxistrobina, (3.12) fluoxastrobina, (3.13) kresoxim-metilo, (3.14) metaminostrobin, (3.15) orisastrobina, (3.16) picoxistrobina, (3.17) piraclostrobina, (3.18) pirametostrobin, (3.19) piraxistrobina, (3.20) piribencarb, (3.21) triclopircarb, (3.22) trifloxistrobina, (3.23) (2E)-2-(2-[[6-(3-cloro-2-metilfenoxi)-5-fluoropirimidin-4-il]oxi]fenil)-2-(metoxiimino)-N-metilacetamida, (3.24) (2E)-2-(metoxiimino)-N-metil-2-(2-[[[(1E)-1-[3-(trifluorometil)fenil]etiliden]amino]oxi]metil]fenil]acetamida, (3.25) (2E)-2-(metoxiimino)-N-metil-2-[2-[(E)-{[(1-[3-(trifluorometil)fenil]etoxi]imino]metil]fenil]acetamida, (3.26) (2E)-2-[2-[[[(1E)-1-(3-[[[(E)-1-fluoro-2-fenilvinil]oxi]fenil]etiliden]amino]oxi]metil]fenil]-2-(metoxiimino)-N-metilacetamida, (3.27) fenaminostrobin, (3.28) 5-metoxi-2-metil-4-(2-[[[(1E)-1-[3-(trifluorometil)fenil]etiliden]amino]oxi]metil]fenil)-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-ona, (3.29) éster metílico de ácido (2E)-2-[2-[[[ciclopropil[(4-metoxifenil)imino]metil]sulfanil]metil]fenil]-3-metoxiacrílico, (3.30) N-(3-etil-3,5,5-trimetilciclohexil)-3-formamido-2-hidroxibenzamida, (3.31) 2-[2-[(2,5-dimetilfenoxi)metil]fenil]-2-metoxi-N-metilacetamida, (3.32) 2-[2-[(2,5-dimetilfenoxi)metil]fenil]-2-metoxi-N-metilacetamida, (3.33) (2E,3Z)-5-[[1-(4-clorofenil)-1H-pirazol-3-il]oxi]-2-(metoxiimino)-N,3-dimetilpent-3-enamida.
- 4) Inhibidores de la mitosis y de la división celular, por ejemplo (4.01) benomilo, (4.02) carbendazim, (4.03) clorfenazol, (4.04) diethofencarb, (4.05) etaboxam, (4.06) fluopicolida, (4.07) fuberidazol, (4.08) pencicuron, (4.09) tiabendazol, (4.10) tiofanato-metilo, (4.11) tiofanato, (4.12) zoxamida, (4.13) 5-cloro-7-(4-metilpiperidin-1-il)-6-(2,4,6-trifluorofenil)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina, (4.14) 3-cloro-5-(6-cloropiridin-3-il)-6-metil-4-(2,4,6-trifluorofenil)piridazina.

- 5) Compuestos que son capaces de atacar en múltiples sitios, por ejemplo (5.01) mezcla de Burdeos, (5.02) captafol, (5.03) captan, (5.04) clorotalonilo, (5.05) hidróxido de cobre, (5.06) naftenato de cobre, (5.07) óxido de cobre, (5.08) oxiclورو de cobre, (5.09) sulfato de cobre (2+), (5.10) diclofluanid, (5.11) ditianon, (5.12) dodina, (5.13) base libre de dodina, (5.14) ferbam, (5.15) fluorofolpet, (5.16) folpet, (5.17) guazatina, (5.18) acetato de guazatina, (5.19) iminoctadina, (5.20) albesilato de iminoctadina, (5.21) triacetato de iminoctadina, (5.22) mancofre, (5.23) mancozeb, (5.24) maneb, (5.25) metiram, (5.26) metiram cinc, (5.27) oxina-cobre, (5.28) propamidina, (5.29) propineb, (5.30) azufre y preparaciones de azufre que incluyen polisulfuro de calcio, (5.31) tiram, (5.32) tolilfluanid, (5.33) zineb, (5.34) ziram, (5.35) anilazina.
- 6) Compuestos que son capaces de inducir una reacción de defensa del hospedador, por ejemplo (6.01) acibenzolar-S-metilo, (6.02) isotianilo, (6.03) probenazol, (6.04) tiadinilo, (6.05) laminarina.
- 7) Inhibidores de la biosíntesis de aminoácidos y/o de proteínas, por ejemplo (7.01) andoprim, (7.02) blastidina-S, (7.03) ciprodinilo, (7.04) kasugamicina, (7.05) clorhidrato de kasugamicina hidratado, (7.06) mepanipirim, (7.07) pirimetanilo, (7.08) 3-(5-fluoro-3,3,4,4-tetrametil-3,4-dihidroisouquinolin-1-il)quinolina, (7.09) oxitetraciclina, (7.10) estreptomycin.
- 8) Inhibidores de la producción de ATP, por ejemplo (8.01) acetato de fentina, (8.02) cloruro de fentina, (8.03) hidróxido de fentina, (8.04) siltiofam.
- 9) Inhibidores de la síntesis de pared celular, por ejemplo (9.01) bentiavalicarb, (9.02) dimetomorf, (9.03) flumorf, (9.04) iprovalicarb, (9.05) mandipropamida, (9.06) polioxinas, (9.07) polioxorim, (9.08) validamicina A, (9.09) valifenalato, (9.10) polioxina B, (9.11) (2E)-3-(4-terc-butilfenil)-3-(2-cloropiridin-4-il)-1-(morfolin-4-il)prop-2-en-1-ona, (9.12) (2Z)-3-(4-terc-butilfenil)-3-(2-cloropiridin-4-il)-1-(morfolin-4-il)prop-2-en-1-ona.
- 10) Inhibidores de la síntesis de lípidos y membranas, por ejemplo (10.01) bifenilo, (10.02) cloroneb, (10.03) dicloran, (10.04) edifenfos, (10.05) etridiazol, (10.06) yodocarb, (10.07) iprobenfos, (10.08) isotriolano, (10.09) propamocarb, (10.10) clorhidrato de propamocarb, (10.11) protiocarb, (10.12) pirazofos, (10.13) quintozeno, (10.14) tecnazeno, (10.15) tolclofos-metilo.
- 11) Inhibidores de la biosíntesis de melanina, por ejemplo (11.01) carpropamida, (11.02) diclocimet, (11.03) fenoxanilo, (11.04) ftaluro, (11.05) piroquilon, (11.06) triciclazol, (11.07) {3-metil-1-[(4-metilbenzoil)amino]butan-2-il}carbamato de 2,2,2-trifluoroetilo.
- 12) Inhibidores de la síntesis de ácidos nucleicos, por ejemplo (12.01) benalaxilo, (12.02) benalaxilo-M (kiralaxilo), (12.03) bupirimato, (12.04) clozilacon, (12.05) dimetirimol, (12.06) etirimol, (12.07) furalaxilo, (12.08) himexazol, (12.09) metalaxilo, (12.10) metalaxilo-M (mefenoxam), (12.11) ofurace, (12.12) oxadixilo, (12.13) ácido oxolínico, (12.14) octilinona.
- 13) Inhibidores de la transducción de señales, por ejemplo (13.01) clozolinato, (13.02) fenciclonilo, (13.03) fludioxonilo, (13.04) iprodiona, (13.05) procimidona, (13.06) quinoxifeno, (13.07) vinclozolina, (13.08) proquinazid.
- 14) Compuestos que pueden actuar de desacopladores, por ejemplo (14.01) binapacril, (14.02) dinocap, (14.03) ferimzona, (14.04) fluazinam, (14.05) meptildinocap.
- 15) Compuestos adicionales, por ejemplo (15.001) bentiazol, (15.002) betoxazina, (15.003) capsimicina, (15.004) carvona, (15.005) quinometionato, (15.006) piriufenona (clazafenona), (15.007) cufraneb, (15.008) ciflufenamid, (15.009) cimoxanilo, (15.010) ciprosulfamida, (15.011) dazomet, (15.012) debacarb, (15.013) diclorofeno, (15.014) diclomezin, (15.015) difenzoquat, (15.016) metilsulfato de difenzoquat, (15.017) difenilamina, (15.018) Ecomate, (15.019) fenpirazamina, (15.020) flumetover, (15.021) fluoroimida, (15.022) flusulfamida, (15.023) flutianilo, (15.024) fosetilo-aluminio, (15.025) fosetilo-calcio, (15.026) fosetilo-sodio, (15.027) hexaclorobenceno, (15.028) irumamicina, (15.029) metasulfocarb, (15.030) isotiocianato de metilo, (15.031) metrafenona, (15.032) mildiomicina, (15.033) natamicina, (15.034) dimetilditiocarbamato de níquel, (15.035) nitrotal-isopropilo, (15.036) oxamocarb, (15.037) oxifentiína, (15.038) pentaclorofenol y sales, (15.039) fenotrina, (15.040) ácido fosforoso y sales del mismo, (15.041) propamocarb-fosetilato, (15.042) propanosin-sodio, (15.043) pirimorf, (15.044) pirrolnitrin, (15.045) tebufloquin, (15.046) tecloftalam, (15.047) tolnifanid, (15.048) triazóxido, (15.049) triclamid, (15.050) zarilamid, (15.051) éster (3S,6S,7R,8R)-8-bencil-3-[[{3-[(isobutiriloxi)metoxi]-4-metoxipiridin-2-il}carbonil)amino]-6-metil-4,9-dioxo-1,5-dioxonan-7-ilico de ácido 2-metilpropanoico, (15.052) 1-(4-{4-[(5R)-5-(2,6-difluorofenil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]etanona, (15.053) 1-(4-{4-[(5S)-5-(2,6-difluorofenil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]etanona, (15.054) oxatiapiprolina, (15.055) éster 1-(4-metoxifenoxi)-3,3-dimetilbutan-2-ilico de ácido 1H-imidazol-1-carboxílico, (15.056) 2,3,5,6-tetracloro-4-(metilsulfonil)piridina, (15.057) 2,3-dibutil-6-clorotieno[2,3-d]pirimidin-4(3H)-ona, (15.058) 2,6-dimetil-1H,5H-[1,4]ditiino[2,3-c:5,6-d]dipirrol-1,3,5,7(2H,6H)-tetrona, (15.059) 2-[5-metil-3-(trifluorometil)-H-pirazol-1-il]-1-(4-{4-[(5R)-5-fenil-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)etanona, (15.060) 2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-(4-{4-[(5S)-5-fenil-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)etanona, (15.061) 2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-{4-[4-(5-fenil-4,5-dihidro-1,2-

oxazol-3-il)-1,3-tiazol-2-il]piperidin-1-il]etanona, (15.062) 2-butoxi-6-yodo-3-propil-4H-cromen-4-ona, (15.063) 2-cloro-5-[2-cloro-1-(2,6-difluoro-4-metoxifenil)-4-metil-1H-imidazol-5-il]piridina, (15.064) 2-fenilfenol y sales, (15.065) 3-(4,4,5-trifluoro-3,3-dimetil-3,4-dihidroisoquinolin-1-il)quinolina, (15.066) 3,4,5-tricloropiridin-2,6-dicarbonitrilo, (15.067) 3-cloro-5-(4-clorofenil)-4-(2,6-difluorofenil)-6-metilpiridazina, (15.068) 4-(4-clorofenil)-5-(2,6-difluorofenil)-3,6-dimetilpiridazina, (15.069) 5-amino-1,3,4-tiadiazol-2-tiol, (15.070) 5-cloro-N'-fenil-N'-(prop-2-in-1-il)tiofeno-2-sulfonohidrazida, (15.071) 5-fluoro-2-[[4-fluorobencil]oxi]pirimidin-4-amina, (15.072) 5-fluoro-2-[[4-metilbencil]oxi]pirimidin-4-amina, (15.073) 5-metil-6-octil[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-amina, (15.074) éster etílico de ácido (2Z)-3-amino-2-ciano-3-fenilacrilico, (15.075) N'-(4-[[3-(4-clorobencil)-1,2,4-tiadiazol-5-il]oxi]-2,5-dimetilfenil)-N-etil-N-metilimidoformamida, (15.076) N-(4-clorobencil)-3-[3-metoxi-4-(prop-2-in-1-iloxi)fenil]propanamida, (15.077) N-[(4-clorofenil)(ciano)metil]-3-[3-metoxi-4-(prop-2-in-1-iloxi)fenil]propanamida, (15.078) N-[(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)metil]-2,4-dicloronicotinamida, (15.079) N-[1-(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)etil]-2,4-dicloronicotinamida, (15.080) N-[1-(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)etil]-2-fluoro-4-yodonicotinamida, (15.081) N-{{(E)-[(ciclopropilmetoxi)imino][6-(difluorometoxi)-2,3-difluorofenil]metil}-2-fenilacetamida, (15.082) N-{{(Z)-[(ciclopropilmetoxi)imino][6-(difluorometoxi)-2,3-difluorofenil]metil}-2-fenilacetamida, (15.083) N'-4-[(3-terc-butil-4-ciano-1,2-tiazol-5-il)oxi]-2-cloro-5-metilfenil)-N-etil-N-metilimidoformamida, (15.084) N-metil-2-(1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]piperidin-4-il)-N-(1,2,3,4-tetrahidronaftalin-1-il)-1,3-tiazol-4-carboxamida, (15.085) N-metil-2-(1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]piperidin-4-il)-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahidronaftalin-1-il]-1,3-tiazol-4-carboxamida, (15.086) N-metil-2-(1-[[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil]piperidin-4-il)-N-[(1S)-1,2,3,4-tetrahidronaftalin-1-il]-1,3-tiazol-4-carboxamida, (15.087) éster pentílico de ácido {6-[[[(1-metil-1H-tetrazol-5-il)(fenil)metilen]amino]oxi]metil]piridin-2-il}carbámico, (15.088) ácido fenazina-1-carboxílico, (15.089) quinolin-8-ol, (15.090) sulfato de quinolin-8-ol (2:1), (15.091) éster terc-butílico de ácido {6-[[[(1-metil-1H-tetrazol-5-il)(fenil)metilen]amino]oxi]metil]piridin-2-il}carbámico, (15.092) (5-bromo-2-metoxi-4-metilpiridin-3-il)(2,3,4-trimetoxi-6-metilfenil)metanona, (15.093) N-[2-(4-[[3-(4-clorofenil)prop-2-in-1-il]oxi]-3-metoxifenil)etil]-N2-(metilsulfonil)valinamida, (15.094) ácido 4-oxo-4-[(2-feniletíl)amino]butanoico, (15.095) éster but-3-in-1-ilico de ácido {6-[[[(Z)-(1-metil-1H-tetrazol-5-il)(fenil)metilen]amino]oxi]metil]piridin-2-il}carbámico, (15.096) 4-amino-5-fluoropirimidin-2-ol (forma tautómera: 4-amino-5-fluoropirimidin-2(1H)-ona), (15.097) 3,4,5-trihidroxibenzoato de propilo, (15.098) [3-(4-cloro-2-fluorofenil)-5-(2,4-difluorofenil)-1,2-oxazol-4-il](piridin-3-il)metanol, (15.099) (S)-[3-(4-cloro-2-fluorofenil)-5-(2,4-difluorofenil)-1,2-oxazol-4-il](piridin-3-il)metanol, (15.100) (R)-[3-(4-cloro-2-fluorofenil)-5-(2,4-difluorofenil)-1,2-oxazol-4-il](piridin-3-il)metanol, (15.101) 2-fluoro-6-(trifluorometil)-N-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)benzamida, (15.102) 2-(6-bencilpiridin-2-il)quinazolina, (15.103) 2-[6-(3-fluoro-4-metoxifenil)-5-metilpiridin-2-il]quinazolina, (15.104) 3-(4,4-difluoro-3,3-dimetil-3,4-dihidroisoquinolin-1-il)quinolina, (15.105) ácido abscísico, (15.106) N'-[5-bromo-6-(2,3-dihidro-1H-inden-2-iloxi)-2-metilpiridin-3-il]-N-etil-N-metilimidoformamida, (15.107) N'-[5-bromo-6-[1-(3,5-difluorofenil)etoxi]-2-metilpiridin-3-il]-N-etil-N-metilimidoformamida, (15.108) N'-[5-bromo-6-[(1R)-1-(3,5-difluorofenil)etoxi]-2-metilpiridin-3-il]-N-etil-N-metilimidoformamida, (15.109) N'-[5-bromo-6-[(1S)-1-(3,5-difluorofenil)etoxi]-2-metilpiridin-3-il]-N-etil-N-metilimidoformamida, (15.110) N'-[5-bromo-6-[(cis-4-isopropilciclohexil)oxi]-2-metilpiridin-3-il]-N-etil-N-metilimidoformamida, (15.111) N'-[5-bromo-6-[(trans-4-isopropilciclohexil)oxi]-2-metilpiridin-3-il]-N-etil-N-metilimidoformamida, (15.112) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-N-(2-isopropilbencil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.113) N-ciclopropil-N-(2-ciclopropilbencil)-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.114) N-(2-terc-butilbencil)-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.115) N-(5-cloro-2-etilbencil)-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.116) N-(5-cloro-2-isopropilbencil)-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.117) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-N-(2-etil-5-fluorobencil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.118) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-N-(5-fluoro-2-isopropilbencil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.119) N-ciclopropil-N-(2-ciclopropil-5-fluorobencil)-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.120) N-(2-ciclopentil-5-fluorobencil)-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.121) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-N-(2-fluoro-6-isopropilbencil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.122) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-N-(2-etil-5-metilbencil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.123) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-N-(2-isopropil-5-metilbencil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.124) N-ciclopropil-N-(2-ciclopropil-5-metilbencil)-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.125) N-(2-terc-butil-5-metilbencil)-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.126) N-[5-cloro-2-(trifluorometil)bencil]-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.127) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-N-[5-metil-2-(trifluorometil)bencil]-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.128) N-[2-cloro-6-(trifluorometil)bencil]-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.129) N-[3-cloro-2-fluoro-6-(trifluorometil)bencil]-N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.130) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-N-(2-etil-4,5-dimetilbencil)-5-fluoro-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.131) N-ciclopropil-3-(difluorometil)-5-fluoro-N-(2-isopropilbencil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, (15.132) N'-(2,5-dimetil-4-fenoxifenil)-N-etil-N-metilimidoformamida, (15.133) N'-4-[[4,5-dicloro-1,3-tiazol-2-il]oxi]-2,5-dimetilfenil]-N-etil-N-metilimidoformamida, (15.134) N-(4-cloro-2,6-difluorofenil)-4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (15.135) 9-fluoro-2,2-dimetil-5-(quinolin-3-il)-2,3-dihidro-1,4-benzoxazepina, (15.136) 2-[2-fluoro-6-[[8-fluoro-2-metilquinolin-3-il]oxi]fenil]propan-2-ol, (15.137) 2-[2-[[7,8-difluoro-2-metilquinolin-3-il]oxi]-6-fluorofenil]propan-2-ol, (15.138) 4-(2-cloro-4-fluorofenil)-N-(2-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (15.139) 4-(2-cloro-4-fluorofenil)-N-(2,6-difluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (15.140) 4-(2-cloro-4-fluorofenil)-N-(2-cloro-6-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (15.141) 4-(2-bromo-4-fluorofenil)-N-(2-cloro-6-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (15.142) N-(2-bromo-6-fluorofenil)-4-(2-cloro-4-fluorofenil)-

- 1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (15.143) 4-(2-bromo-4-fluorofenil)-N-(2-bromofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (15.144) 4-(2-bromo-4-fluorofenil)-N-(2-bromo-6-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (15.145) 4-(2-bromo-4-fluorofenil)-N-(2-clorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (15.146) N-(2-bromofenil)-4-(2-cloro-4-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (15.147) 4-(2-cloro-4-fluorofenil)-N-(2-clorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (15.148) 4-(2-bromo-4-fluorofenil)-N-(2,6-difluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (15.149) 4-(2-bromo-4-fluorofenil)-N-(2-fluorofenil)-1,3-dimetil-1H-pirazol-5-amina, (15.150) N'-(4-{3-[(difluorometil)sulfanil]fenoxi}-2,5-dimetilfenil)-N-etil-N-metilimidoforamida, (15.151) N'-(2,5-dimetil-4-{3-[(1,1,2,2-tetrafluoroetil)sulfanil]fenoxi}fenil)-N-etil-N-metilimidoforamida, (15.152) N'-(2,5-dimetil-4-{3-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfanil]fenoxi}fenil)-N-etil-N-metilimidoforamida, (15.153) N'-(2,5-dimetil-4-{3-[(2,2,3,3-tetrafluoropropil)sulfanil]fenoxi}fenil)-N-etil-N-metilimidoforamida, (15.154) N'-(2,5-dimetil-4-{3-[(pentafluoroetil)sulfanil]fenoxi}fenil)-N-etil-N-metilimidoforamida, (15.155) N'-(4-{3-(difluorometoxi)fenil}sulfanil)-2,5-dimetilfenil)-N-etil-N-metilimidoforamida, (15.156) N'-(2,5-dimetil-4-{3-(1,1,2,2-tetrafluoroetoxi)fenil}sulfanil}fenil)-N-etil-N-metilimidoforamida, (15.157) N'-(2,5-dimetil-4-{3-(2,2,2-trifluoroetoxi)fenil}sulfanil}fenil)-N-etil-N-metilimidoforamida, (15.158) N'-(2,5-dimetil-4-{3-(2,2,3,3-tetrafluoropropoxi)fenil}sulfanil}fenil)-N-etil-N-metilimidoforamida, (15.159) N'-(2,5-dimetil-4-{3-(pentafluoroetoxi)fenil}sulfanil}fenil)-N-etil-N-metilimidoforamida, (15.160) 2-[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-[4-(4-{5-[2-(prop-2-in-1-iloxi)fenil]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il)piperidin-1-il]etanona, (15.161) 2-[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-[4-(4-{5-[2-fluoro-6-(prop-2-in-1-iloxi)fenil]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il)piperidin-1-il]etanona, (15.162) 2-[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-[4-(4-{5-[2-cloro-6-(prop-2-in-1-iloxi)fenil]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il)piperidin-1-il]etanona, (15.163) metanosulfonato de 2-{3-[2-(1-{[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil}piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-il]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-il}-3-clorofenilo, (15.164) metanosulfonato de 2-{3-[2-(1-{[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil}piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-il]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-il}-3-clorofenilo, (15.165) 2-[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-[4-(4-{(5S)-5-[2-(prop-2-in-1-iloxi)fenil]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il)piperidin-1-il]etanona, (15.166) 2-[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-[4-(4-{(5R)-5-[2-(prop-2-in-1-iloxi)fenil]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il)piperidin-1-il]etanona, (15.167) 2-[3,5-bis(difluoro-metil)-1H-pirazol-1-il]-1-[4-(4-{(5S)-5-[2-fluoro-6-(prop-2-in-1-iloxi)fenil]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il)piperidin-1-il]etanona, (15.168) 2-[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-[4-(4-{(5R)-5-[2-fluoro-6-(prop-2-in-1-iloxi)fenil]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il)piperidin-1-il]etanona, (15.169) 2-[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-[4-(4-{(5S)-5-[2-cloro-6-(prop-2-in-1-iloxi)fenil]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il)piperidin-1-il]etanona, (15.170) 2-[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-[4-(4-{(5R)-5-[2-cloro-6-(prop-2-in-1-iloxi)fenil]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il)piperidin-1-il]etanona, (15.171) metanosulfonato de 2-((5S)-3-[2-(1-{[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil}piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-il]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-il]fenilo, (15.172) metanosulfonato de 2-((5R)-3-[2-(1-{[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil}piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-il]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-il]fenilo, (15.173) metanosulfonato de 2-((5S)-3-[2-(1-{[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil}piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-il]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-il]-3-clorofenilo, (15.174) metanosulfonato de 2-((5R)-3-[2-(1-{[3,5-bis(difluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil}piperidin-4-il)-1,3-tiazol-4-il]-4,5-dihidro-1,2-oxazol-5-il]-3-clorofenilo.

Agentes de control de plagas biológicas como componentes de mezcla

Los compuestos de la fórmula (I) se pueden combinar con agentes de control de plagas biológicas.

- 40 Los agentes de control de plagas biológicas comprenden especialmente bacterias, hongos, levaduras, extractos vegetales y aquellos productos que se formaron por microorganismos, que incluyen proteínas y metabolitos secundarios.

Los agentes de control de plagas biológicas comprenden bacterias como bacterias formadoras de colonias, bacterias colonizadoras de las raíces y bacterias que actúan como insecticidas biológicos, fungicidas o nematocidas.

- 45 Ejemplos de dichas bacterias que se utilizan o se pueden usar como agentes de control de plagas biológicas son: *Bacillus amyloliquefaciens*, cepa FZB42 (DSM 231179), o *Bacillus cereus*, especialmente *B. cereus* cepa CNCM I-1562 o *Bacillus firmus*, cepa I-1582 (número de acceso CNCM I-1582) o *Bacillus pumilus*, especialmente la cepa GB34 (Nº de acceso ATCC 700814) y la cepa QST2808 (Nº de acceso NRRL B-30087), o *Bacillus subtilis*, especialmente la cepa GB03 (Nº de acceso ATCC SD-1397), o *Bacillus subtilis* cepa QST713 (Nº de acceso NRRL B-21661) o *Bacillus subtilis* cepa OST 30002 (Nº de acceso NRRL B-50421) *Bacillus thuringiensis*, especialmente *B. thuringiensis* subespecie *israelensis* (serotipo H-14), cepa AM65-52 (Nº de acceso ATCC 1276), o *B. thuringiensis subsp. aizawai*, especialmente la cepa ABTS-1857 (SD-1372), o *B. thuringiensis subsp. kurstaki* cepa HD-1, o *B. thuringiensis subsp. tenebrionis* cepa NB 176 (SD-5428), *Pasteuria penetrans*, *Pasteuria spp.* (nematodo de *Rotylenchulus reniformis*)-PR3 (número de acceso ATCC SD-5834), *Streptomyces microflavus* cepa AQ6121 (= QRD 31.013, NRRL B-50550), *Streptomyces galbus* cepa AQ 6047 (número de acceso NRRL 30232).

Ejemplos de hongos y levaduras que se utilizan o se pueden usar como agentes de control de plagas biológicas son: *Beauveria bassiana*, especialmente la cepa ATCC 74040, *Coniothyrium minitans*, especialmente la cepa CON/M/91-8 (Nº de acceso DSM-9660), *Lecanicillium spp.*, especialmente la cepa HRO LEC 12, *Lecanicillium lecanii* (anteriormente conocido como *Verticillium lecanii*), especialmente la cepa KV01, *Metarhizium anisopliae*, especialmente la cepa F52 (DSM3884/ ATCC 90448), *Metschnikowia fructicola*, especialmente la cepa NRRL Y-30752, *Paecilomyces fumosoroseus* (nuevo: *Isaria fumosorosea*), especialmente la cepa IFPC 200613, o cepa

60

Apopka 97 (Nº de acceso ATCC 20874), *Paecilomyces lilacinus*, especialmente *P. lilacinus* cepa 251 (AGAL 89/030550), *Talaromyces flavus*, especialmente la cepa V117b, *Trichoderma atroviride*, especialmente la cepa SC1 (número de acceso CBS 122089), *Trichoderma harzianum*, especialmente *T. harzianum rifai T39*. (número de acceso CNCM I-952).

5 Ejemplos de virus que se utilizan o se pueden usar como agentes de control de plagas biológicos son:
Granulovirus (GV) de *Adoxophyes orana* (capua de los frutales), granulovirus (GV) de *Cydia pomonella* (polilla del manzano), virus de la poliedrosis nuclear (NPV) de *Helicoverpa armigera* (gusano bellotero del algodón), mNPV de *Spodoptera exigua* (rosquilla verde), mNPV de *Spodoptera frugiperda* (gusano cogollero), NPV de *Spodoptera littoralis* (gusano del algodón africano).

10 También comprenden bacterias y hongos que se añaden como 'inoculante' a plantas o partes de planta u órganos de la planta y, debido a sus propiedades especiales, fomentan el crecimiento de la planta y la salud de la planta. Como ejemplos se mencionan:

Agrobacterium spp., *Azorhizobium caulinodans*, *Azospirillum spp.*, *Azotobacter spp.*, *Bradyrhizobium spp.*, *Burkholderia spp.*, especialmente *Burkholderia cepacia* (anteriormente conocida como *Pseudomonas cepacia*),
15 *Gigaspora spp.*, o *Gigaspora monosporum*, *Glomus spp.*, *Laccaria spp.*, *Lactobacillus buchneri*, *Paraglomus spp.*, *Pisolithus tinctorus*, *Pseudomonas spp.*, *Rhizobium spp.*, especialmente *Rhizobium trifolii*, *Rhizopogon spp.*, *Scleroderma spp.*, *Suillus spp.*, *Streptomyces spp.*.

Ejemplos de extractos de plantas y aquellos productos que se formaron por microorganismos, que incluyen proteínas y metabolitos secundarios, que se utilizan o se pueden usar como agentes de control de plagas biológicos,
20 son:

Allium sativum, *Artemisia absinthium*, azadiractina, Biokeeper WP, *Cassia nigricans*, *Celastrus angulatus*, *Chenopodium anthelminticum*, quitina, Armour-Zen, *Dryopteris filix-mas*, *Equisetum arvense*, Fortune Aza, Fungastop, Heads Up (extracto de saponina de *Chenopodium quinoa*), piretrum/piretrinas, Quassia amara, *Quercus*, Quillaja, Regalia, "Requiem™ Insecticide", rotenona, riania/rianodina, *Symphytum officinale*, *Tanacetum vulgare*,
25 Thymol, Triact 70, TriCon, *Tropaeolum majus*, *Urtica dioica*, Veratrin, *Viscum album*, extracto de Brassicaceae, especialmente polvo de colza o de mostaza.

Protectores como componentes de mezcla

Los compuestos de la fórmula (I) se pueden combinar con protectores, como, por ejemplo, benoxacor, cloquintocet (-
30 mexilo), ciometrinilo, ciprosumfamida, dicloromid, fencloroazol (-etilo), fenclorim, flurazol, fluxofenim, furilazol, isoxadifeno (-etilo), mefenpir (-dietilo), anhídridos naftálicos, oxabetrinilo, 2-metoxi-N-([4-[(metilcarbamoil)amino]fenil]sulfonil)benzamida (CAS 129531-12-0), 4-(dicloroacetil)-1-oxa-4-azaespiro[4.5]decano (CAS 71526-07-3), 2,2,5-trimetil-3-(dicloroacetil)-1,3-oxazolidina (CAS 52836-31-4).

Plantas y partes de planta

Se pueden tratar todas las plantas y partes de planta. Por plantas se entiende a este respecto todas las plantas y
35 poblaciones de plantas, como plantas silvestres deseadas y no deseadas o plantas de cultivo (incluyendo plantas de cultivo que existen de forma natural), por ejemplo cereales (trigo, arroz, triticale, cebada, centeno, avena), maíz, soja, patata, remolacha azucarera, caña de azúcar, tomates, guisantes y otras especies de verduras, algodón, tabaco, colza, así como plantas frutales (con las frutas manzanas, peras, frutas cítricas y uvas). Las plantas de cultivo pueden ser plantas que se pueden obtener por procedimientos de cultivo y optimización convencionales o por
40 procedimientos biotecnológicos y de ingeniería genética, o combinaciones de estos procedimientos, incluidas las plantas transgénicas e incluidas las variedades de plantas protegibles o no protegibles por los derechos de protección de plantas. Por partes de planta se entenderá todas las partes y órganos aéreos y subterráneos de las plantas como brote, hoja, flor y raíz, en donde a modo de ejemplo se citan hojas, acículas, tallos subterráneos, tallos aéreos, hojas, cuerpos fructíferos, frutos y semillas, así como raíces, tubérculos y rizomas. A las partes de la planta
45 también pertenece el material recogido, así como material de propagación vegetativo y generativo, por ejemplo, plantones, tubérculos, rizomas, esquejes y semillas.

El tratamiento de las plantas y las partes de planta con los compuestos de la fórmula (I) se realiza directamente o por acción sobre el entorno, hábitat o espacio de almacenamiento después de los procedimientos de tratamiento habituales, por ejemplo, mediante inmersión, espolvoreado, evaporación, nebulización, esparcido, pintado, inyección
50 y en el caso de material de propagación, especialmente en el caso de semillas, además por recubrimiento de una o varias capas.

Como ya se mencionó anteriormente, se pueden tratar todas las plantas y sus partes. En una forma de realización preferida, se tratan especies de plantas y variedades de plantas silvestres u obtenidas por procedimientos de cultivo biológico convencional como cruce o fusión de protoplastos, así como sus partes. En otra forma de realización preferida, se tratan plantas transgénicas y variedades de plantas que se obtuvieron por procedimientos de ingeniería genética, opcionalmente en combinación con procedimientos convencionales (organismos genéticamente modificados) y sus partes. El término "partes" o "partes de plantas" se explicó anteriormente. Se tratan con especial preferencia según la invención plantas de las variedades de plantas respectivamente habituales en el comercio o en

uso. Por variedades de plantas se entiende plantas con nuevas propiedades ("rasgos") que se cultivaron por cultivo convencional, por mutagénesis o por técnicas de ADN recombinante. Éstas pueden ser variedades cultivadas, variedades, biotipos y genotipos.

Plantas transgénicas, tratamiento de semillas y acontecimientos de integración

5 A las plantas o variedades cultivadas de plantas transgénicas (obtenidas por ingeniería genética) preferidas que se van a tratar pertenecen todas las plantas que se obtuvieron por la modificación de ingeniería genética del material genético, que confiere a estas plantas propiedades valiosas ventajosas especiales ("rasgos"). Los ejemplos de dichas propiedades son mejor crecimiento de la planta, elevada tolerancia a temperaturas altas o bajas, elevada tolerancia a la sequía o al contenido de sales en el agua o el suelo, elevado rendimiento de la floración, recogida facilitada, aceleración de la maduración, mayores rendimientos de recogida, mayor calidad y/o mayor valor nutritivo de los productos recogidos, mayor vida útil de almacenamiento y/o procesabilidad de los productos recogidos. Ejemplos adicionales y especialmente enfatizados de dichas propiedades son una elevada resistencia de las plantas a plagas animales y microbianas, como insectos, arácnidos, nematodos, ácaros, caracoles, causada, por ejemplo, por las toxinas que se forman en las plantas, especialmente aquellas que se generan por el material genético de *Bacillus thuringiensis* (por ejemplo, por los genes CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CrIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c Cry2Ab, Cry3Bb y CryIF, así como sus combinaciones) en las plantas, además de una elevada resistencia de las plantas a hongos, bacterias y/o virus patógenos para las plantas, causada, por ejemplo, por resistencia sistémica adquirida (SAR), sistemina, fitoalexinas, desencadenantes, así como genes de resistencia y proteínas y toxinas correspondientemente expresadas, así como una elevada tolerancia de las plantas a determinados principios activos herbicidas, por ejemplo imidazolinonas, sulfonilureas, glifosatos o fosfinotricina (por ejemplo, el gen "PAT"). Los genes que confieren las propiedades respectivamente deseadas ("rasgos") también pueden estar presentes en combinaciones entre sí en las plantas transgénicas. Como ejemplos de plantas transgénicas se mencionan las plantas de cultivo importantes, como cereales (trigo, arroz, triticale, cebada, centeno, avena), maíz, soja, patatas, remolacha azucarera, caña de azúcar, tomates, guisantes y otros tipos de verduras, algodón, tabaco, colza, así como plantas frutales (con las frutas manzanas, peras, frutas cítricas y uvas), enfatizándose especialmente maíz, soja, trigo, arroz, patatas, algodón, caña de azúcar, tabaco y colza. Como propiedades ("rasgos") se enfatizan especialmente la elevada resistencia de las plantas a insectos, arácnidos, nematodos y caracoles.

Tipo de tratamientos de fitoprotección

30 El tratamiento de las plantas y partes de planta con los compuestos de la fórmula (I) se realiza directamente o por acción sobre el entorno, hábitat o espacio de almacenamiento después de los procedimientos de tratamiento habituales, por ejemplo, mediante inmersión, pulverización, espolvoreado, riego, evaporación, espolvoreado, nebulización, esparcido, espumación, pintado, extensión, inyección, riego (rociado), riego por goteo y, en el caso de material de propagación, especialmente en el caso de semillas, además por desinfección en seco, desinfección en húmedo, desinfección en suspensión, incrustación, recubrimiento de una o varias capas, etc. Además, es posible aplicar los compuestos de la fórmula (I) según el procedimiento de volumen ultra-bajo o inyectar la misma forma de aplicación o el compuesto de la fórmula (I) en el suelo.

Un tratamiento directo preferido de las plantas es la aplicación foliar, es decir, los compuestos de la fórmula (I) se aplican sobre el follaje, en donde la frecuencia de tratamiento y la tasa de aplicación se deben ajustar al nivel de infestación de la plaga respectiva.

40 En el caso de compuestos sistémicamente activos, los compuestos de la fórmula (I) también acceden a las plantas por el sistema radicular. El tratamiento de las plantas se realiza entonces por acción de los compuestos de la fórmula (I) sobre el hábitat de las plantas. Esto puede ser, por ejemplo, por rociado, mezcla en la tierra o la disolución nutritiva, es decir, el sitio de las plantas (por ejemplo, suelo o sistemas hidropónicos) se impregna con una forma líquida de los compuestos de la fórmula (I), o por aplicación en la tierra, es decir, los compuestos de la fórmula (I) se introducen en forma sólida (por ejemplo, en forma de un gránulo) en el sitio de las plantas. En el caso de cultivos de arroz con cáscara, esto también puede ser por la administración del compuesto de la fórmula (I) en una forma de aplicación sólida (por ejemplo, como gránulo) en un arrozal inundado.

Tratamiento de semillas

50 Se conoce desde hace tiempo el combate de las plagas animales por el tratamiento de la semilla de plantas y es objeto de mejoras constantes. No obstante, en el tratamiento de la semilla surgen una serie de problemas que no siempre pueden resolverse satisfactoriamente. Así, es conveniente desarrollar procedimientos para la protección de la semilla y de la planta en germinación que haga innecesario, o al menos reduzca claramente, la aplicación adicional de agentes de control de plagas durante el almacenamiento, después de la siembra o después de la emergencia de las plantas. Es además deseable optimizar la cantidad de principio activo utilizado de manera que se proteja de la mejor forma posible la semilla y la planta en germinación de la infestación por plagas animales, sin, sin embargo, dañar la propia planta por el principio activo utilizado. Los procedimientos para el tratamiento de la semilla también deberán tener especialmente en cuenta las propiedades insecticidas o nematicidas intrínsecas de las plantas transgénicas resistentes o tolerantes a las plagas, para conseguir una protección óptima de la semilla y de la planta en germinación con un gasto mínimo de agentes de control de plagas.

En el presente documento también se describe especialmente un procedimiento para la protección de semilla y plantas en germinación de la infestación por plagas, tratando la semilla con uno de los compuestos de la fórmula (I). El procedimiento para la protección de semilla y plantas en germinación antes de la infestación por plagas comprende además un procedimiento en el que la semilla se trata al mismo tiempo en un proceso o uno detrás de otro con un compuesto de la fórmula (I) y componentes de mezcla. También comprende además un procedimiento en el que la semilla se trata en diferentes momentos con un compuesto de la fórmula (I) y componentes de mezcla.

H el uso de los compuestos de la fórmula (I) para el tratamiento de semilla para la protección de la semilla y de la planta resultante de la misma de plagas animales.

Se describe además semilla que se trató con un compuesto de fórmula (I) para la protección de plagas animales. También se describe semilla que se trató al mismo tiempo con un compuesto de la fórmula (I) y componentes de mezcla. Se describe además semilla que se trató en diferentes momentos con un compuesto de la fórmula (I) y componentes de mezcla. En el caso de semilla que se trató en diferentes momentos con un compuesto de la fórmula (I) y componentes de mezcla, las sustancias individuales pueden estar contenidas en diferentes capas sobre la semilla. A este respecto, las capas que contienen un compuesto de la fórmula (I) y los componentes de mezcla pueden estar opcionalmente separadas por una capa intermedia. También se describe semilla en la que un compuesto de la fórmula (I) y los componentes de mezcla se aplican como constituyente de un recubrimiento o como capa adicional o capas adicionales, además de un recubrimiento.

Además, se describe semilla que después del tratamiento con un compuesto de la fórmula (I) se sometió a un procedimiento de recubrimiento con película para evitar la abrasión por polvo sobre la semilla.

Una de las ventajas encontradas cuando uno de los compuestos de la fórmula (I) actúa sistémicamente es que el tratamiento de la semilla no solo protege a la propia semilla de las plagas animales, sino también a las plantas resultantes de la misma después de la emergencia. De esta manera se puede suspender el tratamiento inmediato del cultivo en el momento de la siembra o poco después.

Se observa otra ventaja en que mediante el tratamiento de la semilla con un compuesto de la fórmula (I) se puede promover la germinación y la emergencia de la semilla tratada.

Asimismo, se considera ventajoso poder utilizar los compuestos de la fórmula (I), especialmente también en semilla transgénica.

Los compuestos de la fórmula (I) se pueden utilizar además en combinación con agentes de la tecnología de señalización, mediante lo cual tiene lugar una mejor colonización con simbioses como, por ejemplo, rizobios, micorrizas y/o bacterias u hongos endofíticos, y/o conduce a una fijación optimizada del nitrógeno.

Los compuestos de la fórmula (I) son adecuados para la protección de semilla de cualquier variedad cultivada de planta que se utiliza en la agricultura, en el invernadero, en bosques o en la jardinería. A este respecto se trata especialmente de semilla de cereales (por ejemplo, trigo, cebada, centeno, mijo y avena), maíz, algodón, soja, arroz, patatas, girasoles, café, tabaco, canola, colza, remolacha (por ejemplo, remolacha azucarera y remolacha forrajera), cacahuetes, verduras (por ejemplo, tomates, pepinos, judías, verduras crucíferas, cebollas y lechuga), plantas frutales, céspedes y plantas ornamentales. Es de particular importancia el tratamiento de la semilla de cereales (como trigo, cebada, centeno y avena), maíz, soja, algodón, canola, colza y arroz.

Como ya se mencionó anteriormente, también es de particular importancia el tratamiento de semilla transgénica con un compuesto de la fórmula (I). A este respecto se trata de la semilla de plantas que generalmente contienen al menos un gen heterólogo que controla la expresión de un polipéptido con propiedades especialmente insecticidas o nematocidas. A este respecto, los genes heterólogos en la semilla transgénica pueden proceder de microorganismos como *Bacillus*, *Rhizobium*, *Pseudomonas*, *Serratia*, *Trichoderma*, *Clavibacter*, *Glomus* o *Gliocladium*. La presente invención es especialmente adecuada para el tratamiento de semilla transgénica que contiene al menos un gen heterólogo que procede de *Bacillus* sp. A este respecto se trata con especial preferencia de un gen heterólogo que procede de *Bacillus thuringiensis*.

El compuesto de la fórmula (I) se puede aplicar sobre la semilla. La semilla se trata preferiblemente en un estado en el que es tan estable que no ocurre ningún daño durante el tratamiento. El tratamiento de la semilla puede tener lugar en general en cualquier momento entre la cosecha y la siembra. Normalmente se usa semilla que se separó de la planta y se liberó de mazorcas, cáscaras, tallos subterráneos, cáscaras, pelos o carne de los frutos. Así, por ejemplo, se puede usar semilla que se recogió, se limpió y se secó hasta un contenido de humedad que permite el almacenamiento. Alternativamente, también se puede usar semilla que después del secado se trató, por ejemplo, con agua y luego se volvió a secar, por ejemplo, acondicionamiento. En caso de semilla de arroz también es posible usar semilla que se hinchó previamente, por ejemplo en agua, hasta un estadio determinado (estadio de tórax en quilla), lo que conduce a una germinación mejorada y a una emergencia más uniforme.

En general, en el tratamiento de la semilla se debe tener en cuenta que la cantidad de compuesto de la fórmula (I) aplicado sobre la semilla y/o aditivos adicionales se elija de tal forma que la germinación de la semilla no se perjudique o dañe la planta resultante de la misma. Esto se debe tener en cuenta sobre todo en principios activos

que pueden mostrar efecto fitotóxicos a determinadas tasas de aplicación.

Los compuestos de la fórmula (I) se aplican generalmente en forma de una formulación adecuada sobre la semilla. El experto conoce formulaciones y procedimientos adecuados para el tratamiento de las semillas.

5 Los compuestos de la fórmula (I) se pueden convertir en las formulaciones de desinfectante habituales, como disoluciones, emulsiones, suspensiones, polvos, espumas, suspensiones u otras masas de recubrimiento para la semilla, así como formulaciones de ULV.

10 Estas formulaciones se preparan de una manera conocida mezclando los compuestos de la fórmula (I) con aditivos habituales como, por ejemplo, extensores habituales, así como disolventes o diluyentes, colorantes, humectantes, dispersantes, emulsionantes, antiespumantes, conservantes, espesantes secundarios, adhesivos, giberelinas y también agua.

Como colorantes que pueden estar contenidos en las formulaciones de desinfectante se consideran todos los colorantes habituales para dichos fines. A este respecto se pueden usar pigmentos tanto poco solubles en agua como también solubles en agua. Como ejemplos son de mencionar los colorantes conocidos con los nombres Rhodamin B, C.I. Pigment Red 112 y C.I. Solvent Red 1.

15 Como humectantes que pueden estar contenidos en las formulaciones de desinfectante se consideran todas las sustancias promotoras de la humectación habituales para la formulación de principios activos agroquímicos. Se pueden usar preferiblemente naftalenosulfonatos de alquilo, como naftalenosulfonatos de diisopropilo o diisobutilo.

20 Como dispersantes y/o emulsionantes que pueden estar contenidos en las formulaciones de desinfectante, se consideran todos los dispersantes no iónicos, aniónicos y catiónicos habituales para la formulación de principios activos agroquímicos. Se pueden usar preferiblemente dispersantes no iónicos o aniónicos o mezclas de dispersantes no iónicos o aniónicos. Como dispersantes no iónicos adecuados son de mencionar especialmente polímeros de bloque de óxido de etileno-óxido de propileno, poliglicol éter de alquilfenol, así como poliglicol éter de triestirilfenol y sus derivados fosfatados o sulfatados. Los dispersantes aniónicos adecuados son especialmente lignosulfonatos, sales de ácido poliacrílico y condensados de arilsulfonato-formaldehído.

25 Como antiespumantes en las formulaciones de desinfectante pueden estar contenidas todas las sustancias antiespumantes habituales para la formulación de principios activos agroquímicos. Se pueden usar preferiblemente antiespumantes de silicona y estearato de magnesio.

30 Como conservantes en las formulaciones de desinfectante pueden estar contenidas todas las sustancias que se pueden utilizar para dichos fines en composiciones agroquímicas. A modo de ejemplo son de mencionar diclorofeno y hemiformal de alcohol bencílico.

Como espesantes secundarios que pueden estar contenidos en las formulaciones de desinfectante se consideran todas las sustancias que se pueden utilizar para dichos fines en composiciones agroquímicas. Preferiblemente se consideran derivados de celulosa, derivados de ácido acrílico, xantana, arcillas modificadas y ácido silícico altamente disperso.

35 Como adhesivos que pueden estar contenidos en las formulaciones de desinfectante se consideran todos los aglutinantes habituales que pueden utilizarse en los desinfectantes. Son de mencionar preferiblemente polivinilpirrolidona, poli(acetato de vinilo), poli(alcohol vinílico) y tilosa.

40 Como giberelinas que pueden estar contenidos en las formulaciones de desinfectante se consideran preferiblemente las giberelinas A1, A3 (=ácido giberélico), A4 y A7, se usa con especial preferencia el ácido giberélico. Las giberelinas son conocidas (véase R. Wegler "Chemie der Pflanzenschutz-und Schädlingsbekämpfungsmittel", tomo 2, Springer Verlag, 1970, páginas 401-412).

45 Las formulaciones de desinfectante se pueden utilizar o directamente o después de la dilución previa con agua para el tratamiento de semillas de una amplia variedad. Así, se pueden utilizar concentrados o las preparaciones que se pueden obtener a partir de los mismos mediante dilución con agua para la desinfección de semilla de cereales, como trigo, cebada, centeno, avena y triticale, así como de semillas de maíz, arroz, colza, guisantes, judías, algodón, girasol, soja y remolachas, o también se semilla de verdura de la naturaleza más distinta. Las formulaciones de desinfectante que pueden usarse según la invención o sus formas de aplicación diluidas también pueden utilizarse para la desinfección de semilla de plantas transgénicas.

50 Para el tratamiento de semilla con las formulaciones de desinfectante o las formas de aplicación preparadas a partir de las mismas se consideran todos los instrumentos de mezcla que pueden utilizarse normalmente para la desinfección. En particular, en la desinfección se procede de tal forma que la semilla se pone en una mezcladora en operación discontinua o continua a la que se añade respectivamente la cantidad deseada de las formulaciones de desinfectante como tales o después de su dilución previa con agua y se mezcla hasta la distribución uniforme de la formulación sobre la semilla. Opcionalmente le sigue un proceso de secado.

La tasa de aplicación de las formulaciones de desinfectante puede variar dentro de una gran intervalo. Depende del contenido respectivo de los compuestos de la fórmula (I) en las formulaciones y de la semilla. Las tasas de aplicación en el caso del compuesto de la fórmula (I) se encuentran en general entre 0,001 y 50 g por kilogramo de semilla, preferiblemente entre 0,01 y 15 g por kilogramo de semilla.

5 Salud animal

En el campo de la salud animal, es decir, el campo de la veterinaria, los compuestos de la fórmula (I) son activos contra parásitos animales, especialmente ectoparásitos o endoparásitos. El término endoparásitos comprende especialmente helmintos y protozoos como coccidios. Los ectoparásitos son normalmente y preferiblemente artrópodos, especialmente insectos y acáridos.

10 En el campo de la veterinaria, los compuestos de la fórmula (I), que presentan una toxicidad favorable para los animales de sangre caliente, son adecuados para el combate de parásitos que ocurren en la cría de animales y el mantenimiento de animales en ganado, animales de cría, animales de zoológico, animales de laboratorio, animales experimentales y animales domésticos. Son activos contra todos los estadios de desarrollo o estadios de desarrollo individuales de los parásitos.

15 Al ganado agrícola pertenecen, por ejemplo, mamíferos como ovejas, cabras, caballos, burros, camellos, búfalos, conejos, renos, gamos y especialmente ganado vacuno y cerdos; aves de corral como pavos, patos, gansos y especialmente pollos; peces y crustáceos, por ejemplo, en la acuicultura y también insectos como abejas.

A los animales domésticos pertenecen, por ejemplo, o mamíferos como hámsteres, cobayas, ratas, ratones, chinchillas, hurones y especialmente perros, gatos, aves enjauladas, reptiles, anfibios y peces de acuario.

20 Según una forma de realización preferida, los compuestos de la fórmula (I) se administran a mamíferos.

Según otra forma de realización preferida, los compuestos de la fórmula (I) se administran a aves, concretamente a aves enjauladas y especialmente a aves de corral.

25 Mediante el uso de los compuestos de la fórmula (I) para el combate de parásitos animales se deberán reducir o prevenir enfermedades, casos de muerte y reducciones en el rendimiento (en la carne, leche, lana, cueros, huevos, miel y similares), de manera que se haga posible una cría de animales más económica y más simple y se pueda lograr un mejor bienestar de los animales.

30 Con respecto al campo de la salud animal, el término "combate" o "combatir" significa que mediante los compuestos de la fórmula (I) se puede reducir eficazmente a un grado inocuo la aparición de los parásitos respectivos en un animal que está infectado por dichos parásitos. Más específicamente, "combatir" significa en el presente contexto que el compuesto de la fórmula (I) puede matar al parásito respectivo, inhibir su crecimiento o inhibir su proliferación.

A los artrópodos pertenecen:

35 del orden de los anopluros, por ejemplo, *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Phtirus* spp., *Solenopotes* spp.; del orden de los malofágidos y los subórdenes de los amblicerinos e isnocerinos, por ejemplo, *Trimenopon* spp., *Menopon* spp., *Trinoton* spp., *Bovicola* spp., *Werneckiella* spp., *Lepikentron* spp., *Damalina* spp., *Trichodectes* spp., *Felicola* spp.; del orden de los dípteros y los subórdenes de los nematóceros y braquíceros, por ejemplo, *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Culex* spp., *Simulium* spp., *Eusimulium* spp., *Phlebotomus* spp., *Lutzomyia* spp., *Culicoides* spp., *Chrysops* spp., *Odagmia* spp., *Wilhelmia* spp., *Hybomitra* spp., *Atylotus* spp., *Tabanus* spp., *Haematopota* spp., *Philipomyia* spp., *Braula* spp., *Musca* spp., *Hydrotaea* spp., *Stomoxys* spp., *Haematobia* spp., *Morellia* spp., *Fannia* spp., *Glossina* spp., *Calliphora* spp., *Lucilia* spp., *Chrysomyia* spp., *Wohlfahrtia* spp., *Sarcophaga* spp., *Oestrus* spp., *Hypoderma* spp., *Gasterophilus* spp., *Hippobosca* spp., *Lipoptena* spp., *Melophagus* spp., *Rhinoestrus* spp., *Tipula* spp.; del orden de los sifonaptéridos, por ejemplo, *Pulex* spp., *Ctenocephalides* spp., *Tunga* spp., *Xenopsylla* spp., *Ceratophyllus* spp.;

45 del orden de los heteroptéridos, por ejemplo, *Cimex* spp., *Triatoma* spp., *Rhodnius* spp., *Panstrongylus* spp.; así como insectos molestos y parásitos de la higiene del orden de los blatáridos.

A los artrópodos pertenecen además:

50 de la subclase acari (acarina) y del orden de los metastigmata, por ejemplo, de la familia Argasidae, como *Argas* spp., *Ornithodoros* spp., *Otobius* spp., de la familia Ixodidae, como *Ixodes* spp., *Amblyomma* spp., *Rhipicephalus* (*Boophilus*) spp., *Dermacentor* spp., *Haemophysalis* spp., *Hyalomma* spp., *Rhipicephalus* spp. (el género original de las garrapatas multihospedador); del orden de los mesostigmata, como *Dermanyssus* spp., *Ornithonyssus* spp., *Pneumonyssus* spp., *Raillietia* spp., *Pneumonyssus* spp., *Sternostoma* spp., *Varroa* spp., *Acarapis* spp.; del orden de los actinedida (prostigmata), por ejemplo, *Acarapis* spp., *Cheyletiella* spp., *Ornithocheyletia* spp., *Myobia* spp., *Psorergates* spp., *Demodex* spp., *Trombicula* spp., *Neotrombicula* spp., *Listrophorus* spp.; y del orden de los acaridida (astigmata), por ejemplo, *Acarus* spp., *Tyrophagus* spp., *Caloglyphus* spp., *Hypodectes* spp., *Pterolichus* spp., *Psoroptes* spp., *Chorioptes* spp., *Otodectes* spp., *Sarcoptes* spp., *Notoedres* spp., *Knemidocoptes* spp.,

Cytodites spp., Laminosioptes spp..

A los protozoos parasitarios pertenecen:

5 mastigóforos (flagelados), como por ejemplo, Trypanosomatidae, por ejemplo, Trypanosoma b. brucei, T.b. gambiense, T.b. rhodesiense, T. congolense, T. cruzi, T. evansi, T. equinum, T. lewisi, T. percae, T. simiae, T. vivax, Leishmania brasiliensis, L. donovani, L. tropica, como por ejemplo, Trichomonadidae, por ejemplo, Giardia lamblia, G. canis;

sarcomastigóforos (rizópodos), como Entamoebidae, por ejemplo, Entamoeba histolytica, Hartmannellidae, por ejemplo, Acanthamoeba sp., Harmanella sp.;

10 apicomplejos (esporozoos), como Eimeridae, por ejemplo, Eimeria acervulina, E. adenoides, E. alabamensis, E. anatis, E. anserina, E. arloingi, E. ashata, E. auburnensis, E. bovis, E. brunetti, E. canis, E. chinchillae, E. clupearum, E. columbae, E. contorta, E. crandalis, E. deblickei, E. dispersa, E. ellipsoidales, E. falciformis, E. faurei, E. flavescens, E. gallopavonis, E. hagani, E. intestinalis, E. iroquoiana, E. irresidua, E. labbeana, E. leucarti, E. magna, E. maxima, E. media, E. meleagridis, E. meleagrimitis, E. mitis, E. necatrix, E. ninakohlyakimovae, E. ovis, E. parva, E. pavonis, E. perforans, E. phasani, E. piriformis, E. praecox, E. residua, E. scabra, E. spec., E. stiedai, E. suis, E. tenella, E. truncata, E. truttae, E. zuernii, Globidium spec., Isospora belli, I. canis, I. felis, I. ohioensis, I. rivolta, I. spec., I. suis, Cystisopora spec., Cryptosporidium spec., especialmente C. parvum; como Toxoplasmodidae, por ejemplo, Toxoplasma gondii, Hammondia heydonii, Neospora caninum, Besnoitia besnoitii; como Sarcocystidae, por ejemplo, Sarcocystis bovicanis, S. bovi-hominis, S. ovicanis, S. ovifelis, S. neurona, S. spec., S. suihominis, como Leucosporidae, por ejemplo, Leucosporium simondi, como Plasmodiidae, por ejemplo, Plasmodium berghei, P. falciparum, P. malariae, P. ovale, P. vivax, P. spec., como Piroplasma, por ejemplo, Babesia argentina, B. bovis, B. canis, B. spec., Theileriaparva, Theileria spec., como Adeleina, por ejemplo, Hepatozoon canis, H. spec.

A los endoparásitos plagas, en cuyo caso se trata de helmintos, pertenecen los gusanos planos (por ejemplo, monogéneos, céstodos y trematodos), los gusanos redondos, acantocéfalos y pentastoma. A ellos pertenecen:

25 monogéneos: por ejemplo, Gyrodactylus spp., Dactylogyrus spp., Polystoma spp.;

céstodos: del orden de los pseudofilídeos, por ejemplo: Diphylobothrium spp., Spirometra spp., Schistocephalus spp., Ligula spp., Bothridium spp., Diplogonoporus spp.;

30 del orden de los ciclofilídeos, por ejemplo: Mesocestoides spp., Anoplocephala spp., Paranoplocephala spp., Moniezia spp., Thysanosoma spp., Thysaniezia spp., Avitellina spp., Stilesia spp., Cittotaenia spp., Andrya spp., Bertiella spp., Taenia spp., Echinococcus spp., Hydatigera spp., Davainea spp., Raillietina spp., Hymenolepis spp., Echinolepis spp., Echinocotyle spp., Diorchis spp., Dipylidium spp., Joyeuxiella spp., Diplopylidium spp.;

35 trematodos: de la clase de los digeneos, por ejemplo: Diplostomum spp., Posthodiplostomum spp., Schistosoma spp., Trichobilharzia spp., Ornithobilharzia spp., Austrobilharzia spp., Gigantobilharzia spp., Leucochloridium spp., Brachylaima spp., Echinostoma spp., Echinoparyphium spp., Echinochasmus spp., Hypoderaeum spp., Fasciola spp., Fascioloides spp., Fasciolopsis spp., Cyclocoelum spp., Typhlocoelum spp., Paramphistomum spp., Calicophoron spp., Cotylophoron spp., Gigantocotyle spp., Fiscoederius spp., Gastrothylacus spp., Notocotylus spp., Catatropis spp., Plagiorchis spp., Prosthogonimus spp., Dicrocoelium spp., Eurytrema spp., Troglotrema spp., Paragonimus spp., Collyriclum spp., Nanophyetus spp., Opisthorchis spp., Clonorchis spp., Metorchis spp., Heterophyes spp., Metagonimus spp.;

40 gusanos redondos: trichinéidos, por ejemplo: Trichuris spp., Capillaria spp., Paracapillaria spp., Eucoleus spp., Trichomosoides spp., Trichinella spp.;

del orden de los tilénchidos, por ejemplo: Micronema spp., Strongyloides spp.;

45 del orden de los rabdítidos, por ejemplo: Strongylus spp., Triodontophorus spp., Oesophagodontus spp., Trichonema spp., Gyalocephalus spp., Cylindropharynx spp., Poterostomum spp., Cyclococercus spp., Cylicostephanus spp., Oesophagostomum spp., Chabertia spp., Stephanurus spp., Ancylostoma spp., Uncinaria spp., Necator spp., Bunostomum spp., Globocephalus spp., Syngamus spp., Cyathostoma spp., Metastrongylus spp., Dictyocaulus spp., Muellerius spp., Protostrongylus spp., Neostongylus spp., Cystocaulus spp., Pneumostongylus spp., Spicocaulus spp., Elaphostongylus spp., Parelaphostongylus spp., Crenosoma spp., Paracrenosoma spp., Oslerus spp., Angiostrongylus spp., Aelurostrongylus spp., Filaroides spp., Parafilaroides spp., Trichostrongylus spp., Haemonchus spp., Ostertagia spp., Teladorsagia spp., Marshallagia spp., Cooperia spp., Nippostrongylus spp., Heligmosomoides spp., Nematodirus spp., Hyostongylus spp., Obeliscoides spp., Amidostomum spp., Ollulanus spp.;

55 del orden de los espirúridos, por ejemplo: Oxyuris spp., Enterobius spp., Passalurus spp., Syphacia spp., Aspicularis spp., Heterakis spp.; Ascaris spp., Toxascaris spp., Toxocara spp., Baylisascaris spp., Parascaris spp., Anisakis spp., Ascaridia spp.; Gnathostoma spp., Physaloptera spp., Thelazia spp., Gongylonema spp.,

Habronema spp., Parabronema spp., Draschia spp., Dracunculus spp.; Stephanofilaria spp., Parafilaria spp., Setaria spp., Loa spp., Dirofilaria spp., Litomosoides spp., Brugia spp., Wuchereria spp., Onchocerca spp., Spirocerca spp.;

5 acantocéfalos: del orden de los Oligacanthorhynchidae, por ejemplo: Macracanthorhynchus spp., Prosthenorchis spp.; del orden de los polymorphida, por ejemplo: Filicollis spp.; del orden de los moniliformida, por ejemplo: Moniliformis spp.;

del orden de los Echinorhynchida por ejemplo, Acanthocephalus spp., Echinorhynchus spp., Leptorhynchoides spp.;

pentastoma: del orden de los porocefálicos, por ejemplo, Linguatula spp..

10 En el campo de la veterinaria y la cría de animales, la administración de los compuestos de la fórmula (I) se realiza según el procedimiento conocido en la técnica general, como enteral, parenteral, dérmico o nasal en forma de preparados adecuados. La administración puede realizarse de forma profiláctica o terapéutica.

Así, una forma de realización de la presente invención se refiere al uso de un compuesto de la fórmula (I) como fármaco.

15 Otro aspecto se refiere al uso de un compuesto de la fórmula (I) como antiendoparasítico, especialmente como un helminticida o un agente contra protozoos. Los compuestos de la fórmula (I) son adecuados para su uso como antiendoparasítico, especialmente como un helminticida o agente contra protozoos, por ejemplo en la cría de animales, en el mantenimiento de animales, en establos y en el sector de la higiene.

20 Otro aspecto se refiere a su vez al uso de un compuesto de la fórmula (I) como antiendoparasítico, especialmente un artropodocida como un insecticida o un acaricida. Otro aspecto se refiere al uso de un compuesto de la fórmula (I) como antiendoparasítico, especialmente un artropodocida como un insecticida o acaricida, por ejemplo en la cría de animales, en el mantenimiento de animales, en establos y en el sector de la higiene.

Componentes de mezclas antihelmínticos

A modo de ejemplo son de mencionar los siguientes componentes de mezcla antihelmínticos:

25 Principios activos antihelmínticos, que incluyen principios activos trematicidas y cestocidas:

de la clase de las lactonas macrocíclicas, por ejemplo: abamectina, doramectina, emamectina, eprinomectina, ivermectina, milbemicina, moxidectina, nemadectina, selamectina;

30 de la clase de los bencimidazoles y probencimidazoles, por ejemplo: albendazol, sulfóxido de albendazol, cambendazol, ciclobendazol, febantel, fenbendazol, flubendazol, mebendazol, netobimin, oxfendazol, oxibendazol, parbendazol, tiabendazol, tiofanato, triclabendazol;

de la clase de los ciclooctadepsipéptidos, por ejemplo: emodepsida, PF1022;

de la clase de los derivados de aminoacetónitrilo, por ejemplo: monepantel;

de la clase de las tetrahidropirimidinas, por ejemplo: morantel, pirantel, oxantel;

de la clase de los imidazotiazoles, por ejemplo: butamisol, levamisol, tetramisol;

35 de la clase de las salicilanilidas, por ejemplo: bromoxanid, brotianid, clioxanid, closantel, niclosamida, oxiclozanid, rafoxanid, tribromsalan;

de la clase de las paraherquamidas, por ejemplo: derquantel, paraherquamida;

de la clase de las aminofenilamidinas, por ejemplo: amidaantel, amidantel desacilado(dAMD), tribendimidina;

de la clase de los organofosfatos, por ejemplo: coumafos, crufomato, diclorovos, haloxon, naftalofos, triclorofon;

40 de la clase de los fenoles sustituidos, por ejemplo: bitionol, disofenol, hexaclorofeno, niclofolan, meniclofolan, nitroxinilo;

de la clase de las piperazinonas, por ejemplo: praziquantel, epsiprantel;

45 de otras diversas clases, por ejemplo: amoscanato, befenio, bunamidina, clonazepam, clorsulon, diamfenetid, diclorofeno, dietilcarbamazina, emetina, hetolina, hicantona, lucantona, Miracil, mirasan, niclosamida, nirdazol, nitroxinilo, nitroscanato, oltipraz, omfalotin, oxamniquin, paromomicina, piperazina, resorantel.

Control de vectores

Los compuestos de la fórmula (I) también se pueden utilizar en el control de vectores. Un vector en el sentido de la presente invención es un artrópodo, especialmente un insecto o arácnido, que es capaz de transmitir patógenos como, por ejemplo, virus, gusanos, organismos unicelulares y bacterias de un reservorio (planta, animal, humano, etc.) a un hospedador. Los patógenos se pueden transmitir mecánicamente (por ejemplo, tracoma por moscas no picadoras) a un hospedador, o después de la inyección (por ejemplo, parásitos de la malaria por mosquitos) a un hospedador.

Ejemplos de vectores y las enfermedades transmitidas por ellos o patógenos son:

1) Mosquitos

- Anopheles: malaria, filariasis;

10 - Culex: encefalitis japonesa, filariasis, otras enfermedades virales, transmisión de gusanos;

- Aedes: fiebre amarilla, fiebre del dengue, filariasis, otras enfermedades virales;

- Simulien: transmisión de gusanos, especialmente Onchocerca volvulus;

2) Piojos: infecciones de la piel, tabardillo (tifus epidémico);

3) Pulgas: peste, tabardillo endémico;

15 4) Moscas: enfermedad del sueño (tripanosomiasis); cólera, otras enfermedades bacterianas;

5) Ácaros: acariosis, tifus epidémico, rickettsiosis exantemática, tularemia, encefalitis de San Luis, meningitis viral (FSME), fiebre de Crimea-Congo, borreliosis;

6) Garrapatas: borreliosis como Borrelia duttoni, meningoencefalitis de principios del verano, fiebre Q (Coxiella burnetii), babesiosis (Babesia canis canis).

20 Ejemplos de vectores en el sentido de la presente invención son insectos como áfidos, moscas, chicharras o arañuelas que pueden transmitir los virus de las plantas a las plantas. Otros vectores que pueden transmitir virus de las plantas son arañas rojas, piojos, escarabajos y nematodos.

Ejemplos adicionales de vectores en el sentido de la presente invención son insectos y arácnidos como mosquitos, especialmente de los géneros Aedes, Anopheles, por ejemplo, A. gambiae, A. arabiensis, A. funestus, A. dirus (malaria) y Culex, piojos, pulgas, moscas, ácaros y garrapatas, que pueden transmitir patógenos a los animales y/o seres humanos.

También es posible un control de vectores cuando los compuestos de la fórmula (I) son rompedores de la resistencia.

30 Los compuestos de la fórmula (I) son adecuados para su uso en la prevención de enfermedades o de patógenos que se transmite por vectores. Por tanto, es otro aspecto de la presente invención el uso de compuestos de la fórmula (I) para el control de vectores, por ejemplo, en la agricultura, en la horticultura, en bosques, en jardines y en instalaciones recreativas, así como en la protección de materiales y productos almacenados.

Protección de materiales industriales

35 Los compuestos de la fórmula (I) son adecuados para la protección de materiales industriales contra la infestación o destrucción por insectos, por ejemplo, del orden de los coleópteros, himenópteros, isópteros, lepidópteros, psocópteros y zigentoma.

Por materiales industriales se entiende en el presente contexto materiales inanimados, como preferiblemente plásticos, adhesivos, colas, papeles y cartones, cuero, maderas, productos procesados de madera y recubrimientos. Se prefiere especialmente la aplicación de la invención a la protección de madera.

40 En otra forma de realización, los compuestos de la fórmula (I) se utilizan junto con al menos otro insecticida y/o al menos un fungicida.

En otra forma de realización, los compuestos de la fórmula (I) están presentes como un agente de control de plagas listo para uso, es decir, se puede aplicar al material correspondiente sin modificaciones adicionales. Como insecticidas adicionales o como fungicidas se consideran especialmente los anteriormente mencionados.

45 También se encontró sorprendentemente que los compuestos de la fórmula (I) se pueden usar para la protección de la incrustación biológica de objetos, especialmente de cascos de barcos, tamicos, redes, edificios, embarcaderos y sistemas de señalización que se ponen en contacto con agua de mar o salobre. Los compuestos de la fórmula (I) se pueden utilizar igualmente solos o en combinaciones con otros principios activos como antiincrustantes.

Combate de plagas animales en el sector de la higiene

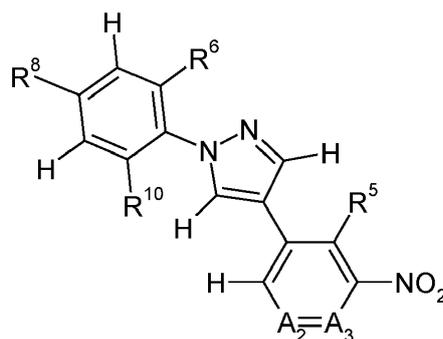
Los compuestos de la fórmula (I) son adecuados para combatir plagas animales en el sector de la higiene. La invención se puede usar especialmente en la protección doméstica, de la higiene y de productos almacenados, sobre todo para combatir insectos, arácnidos y ácaros, que se encuentran en espacios cerrados como, por ejemplo, casas, naves industriales, oficinas, cabinas de vehículos. Para combatir las plagas animales, los compuestos de la fórmula (I) se usan solos o en combinación con otros principios activos y/o auxiliares. Se usan preferiblemente en productos insecticidas domésticos. Los compuestos de la fórmula (I) son activos contra especies sensibles y resistentes, así como contra todos los estadios de desarrollo.

A estos parásitos pertenecen, por ejemplo, parásitos de la clase arácnidos, de los órdenes Scorpioles, Araneae y Opiliones, de las clases quilópodos y diplópodos, de la clase Insecta el orden Blattodea, de los órdenes coleópteros, dermápteros, dípteros, heterópteros, himenópteros, isópteros, lepidópteros, fitirápteros, psocópteros, saltatorios u ortópteros, sifonápteros y zigentoma y de la clase malacostraca el orden isópodos.

La aplicación se realiza, por ejemplo, en aerosoles, agentes pulverizadores sin presión, por ejemplo, esprays de bomba y de atomizador, sistemas automáticos de nebulización, aspersores, espumas, geles, productos de evaporador con plaquitas de evaporador de celulosa o plástico, evaporadores de líquido, evaporadores de gel y membrana, evaporadores accionados por propelente, sistemas de evaporación sin energía o pasivos, papeles para polillas, saquitos para polillas y geles para polillas, como gránulos o polvos, en cebos para extensión o estaciones de cebo.

Productos intermedios

Un aspecto de la presente invención se refiere al producto intermedio de la fórmula (II)

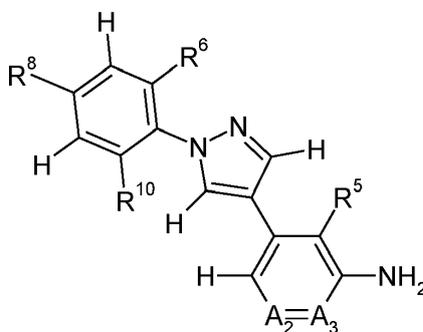


(II)

donde

A_2 , A_3 , R^5 , R^6 , R^8 y R^{10} tienen los significados mencionados en el presente documento. En una forma de realización preferida, A_2 , A_3 , R^5 , R^6 , R^8 y R^{10} tienen los significados que se describen en el párrafo [0086] también para los compuestos de la fórmula (I').

Otro aspecto de la presente invención se refiere al producto intermedio de la fórmula (III)



(III)

donde

A_2 , A_3 , R^5 , R^6 , R^8 y R^{10} tienen los significados mencionados en el presente documento. En una forma de realización preferida, A_2 , A_3 , R^5 , R^6 , R^8 y R^{10} tienen los significados que se describen en el párrafo [0086] también para los compuestos de la fórmula (I').

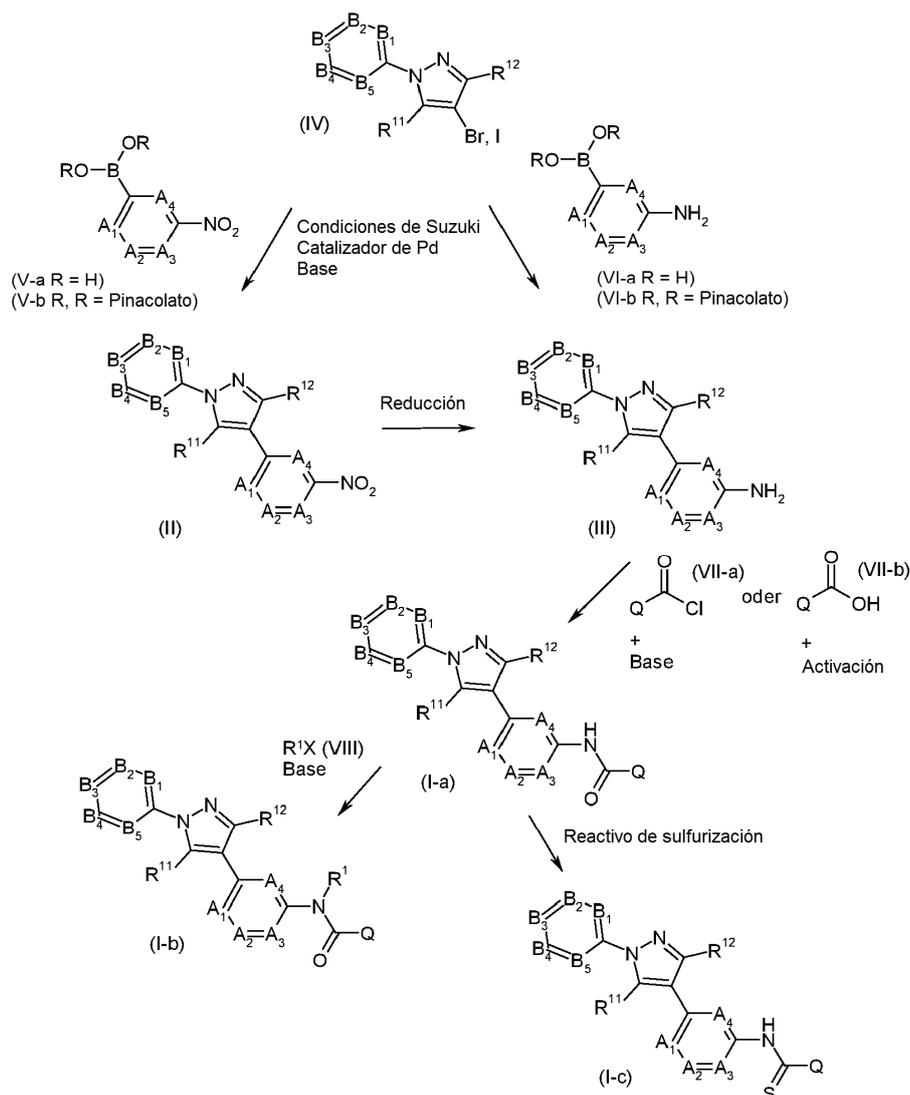
Procedimientos de preparación

Los compuestos de la estructura general (Ia) se pueden preparar en analogía con los procedimientos de acoplamiento de péptidos conocidos en la bibliografía a partir de las anilinas o azinilaminas (III) correspondientes reaccionadas con (VII-a) o (VII-b) [documentos de patente WO 2010/051926; WO 2010/133312].

- 5 Los productos intermedios de la estructura general (II) y (III) se pueden preparar según los procedimientos conocidos en la bibliografía mediante reacciones catalizadas por paladio a partir de los correactantes (IV) y (V-a, V-b) o (VI-a, VI-b) [documentos de patente WO 2005/040110; WO 2009/089508]. Los ácidos borónicos (V-a, VI-a) o pinacolato de boro (V-b, VI-b) correspondientes están comercialmente disponibles. Es posible la preparación del halopirazol (IV) en analogía al documento de patente DE3509567.
- 10 Alternativamente, se pueden preparar las anilinas o azinilaminas (III) a partir de los precursores de nitró (II) correspondientes por reducción [documento de patente WO 2012/080376].

Los compuestos de la estructura general (I-b) se pueden generar según reacciones de alquilación suficientemente conocidas para el experto de amidas de la estructura (I-a) con reactivos de alquilación (VIII), preferiblemente en presencia de auxiliares de reacción básicos.

- 15 Las estructuras de la estructura general (I-c) se pueden representar en analogía a los procedimientos de sulfuración conocidos de la bibliografía a partir de compuestos de la estructura general (I-a) [documentos de patente WO 2012/056372; WO 2003/066050].

Esquema de reacción 1

- 20 Los radicales A₁ a A₄, B₁ a B₅, Q, R¹, R¹¹ y R¹² tienen los significados anteriormente descritos.

Se conocen oxidantes para la oxidación de grupos alcohólicos (véanse, por ejemplo, Oxidationsreagenzien in Organic Synthesis by Oxidation with Metal Compounds, Mijs, de Jonge, Plenum Verlag, New York, 1986; Manganese Compounds as Oxidizing Agents in Organic Chemistry, Arndt, Open Court Publishing Company, La Salle, IL, 1981; The Oxidation of Organic Compounds by Permanganate Ion and Hexavalent Chromium, Lee, Open Court Publishing Company, La Salle, IL, 1980). Se puede realizar una oxidación, por ejemplo, en presencia de permanganatos (por ejemplo, permanganato de potasio), óxidos metálicos (por ejemplo, dióxido de manganeso, óxidos de cromo que se usan, por ejemplo, en el óxido de dipiridincromo (VI) como reactivo de Collins (véase J. C. Collins et al., Tetrahedron Lett. 30, 3363-3366, 1968)). Asimismo, en presencia de clorocromato de piridinio (por ejemplo, reactivo de Corey) (véase también R. O. Hutchins et al., Tetrahedron Lett. 48, 4167-4170, 1977; D. Landini et al. Synthesis 134-136, 1979) o tetróxido de rutenio (véase S.-I. Murahashi, N. Komiya Ruthenium-catalyzed Oxidation of Alkenes, Alcohols, Amines, Amides, β -Lactams, Phenols and Hydrocarbons, en: Modern Oxidation Methods, Baeckvall, Jan-Erling (Eds.), Wiley-VCH-Verlag GmbH & Co. KGaA, 2004). Asimismo son adecuadas reacciones de oxidación inducidas por ultrasonidos, así como el uso de permanganato de potasio (véase J. Yamawaki et al., Chem. Lett. 3, 379-380, 1983

Para el desbloqueo / escisión de grupos protectores (GP), se pueden usar todos los auxiliares de reacción ácidos o básicos adecuados conocidos según el modo de proceder descrito en la bibliografía. En el uso de grupos protectores para grupos amino del tipo carbamato se usan preferiblemente auxiliares de reacción ácidos. En el uso del grupo protector *t*-butilcarbamato (grupo BOC) se usan, por ejemplo, mezclas de ácidos minerales como ácido clorhídrico, ácido bromhídrico, ácido nítrico, ácido sulfúrico, ácido fosfórico o ácidos orgánicos como ácido benzoico, ácido fórmico, ácido acético, ácido trifluoroacético, ácido metanosulfónico, ácido benzenosulfónico o ácido toluenosulfónico y un diluyentes adecuado como agua y/o un disolvente orgánico como tetrahidrofurano, dioxano, diclorometano, cloroformo, acetato de etilo, etanol o metanol. Se prefieren mezclas de ácido clorhídrico o ácido acético con agua y/o un disolvente orgánico como acetato de etilo.

Se conoce que ciertas reacciones y procesos de preparación se pueden llevar a cabo especialmente bien en presencia de diluyentes o disolventes y auxiliares de reacción básicos o ácidos. También se pueden utilizar mezclas de diluyentes o disolventes. Los diluyentes o disolventes se utilizan de manera ventajosa en una cantidad tal que la mezcla de reacción pueda agitarse bien durante todo el procedimiento.

Como diluyentes o disolventes para la realización del procedimiento según la invención se consideran en principio todos los disolventes orgánicos inertes en las condiciones de reacción específicas. Como ejemplos son de mencionar: hidrocarburos halogenados (por ejemplo, clorohidrocarburos como tetraetilo, tetracloroetano, dicloropropano, cloruro de metileno, diclorobutano, cloroformo, tetraclorometano, tricloroetano, tricloroetilo, pentacloroetano, difluorbenzoceno, 1,2-dicloroetano, clorobenceno, bromobenceno, diclorobenceno, clorotolueno, triclorobenceno), alcoholes (por ejemplo, metanol, etanol, isopropanol, butanol), éteres (por ejemplo, etil propil éter, metil-*t*-butil éter, *n*-butil éter, anisol, fenetol, ciclohexilmetil éter, dimetil éter, dietil éter, dipropil éter, diisopropil éter, di-*n*-butil éter, diisobutil éter, diisoamil éter, dimetil éter de etilenglicol, tetrahidrofurano, dioxano, diclorodietil éter y poliéteres de óxido de etileno y/u óxido de propileno), aminas (por ejemplo, trimetil-, trietil-, tripropil-, tributilamina, *n*-metilmorfolina, piridina y tetrametilendiamina), nitrohidrocarburos (por ejemplo, nitrometano, nitroetano, nitropropano, nitrobenceno, cloronitrobenceno, *o*-nitrotolueno; nitrilos como acetonitrilo, propionitrilo, butironitrilo, isobutironitrilo, benzonitrilo, *m*-clorobenzonitrilo), dióxido de tetrahidrotiofeno, sulfóxido de dimetilo, sulfóxido de tetrametilo, sulfóxido de dipropilo, sulfóxido de bencilmetilo, sulfóxido de diisobutilo, sulfóxido de dibutilo, sulfóxido de diisoamilo, sulfonas (por ejemplo, dimetil-, dietil-, dipropil-, dibutil-, difenil-, dihexil-, metiletil-, etilpropil-, etilisobutil- y pentametilsulfona), hidrocarburos alifáticos, cicloalifáticos o aromáticos (por ejemplo, pentano, hexano, heptano, octano, nonano e hidrocarburos industriales), además de las denominadas "esencias de petróleo" con componentes con puntos de ebullición en el intervalo de, por ejemplo, 40 °C a 250 °C, cimenos, fracciones de gasolina dentro de un intervalo del punto de ebullición de 70 °C a 190 °C, ciclohexano, metilciclohexano, éter de petróleo, ligroína, octano, benceno, tolueno, clorobenceno, bromobenceno, nitrobenceno, xileno, ésteres (por ejemplo, acetato de metilo, etilo, butilo, iso-butilo, carbonato de dimetilo, dibutilo y etileno); amidas (por ejemplo, triamida de ácido hexametilenfosfórico, formamida, *N*-metilformamida, *N,N*-dimetilformamida, *N,N*-dipropilformamida, *N,N*-dibutilformamida, *N*-metilpirrolidona, *N*-metilcaprolactama, 1,3-dimetil-3,4,5,6-tetrahidro-2(1H)-pirimidina, octilpirrolidona, octilcaprolactama, 1,3-dimetil-2-imidazolindiona, *N*-formilpiperidina, *N,N'*-1,4-diformilpiperazina) y cetonas (por ejemplo, acetona, acetofenona, metil etil cetona, metil butil cetona).

Como auxiliares de reacción básicos para la realización del procedimiento según la invención se pueden utilizar todos los aglutinantes ácidos adecuados. Como ejemplos son de mencionar: compuestos de metales alcalinotérreos o metales alcalinos (por ejemplo, hidróxidos, hidruros, óxidos y carbonatos de litio, sodio, potasio, magnesio, calcio y bario), bases de amidina o bases de guanidina (por ejemplo, 7-metil-1,5,7-triaza-biciclo(4.4.0)dec-5-eno (MTBD); diazabicyclo(4.3.0)noneno (DBN), diazabicyclo(2.2.2)octano (DABCO), 1,8-diazabicyclo(5.4.0)undeceno (DBU), ciclohexiltetrabutylguanidina (CyTBG), ciclohexiltetrametilguanidina (CyTMG), *N,N,N,N*-tetrametil-1,8-naftalendiamina, pentametilpiperidina) y aminas, especialmente aminas terciarias (por ejemplo trietilamina, trimetilamina, tribencilamina, trisopropilamina, tributilamina, triciclohexilamina, triamilamina, trihexilamina, *N,N*-dimetilaniolina, *N,N*-dimetiltoluidina, *N,N*-dimetil-*p*-aminopiridina, *N*-metilpirrolidina, *N*-metilpiperidina, *N*-metilimidazol, *N*-metilpirazol, *N*-metilmorfolina, *N*-metilhexametilendiamina, piridina, 4-pirrolidinopiridina, 4-dimetilaminopiridina, quinolina, α -picolina, β -picolina, isoquinolina, pirimidina, acridina, *N,N,N,N'*-tetrametilendiamina, *N,N,N,N'*-tetraetilendiamina, quinoxalina, *N*-propildiisopropilamina, *N*-etilidiisopropilamina, *N,N*-dimetilciclohexilamina, 2,6-

lutidina, 2,4-lutidina o trietildiamina).

Como auxiliares de reacción ácidos para la realización del procedimiento según la invención se pueden utilizar todos los ácidos minerales (por ejemplo, hidrácidos como ácido fluorhídrico, ácido clorhídrico, ácido bromhídrico o ácido yodhídrico, así como ácido sulfúrico, ácido fosfórico, ácido fosforoso, ácido nítrico), ácidos de Lewis (por ejemplo, cloruro de aluminio (III), trifluoruro de boro o su eterato, cloruro de titanio (V), cloruro de estaño (V) y ácidos orgánicos (por ejemplo, ácido fórmico, ácido acético, ácido propiónico, ácido malónico, ácido láctico, ácido oxálico, ácido fumárico, ácido adípico, ácido esteárico, ácido tartárico, ácido oleico, ácido metanosulfónico, ácido benzoico, ácido bencenosulfónico o ácido para-toluenosulfónico).

Siempre y cuando estén previstos grupos protectores en los esquemas de reacción, se pueden usar todos los grupos protectores comúnmente conocidos. Especialmente aquellos que se describen por Greene T. W., Wuts P. G. W. en Protective Groups in Organic Synthesis; John Wiley & Sons, Inc. 1999, "Protection for the hydroxyl group including 1,2- and 1,3-diols".

Además también son adecuados grupos protectores

del tipo de un metil éter sustituido (por ejemplo, metoximetil éter (MOM), metiltiometil éter (MTM), (fenildimetilsilil)metoximetil éter (SNOM-OR), benciloximetil éter (BOM-OR) para-metoxibenciloximetil éter (PMBM-OR), para-nitrobenciloximetil éter, orto-nitrobenciloximetil éter (NBOM-OR), (4-metoxifenoxi)metil éter (p-AOM-OR), guaiacolmetil éter (GOMA-OR), t-butoximetil éter, 4-pentiloximetil éter (POM-OR), sililoximetil éter, 2-metoxietoximetil éter (MEM-OR), 2,2,2-tricloroetoximetil éter, bis(2-cloroetoxi)metil éter, 2-(trimetilsilil)etoximetil éter (SEM-OR), metoximetil éter (MM-OR));

del tipo de un etil éter sustituido (por ejemplo, 1-etoxietil éter (EE-OR), 1-(2-cloroetoxi)etil éter (CEE-OR), 1-[2-(trimetilsilil)etoxi]etil éter (SEE-OR), 1-metil-1-metoxietil éter (MIP-OR), 1-metil-1-benciloxietil éter (MBE-OR), 1-metil-1-benciloxi-2-fluoroetil éter (MIP-OR), 1-metil-1-fenoxietil éter, 2,2,-tricloroetil éter, 1,1-dianisil-2,2,2-tricloroetil éter (DATE-OR), 1,1,1,3,3,3-hexafluoro-2-fenilisopropil éter (HIP-OR), 2-trimetilsililetil éter, 2-(benciltio)etil éter, 2-(fenilselenil)etil éter), de un éter (por ejemplo tetrahidropiraniol éter (THP-OR), 3-bromotetrahidropiraniol éter (3-BrTHP-OR), tetrahidrotiopiraniol éter, 1-metoxiciclohexil éter, 2- y 4-picolil éter, éter de 3-metil-2-picolil-N-óxido, 2-quinolinilmetil éter (Qm-OR), 1-pirenilmetil éter, difenilmetil éter (DPM-OR), para, para'-dinitrobenzidril éter (DNB-OR), 5-dibenzosuberil éter, trifenilmetil éter (Tr-OR), alfa-naftildifenilmetil éter, para-metoxifenildifenilmetil éter (MMTrOR), di(para-metoxifenil)fenilmetil éter (DMTr-OR), tri(para-metoxifenil)fenilmetil éter (TMTr-OR), 4-(4'-bromofenacilo)fenildifenilmetil éter, 4,4',4"-tris(4,5-dicloro-ftalimidofenil)metil éter (CPTTr-OR), 4,4',4"-tris(benzoiloxifenil)metil éter (TBTr-OR), 4,4'-dimetoxi-3"-[N-(imidazolilmetil)]tritol éter (IDTr-OR), 4,4'-dimetoxi-3"-[N-(imidazoliletil)carbamoil]tritol éter (IETTr-OR), 1,1-bis(4-metoxifenil)-1'-pirenilmetil éter (Bmpm-OR), 9-antril éter, 9-(9-fenil)xantenil éter (pixil-OR), 9-(9-fenil-10-oxo)antril (tritolon éter), 4-metoxitetrahidropiraniol éter (MTHP-OR), 4-metoxitetrahidrotiopiraniol éter, 4-metoxitetrahidrotiopiraniol-S,S-dióxido, 1-[(2-cloro-4-metil)fenil]-4-metoxipiperidin-4-il éter (CTMP-OR), 1-(2-fluorofenil)-4-metoxipiperidin-4-il éter (Fpmp-OR), 1,4-dioxan-2-il éter, tetrahidrofuranil éter, tetrahidrotiofuranil éter, 2,3,3a,4,5,6,7,7a-octahidro-7,8,8-trimetil-4,7-metanbenzofuran-2-il éter (MBF-OR), t-butil éter, alil éter, propargil éter, para-clorofenil éter, para-metoxifenil éter, para-nitrofenil éter, para-2,4-dinitrofenil éter (DNP-OR), 2,3,5,6-tetrafluoro-4-(trifluorometil)fenil éter, bencil éter (Bn-OR));

del tipo de un bencil éter sustituido (por ejemplo, para-metoxi-bencil éter (MPM-OR), 3,4-dimetoxi-bencil éter (DMPM-OR), orto-nitro-bencil éter, para-nitro-bencil éter, para-halobencil éter, 2,6-dicloro-bencil éter, para-aminoacil-bencil éter (PAB-OR), para-azido-bencil éter (Azb-OR), 4-azido-3-cloro-bencil éter, 2-trifluorometil-bencil éter, para-(metilsulfinil)bencil éter (Msib-OR));

del tipo de un silil éter (por ejemplo, trimetilsilil éter (TMS-OR), trietilsilil éter (TES-OR), triisopropilsilil éter (TIPS-OR), dimetilisopropilsilil éter (IPDMS-OR), dietilisopropilsilil éter (DEIPS-OR), dimetilhexilsilil éter (TDS-OR), t-butildimetilsilil éter (TBDMS-OR), t-butildifenilsilil éter (TBDPS-OR), tribencilsilil éter, tri-para-xililsilil éter, trifenilsilil éter (TPS-OR), difenilmetilsilil éter (DPMS-OR), di-t-butilmetilsilil éter (DTBMS-OR), tris(trimetilsilil)silil éter (sisil éter), di-t-butilmetilsilil éter (DTBMS-OR), tris(trimetilsilil)silil éter (sisil éter), (2-hidroxiestiril)-dimetilsilil éter (HSDMS-OR), (2-hidroxiestiril)diisopropilsilil éter (HSDIS-OR), t-butilmetoxifenil-silil éter (TBMPs-OR), t-butoxidifenilsilil éter (DPTBOS-OR));

del tipo de un éster (por ejemplo, éster de formiato, éster de benzoilformiato, éster de acetato (Ac-OR), éster de cloroacetato, éster de dicloroacetato, éster de tricloroacetato, éster de trifluoroacetato (TFA-OR), éster de metoxiacetato, éster de trifenilmetoxiacetato, éster de fenoxiacetato, éster de para-clorofenoxiacetato, éster de fenilacetato, éster de difenilacetato (DPA-OR), éster de nicotinato, éster de 3-fenilpropionato, éster de 4-pentoato, éster de 4-oxopentoato (levulinato) (Lev-OR), éster de 4,4-(etilenditio)pentanoato (LevS-OR), éster de 5-[3-bis(4-metoxifenil)hidroximetoxifenoxi]levulinato, éster de pivaloato (Pv-OR), éster de 1-adamantanoato, éster de crotonato, éster de 4-metoxicrotonato, éster de benzoato (Bz-OR), éster de para-fenilbenzoato, éster de 2,4,6-trimetilbenzoato (mesitoato), éster de 4-(metiltiometoxi)butirato (MTMB-OR), éster de 2-(metiltiometoximetil)benzoato (MTMT-OR),

del tipo de un éster (por ejemplo, carbonato de metilo, carbonato de metoximetilo, carbonato de 9-fluorenilmetilo (Fmoc-OR), carbonato de etilo, carbonato de 2,2,2-tricloroetilo (Troc-OR), carbonato de 1,1-dimetil-2,2,2-tricloroetilo (TCBOC-OR), carbonato de 2-(trimetilsilil)etilo (TMS-OR), carbonato de 2-(fenilsulfonil)etilo (Ps-OR), carbonato de 2-(trifenilfosfonio)etilo (Peoc-OR), carbonato de t-butilo (Boc-OR), carbonato de isobutilo, carbonato de vinilo, carbonato de alilo (Alloc-OR), carbonato de para-nitrofenilo, carbonato de bencilo (Z-OR), carbonato de para-metoxibencilo, carbonato de 3,4-dimetoxibencilo, carbonato de orto-nitrobencilo, carbonato de para-nitrobencilo, carbonato de 2-dansiletilo (Dnseoc-OR), carbonato de 2-(4-nitrofenil)etilo (Npeoc-OR), carbonato de 2-(2,4-dinitrofenil)etilo (Dnpeoc)), y

del tipo de un sulfato (por ejemplo, alilsulfonato (Als-OR), metanosulfonato (Ms-OR), bencilsulfonato, tosilato (Ts-OR), 2-[(4-nitrofenil)etil]sulfonato (Npes-OR)).

Como catalizadores para la realización de una hidrogenación catalítica en el procedimiento según la invención son adecuados todos los catalizadores de hidrogenación habituales como, por ejemplo, catalizadores de platino (por ejemplo, hoja de platino, esponja de platino, negro de platino, platino coloidal, óxido de platino, alambre de platino), catalizadores de paladio (por ejemplo, esponja de paladio, negro de paladio, óxido de paladio, paladio-carbón vegetal, paladio coloidal, paladio-sulfato de bario, paladio-carbonato de bario, hidróxido de paladio), catalizadores de níquel (por ejemplo, níquel reducido, óxido de níquel, níquel Raney), catalizadores de rutenio, catalizadores de cobalto (por ejemplo, cobalto reducido, cobalto Raney), catalizadores de cobre (por ejemplo, cobre reducido, cobre Raney, cobre Ullmann). Se usan preferiblemente catalizadores de metales nobles (por ejemplo, catalizadores de platino y paladio o rutenio) que se han aplicado opcionalmente sobre un soporte adecuado (por ejemplo, carbono o silicio), catalizadores de rodio (por ejemplo, cloruro de tris(trifenilfosfina)rodio (I) en presencia de trifenilfosfina). Además, se pueden usar "catalizadores de hidrogenación quirales" (por ejemplo, los que contienen ligandos de difosfina quirales tales como (2S,3S)-(-)-2,3-bis(difenilfosfina)butano [(S,S)-quirafos] o (R)-(+)-2,2'-bis(difenilfosfina)-1,1'-binaftaleno [R(+)-BINAP o S(-)-BINAP]), por lo que aumenta la proporción de un isómero en la mezcla de isómeros o prácticamente se suprime completamente la formación de otro isómero.

La preparación de sales de los compuestos según la invención se realiza según procedimientos convencionales. Las sales de adición de ácido representativas son, por ejemplo, aquellas que se forman mediante la reacción con ácidos inorgánicos como, por ejemplo, ácido sulfúrico, ácido clorhídrico, ácido bromhídrico, ácido fosfórico o ácidos carboxílicos orgánicos como ácido acético, ácido trifluoroacético, ácido cítrico, ácido succínico, ácido butírico, ácido láctico, ácido fórmico, ácido fumárico, ácido maleico, ácido malónico, ácido canfórico, ácido oxálico, ácido ftálico, ácido propiónico, ácido glicólico, ácido glutárico, ácido esteárico, ácido salicílico, ácido sórbico, ácido tartárico, ácido cinámico, ácido valerianico, ácido pícrico, ácido benzoico o ácidos sulfónicos orgánicos como ácido metanosulfónico y ácido 4-toluenosulfónico.

También son representativas las sales de compuestos según la invención que se forman a partir de bases orgánicas como, por ejemplo, piridina o trietilamina o aquellas que se forman a partir de bases inorgánicas como, por ejemplo, hidruros, hidróxidos o carbonatos de sodio, litio, calcio, magnesio o bario, cuando los compuestos de la fórmula general (I) presentan un elemento estructural adecuado para la formación de esta sal.

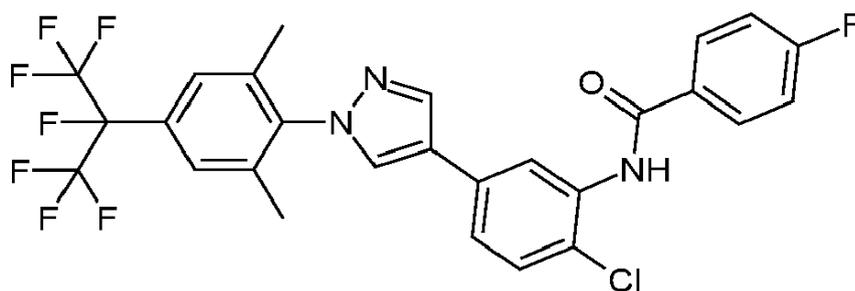
Se conocen los procedimientos de síntesis para la representación de N-óxidos y t-aminas heterocíclicos. Se pueden obtener con peroxiácidos (por ejemplo, ácido peracético y ácido meta-cloro-perbenzoico (MCPBA), peróxido de hidrógeno), hidroperóxidos de alquilo (por ejemplo, hidroperóxido de t-butilo), perborato de sodio y dioxiranos (por ejemplo, dimetildioxirano). Estos procedimientos se describen, por ejemplo, por T. L. Gilchrist, en *Comprehensive Organic Synthesis*, Vol. 7, S. 748-750, 1992, S. V. Ley, (Ed.), Pergamon Press; M. Tisler, B. Stanovnik, en *Comprehensive Heterocyclic Chemistry*, Vol. 3, S. 18-20, 1984, A. J. Boulton, A. McKillop, (Eds.), Pergamon Press; M. R. Grimmett, B. R. T. Keene en *Advances in Heterocyclic Chemistry*, Vol. 43, S. 149-163, 1988, A. R. Katritzky, (Ed.), Academic Press; M. Tisler, B. Stanovnik, en *Advances in Heterocyclic Chemistry*, Vol. 9, S. 285-291, 1968, A. R. Katritzky, A. J. Boulton (Eds.), Academic Press; G. W. H. Cheeseman, E. S. G. Werstiuk en *Advances in Heterocyclic Chemistry*, Vol. 22, S. 390-392, 1978, A. R. Katritzky, A. J. Boulton, (Eds.), Academic Press.

Parte experimental

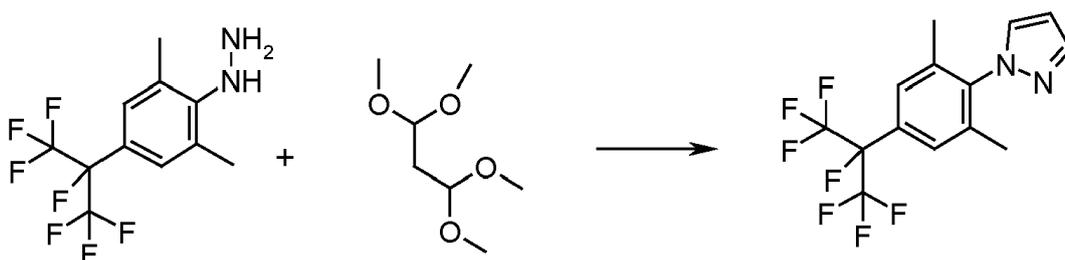
Datos de RMN ¹H

Los datos de RMN ¹H se registraron usando un Bruker Avance 400, equipado con una celda de flujo (60 µl de volumen), o con un Bruker AVIII 400, equipado con un cabezal de muestreo crio-CPTCI de 1,7 mm, o con un Bruker AVII 600 (600,13 MHz), equipado con un cabezal de muestreo crio-TCl de 5 mm, o con un Bruker AVIII 600 (601,6 MHz), equipado con un cabezal de muestreo crio-CPMNP de 5 mm. A este respecto, se usaron tetrametilsilano como referencia (0,0 ppm) y CD₃CN, CDCl₃ o D₆-DMSO como disolvente deuterado.

Ejemplo de síntesis: Síntesis de N-[2-cloro-5-[1-[2,6-dimetil-4-[1,2,2,2-tetrafluoro-1-(trifluorometil)etil]fenil]pirazol-4-il]fenil]-4-fluoro-benzamida (Tabla 1, Ejemplo N° 4)

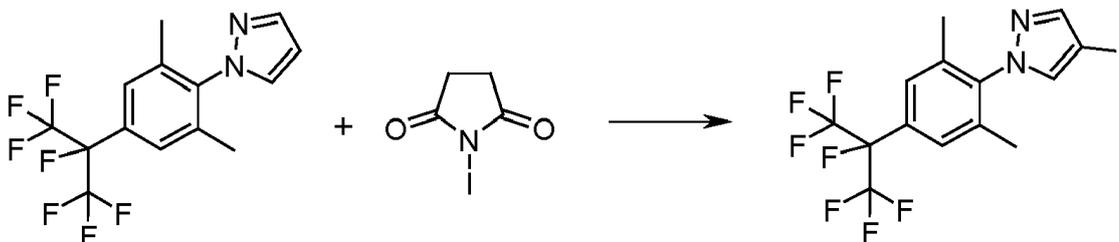


Etapa 1



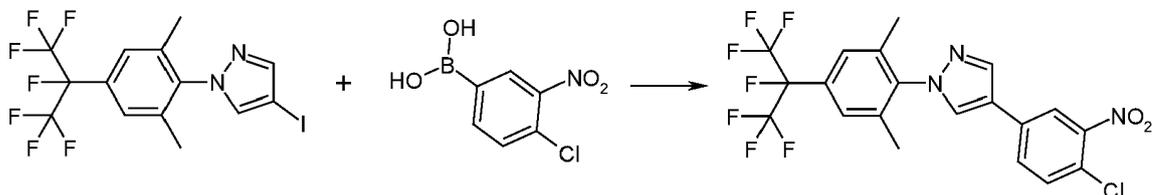
En un matraz de 25 ml se dispusieron 3,41 g (11,2 mmoles) de [2,6-dimetil-4-[1,2,2,2-tetrafluoro-1-(trifluorometil)etil]fenil]hidracina (base libre, conocida del documento de patente US2003/187233) en 13 ml de etanol. Luego se añadieron 1,84 g (11,2 mmoles) de tetrametoxipropano y a continuación 0,55 g (5,6 mmoles) de ácido sulfúrico al 96 %. Se calentó la mezcla de reacción 2 horas a reflujo. Se separó el etanol en un evaporador rotatorio a vacío. El residuo se distribuyó entre acetato de etilo y disolución acuosa saturada de hidrogenocarbonato de sodio. Se separó la fase orgánica, se secó con sulfato de sodio y se concentró en un evaporador rotatorio a vacío. El residuo se destiló a vacío a 1 mbar y 150 °C en un tubo de bolas y dio 2,5 g de 1-[2,6-dimetil-4-[1,2,2,2-tetrafluoro-1-(trifluorometil)etil]fenil]pirazol.

Etapa 2



En un matraz de 25 ml se dispusieron 2,5 g (7,34 mmoles) de 1-[2,6-dimetil-4-[1,2,2,2-tetrafluoro-1-(trifluorometil)etil]fenil]pirazol en 30 ml de acetonitrilo y se añadieron gota a gota 8,3 g (36,9 mmoles) de N-yodosuccinimida en 50 ml de acetonitrilo. A continuación se calentó a reflujo. Para el procesamiento, se evaporó y el residuo se repartió entre agua y acetato de etilo. Se separó la fase orgánica, primero con disolución acuosa saturada de hidrogenosulfito de sodio, luego se lavó con disolución salina saturada, se secó con sulfato de sodio y se concentró. El residuo se purificó por cromatografía con gel de sílice mediante un gradiente de 90:10 a 70:30 (v/v) en ciclohexano/acetato de etilo. Después de concentración de las fracciones que contenían el producto, se obtuvieron 2,5 g de un residuo que consistió en 1-[2,6-dimetil-4-[1,2,2,2-tetrafluoro-1-(trifluorometil)etil]fenil]-4-yodo-pirazol y algo de tolueno.

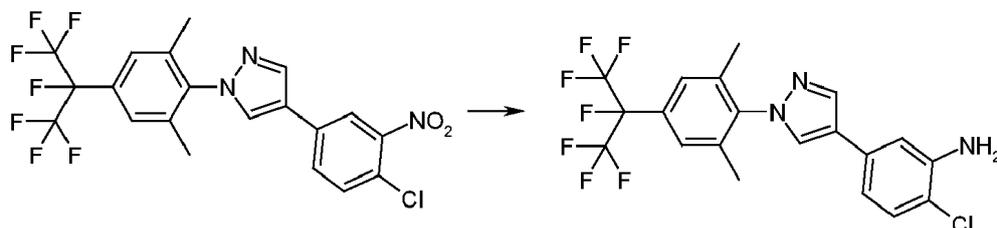
Etapa 3



Se dispuso 1 g (2,14 mmoles) de 1-[2,6-dimetil-4-[1,2,2,2-tetrafluoro-1-(trifluorometil)etil]fenil]-4-yodo-pirazol y 0,675 g (3 mmoles) de ácido 3-nitro-4-clorofenilborónico en 18 ml de 1,4-dioxano y se mezcló con 0,16 g (0,21 mmoles) de cloruro de 1,1'-bis(difenilfosfino)ferroceno-paladio (II) y 9,6 ml de una disolución acuosa 2 M de Na_2CO_3 . Se agitó la mezcla de reacción a 100 °C hasta la reacción completa. Después de enfriarse la mezcla de reacción, la mezcla de reacción completa se concentró sobre gel de sílice en el evaporador rotatorio y a continuación se purificó por cromatografía sobre gel de sílice (gradiente de ciclohexano-acetato de etilo). Se obtuvieron 0,86 g (78,1 % del teórico) como sólido incoloro.

$^1\text{H-RMN}$, 400 MHz, d_6 -DMSO, δ 8,71 (s, 1H), 8,44 (s, 1H), 8,39 (s, 1H), 8,02 (d, 1H), 7,82 (d, 1H), 7,60 (s, 2H), 2,13 (s, 6H).
lgP= 5,39; MH+ = 496. 0

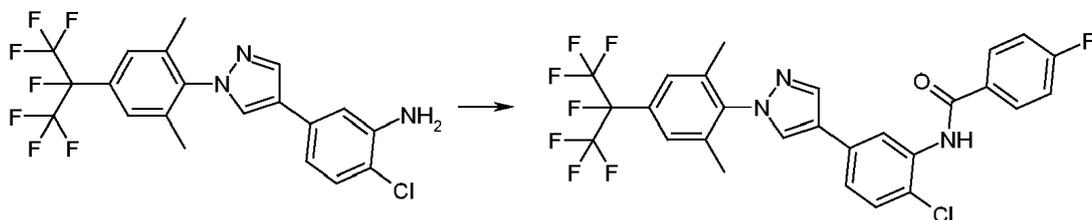
Etapa 4



Se disolvieron 0,86 g (10,7 mmoles) de 4-(4-cloro-3-nitro-fenil)-1-[2,6-dimetil-4-[1,2,2,2-tetrafluoro-1-(trifluorometil)etil]fenil]pirazol (Etapa 1) en 9 ml de 1,4-dioxano y a temperatura ambiente se añadieron 0,94 g (4,16 mmoles) de cloruro de estaño (II) dihidratado. La mezcla de reacción se enfrió a 0 °C, luego se añadieron gota a gota lentamente 6,5 ml de HCl conc. y a continuación se agitó 2 horas a reflujo. Después de terminar la reacción, el volumen de la mezcla de reacción se concentró a dos tercios en el evaporador rotatorio, luego se alcalinizó con disolución acuosa saturada de carbonato sódico. La mezcla acuosa se extrajo varias veces con diclorometano, se secaron las fases orgánicas reunidas sobre sulfato de magnesio, se filtraron y se concentraron, el residuo se purificó por cromatografía sobre gel de sílice (gradiente de ciclohexano-acetato de etilo). Se obtuvieron 0,48 g (73,5% del teórico) de un aceite amarillento.

$^1\text{H-RMN}$, 400 MHz, d_6 -DMSO, δ 8,38 (s, 1H), 8,07 (s, 1H), 7,58 (s, 2H), 7,20 (d, 1H), 7,05 (s, 1H), 6,86 (d, 1H), 5,34 (s, 2H, NH_2), 2,11 (s, 6H).
lgP = 4,93; MH+ = 466. 0

Etapa 5



Se disolvieron 80 mg (0,17 mmoles) de 2-cloro-5-[1-[2,6-dimetil-4-[1,2,2,2-tetrafluoro-1-(trifluorometil)etil]fenil]pirazol-4-il]anilina (Etapa 2) en 3 ml de THF y se mezclaron con 27,2 mg (0,17 mmoles) de cloruro de 4-fluorobenzoilo y 17,4 mg (0,17 mmoles) de trietilamina a temperatura ambiente y se agitó a reflujo con control por cromatografía en capa fina hasta conversión completa. Después de enfriarse se mezcló con 5 ml de agua y se extrajo varias veces con diclorometano. Se secaron las fases orgánicas reunidas sobre sulfato de magnesio, se filtraron y se concentraron, el residuo se purificó por cromatografía sobre gel de sílice (gradiente de ciclohexano-acetato de etilo).

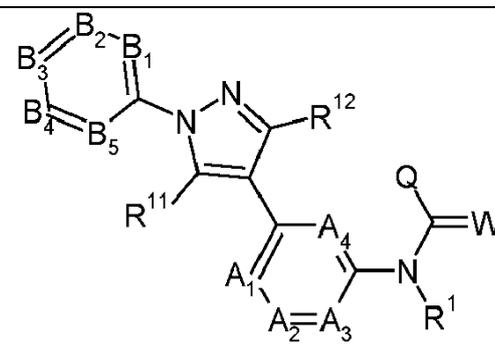
Se obtuvieron 70 mg (67,4 % del teórico) del compuesto objetivo como aceite amarillento.

$^1\text{H-NMR}$, 400 MHz, d_6 -DMSO, δ 10.21 (s, 1H, NH), 8.58 (s, 1H), 8.30 (s, 1H), 8.11 - 8.07 (dd, 2H), 7.85 (d, 1H), 7.64 - 7.57 (m, 4H), 7.42 - 7.37 (t, 2H), 2.13 (s, 6H).

$\text{lgP} = 5,57$; $\text{MH}^+ = 588,1$

Los compuestos citados en la Tabla 1 se representan con ayuda de los procedimientos de representación anteriormente descritos.

Tabla 1



A₁. B₂. B₄ = C-H; R¹¹ y R¹² = H; W = O.

Ej. N°	B ₁	B ₃	B ₅	R ¹	A ₂	A ₃	A ₄	Q	lgP ^{a)} o tiempo de retención [min] ^{b)}	Masa [m/z] ¹⁾
1	C-Cl	CF ₃	C-Cl	H	C-H	C-H	C-H	3-Cl-piridilo	lgP 4,19	511,0; 513,0
2	C-CH ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	H	C-H	C-Cl	C-H	4-Piridilo	lgP 4,41	571,1
3	C-Cl	CF ₃	C-Cl	H	C-H	C-H	C-H	4-Piridilo	lgP 3,2	477,0
4	C-CH ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	H	C-H	C-Cl	C-H	4-F-fenilo	lgP 5,57	588,1
5	C-CH ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	H	C-H	C-F	C-H	4-F-fenilo	lgP 5,07	572,1
6	C-CH ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	H	C-H	C-F	C-H	4-Piridilo	lgP 4,04	555,1
7	C-CH ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	H	C-H	C-F	C-F	4-F-fenilo	lgP 4,84	590,1
8	C-CH ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	H	C-H	C-Cl	C-H	3-F-fenilo	lgP 5,59	588,1
9	C-CH ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	H	C-H	C-F	C-F	4-Piridilo	lgP 3,92	573,1
10	C-CH ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	H	C-H	C-Cl	C-H	2-F-fenilo	lgP 6,06	588,1
11	C-CH ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	H	N	C-Cl	C-H	4-F-fenilo	lgP 5,14	589,1
12	C-CH ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	H	N	C-Cl	C-H	4-Piridilo	lgP 3,97	572,1

(continuación)

Ej. N°	B ₁	B ₃	B ₅	R ¹	A ₂	A ₃	A ₄	Q	IgP ^{a)} o tiempo de retención [min] ^{b)}	Masa [m/z] ¹⁾
13	C-CH3	C-i-C3F7	C-CH3	H	N	C-Cl	C-H	1-CN-1-ciclopropilo	IgP 4,69	560,0
14	C-CH3	C-i-C3F7	C-CH3	H	C-H	N	C-H	4-F-fenilo	IgP 4,69	555,1
15	C-CH3	C-i-C3F7	C-CH3	H	C-H	C-F	C-H	5 - Pirimidinilo	IgP 3,95	556,1
16	C-CH3	C-i-C3F7	C-CH3	H	C-H	C-F	C-H	6-Pirimidinilo	IgP 5,04	556,0
17	C-Cl	C-i-C3F7	C-Cl	H	N	C-CH3	C-H	4-F-fenilo	rt 1,19	609
18	C-Cl	C-i-C3F7	C-Cl	H	N	C-CH3	C-H	4-Piridilo	rt 1,05	592
19	C-Cl	C-i-C3F7	C-Cl	H	N	C-F	C-H	4-Piridilo	rt 3,75 ^{c)}	596
20	C-CH3	C-i-C3F7	C-CH3	H	C-H	C-N(CH3)2	C-H	4-Piridilo	rt 1,30	580
21	C-CH3	C-i-C3F7	C-CH3	H	C-H	C-N(CH3)2	C-H	4-F-fenilo	rt 1,43	597
22	C-Cl	C-i-C3F7	C-Cl	H	C-H	C-F	C-H	3-CFBO-4-F-fenilo	rt 1,36	642
23	C-CH3	C-i-C3F7	C-CF3	H	C-H	C-F	C-F	4-F-fenilo	rt 1,43	644
24	C-CH3	C-i-C3F7	C-CF3	H	N	C-Cl	C-H	3-CH3O-4-F-fenilo	rt 1,37	673
25	C-CH3	C-i-C3F7	C-CF3	H	C-H	C-F	C-F	4-Piridilo	rt 1,17	627
26	C-CH3	C-i-C3F7	C-CF3	H	C-H	C-F	C-F	2-Tiofenilo	rt 1,27	632
27	C-CH3	C-i-C3F7	C-CF3	H	C-H	C-F	C-F	3-CH3O-4-F-fenilo	rt 1,31	674
28	C-CH3	C-i-C3F7	C-CF3	H	C-H	C-F	C-H	3-CH3O-4-F-fenilo	rt 4,69 ^{c)}	656
29	C-CH3	C-i-C3F7	C-CF3	H	C-H	C-F	C-H	3-EtO-4-fenilo	rt 4,88 ^{c)}	670
30	C-CH3	C-i-C3F7	C-CF3	H	C-H	C-F	C-H	1-CH3-1-ciclopropilo	rt 1,39	586
31	C-CH3	C-i-C3F7	C-CF3	H	C-H	C-F	C-H	3-Tiofenilo	rt 1,36	614
32	C-CH3	C-i-C3F7	C-CF3	H	C-H	C-F	C-H	3-CFBO-fenilo	rt 1,40	638
33	C-CH3	C-i-C3F7	C-CF3	H	C-H	C-F	C-H	4-CN-fenilo	rt 4,48 ^{c)}	633
35	C-CH3	C-i-C3F7	C-CF3	H	C-H	C-F	C-H	3-CH3O-4-CN-fenilo	rt 1,37	663
36	C-CH3	C-i-C3F7	C-CF3	H	C-H	C-N(CH3)2	C-H	1-CFB-1-ciclopropilo	rt 1,51	611
37	C-CH3	C-i-C3F7	C-CF3	H	C-H	C-N(CH3)2	C-H	3-Tiofenilo	rt 1,42	639
38	C-CH3	C-i-C3F7	C-CF3	H	C-H	C-N(CH3)2	C-H	3-CFBO-4-F-fenilo	rt 1,30	610
39	C-CH3	C-i-C3F7	C-CF3	H	C-H	C-F	C-H	2-F-5-piridilo	rt 1,34	627

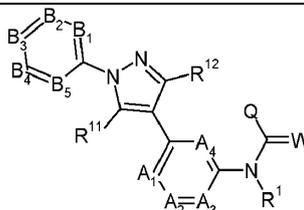
(continuación)

Ej. N°	B ₁	B ₃	B ₅	R ¹	A ₂	A ₃	A ₄	Q	IgP ^{a)} o tiempo de retención [min] ^{b)}	Masa [m/z] ¹⁾
40	C-CH3	C-i-C3F7	C-CF3	H	C-H	C-F	C-F	2-F-5-piridilo	rt 1,30	645
41	C-CH3	C-i-C3F7	C-CF3	CH3	C-H	C-F	C-F	2-F-5-piridilo	rt 1,37	659
42	C-CH3	C-i-C3F7	C-CF3	H	C-H	C-H	C-F	2-F-5-piridilo	rt 1,33	627
43	C-CH3	C-i-C3F7	C-CF3	H	C-H	C-H	C-F	Fenilo	rt 1,41	608
44	C-CH3	C-i-C3F7	C-CF3	CH3	C-H	C-H	C-F	2-F-5-piridilo	rt 1,36	641
45	C-CH3	C-i-C3F7	C-CF3	CH3	C-H	C-H	C-F	Fenilo	rt 1,38	622
46	C-CH3	C-i-C3F7	C-CF3	H	C-H	C-F	C-H	2-CN-5-piridilo	rt 1,30	634
47	C-CH3	C-i-C3F7	C-CF3	H	C-H	C-F	C-H	3-CH3O-4-CH3-fenilo	rt 1,41	652
48	C-CH3	C-i-C3F7	C-CF3	CH3	C-H	C-F	C-H	2-F-5-piridilo	rt 1,29	641
49	C-CH3	C-i-C3F7	C-CF3	H	C-H	C-F	C-H	2-Cl-5-piridilo	rt 1,35	643
50	C-CH3	C-i-C3F7	C-CF3	H	C-H	C-F	C-H	4-Piridilo	rt 1,20	609
51	C-CH3	C-i-C3F7	C-CF3	H	C-H	C-F	C-H	2-F-4-piridilo	rt 1,32	627
52	C-CH3	C-i-C3F7	C-CF3	H	C-H	C-F	C-H	3,4-(CH3)2-fenilo	rt 1,47	636
53	C-CH3	C-i-C3F7	C-CF3	H	C-H	C-F	C-H	3-CH3-4-F-fenilo	rt 1,40	640
54	C-CH3	C-i-C3F7	C-CF3	H	C-H	C-F	C-H	3-CH3-4-piridilo	rt 1,20	623
55	C-CH3	C-i-C3F7	C-CF3	H	C-H	C-F	C-H	3-F-4-MeO-fenilo	rt 1,34	656
56	C-CH3	C-i-C3F7	C-CF3	H	C-H	C-F	C-H	3-F-4-Cl-fenilo	rt 1,41	660
57	C-A	C-i-C3F7	C-CF3	H	C-H	C-H	C-F	4-F-fenilo	rt 1,39	672
58	C-A	C-i-C3F7	C-CF3	CH3	C-H	C-H	C-F	4-F-fenilo	rt 1,37	686
59	C-A	C-i-C3F7	C-CF3	H	C-H	C-H	C-F	4-Piridilo		
60	C-A	C-i-C3F7	C-CF3	CH3	C-H	C-H	C-F	4-Piridilo		
61	C-Cl	C-i-C3F7	C-CF3	H	C-H	C-H	C-F	4-F-fenilo		
62	C-Cl	C-i-C3F7	C-CF3	CH3	C-H	C-H	C-F	4-F-fenilo		
63	C-Cl	C-i-C3F7	C-CF3	H	C-H	C-H	C-F	4-Piridilo		
64	C-Cl	C-i-C3F7	C-CF3	CH3	C-H	C-H	C-F	4-Piridilo		
65	C-CH3	C-i-C3F7	C-CF3	H	C-H	C-F	C-F	3-Tietanilo	rt 1,30	622
66	C-CH3	C-i-C3F7	C-CF3	H	C-H	C-F	C-H	3-Tietanilo	rt 1,33	604
67	C-CH3	C-i-C3F7	C-CF3	H	C-H	C-H	C-F	2-F-4-piridilo	rt 2,46 ^{d)}	627
68	C-CH3	C-i-C3F7	C-CF3	H	C-H	C-H	C-F	4-Piridilo	rt 2,30 ^{d)}	609

(continuación)

Ej. N°	B ₁	B ₃	B ₅	R ¹	A ₂	A ₃	A ₄	Q	lgP ^{a)} o tiempo de retención [min] ^{b)}	Masa [m/z] ¹⁾
69	C-CH3	C-i-C3F7	C-CF3	H	C-H	C-H	C-F	2-CN-5- piridilo	rt 4,43 ^{c)}	634
70	C-CH3	C-i-C3F7	C-CF3	H	C-H	C-H	C-F	2-Cl-5-piridilo	rt 2,51 ^{d)}	643
71	C-CH3	C-i-C3F7	C-CF3	H	C-H	C-H	C-F	3-CH3O-4-F-fenilo	rt 4,69 ^{c)}	656
72	C-CH3	C-i-C3F7	C-CF3	H	C-H	C-H	C-F	3-F-4-CH3O-fenilo	rt 2,57 ^{d)}	656
73	C-CH3	C-i-C3F7	C-CF3	H	C-H	C-H	C-F	3-CFBO-fenilo	rt 2,41 ^{d)}	638
74	C-CH3	C-i-C3F7	C-CF3	H	C-H	C-H	C-F	3-CH3O-4-CN-fenilo	rt 1,32	663
75	C-CH3	C-i-C3F7	C-CF3	H	C-H	C-H	C-F	3-Tienilo	rt 1,33	614
76	C-CH3	C-i-C3F7	C-CF3	H	C-H	C-H	C-F	2-Tienilo	rt 1,33	614
77	C-CH3	C-i-C3F7	C-CF3	H	C-H	C-H	C-F	4-Oxazolilo	rt 1,39	599
78	C-CH3	C-i-C3F7	C-CH3	H	C-H	C-H	C-F	4-F-fenilo	lgP 5,22	572,1
79	C-CH3	C-i-C3F7	C-CH3	H	C-H	C-H	C-F	3-piridilo	lgP 4,14	555,1
80	C-CH3	C-i-C3F7	C-CH3	H	C-H	C-H	C-F	4-Piridilo	lgP 4,12	555,1

Tabla 2

A₂, B₂, B₄ = C-H; R¹¹ y R¹² = H; W = O.

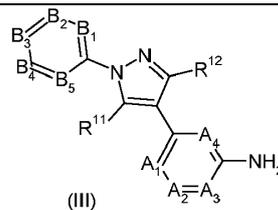
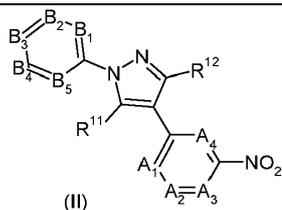
Ej. N°	B ₁	B ₃	B ₅	R ¹	A ₁	A ₃	A ₄	Q	Tiempo de retención [min] ^{d)}	Masa [m/z] ¹⁾
2-01	C-CH3	C-i-C3F7	C-CF3	H	C-F	C-H	C-H	2-F-4-piridilo	rt 2,53	627
2-02	C-CH3	C-i-C3F7	C-CF3	H	C-F	C-H	C-H	4-Piridilo	rt 2,38	609
2-03	C-CH3	C-i-C3F7	C-CF3	H	C-F	C-H	C-H	2-CN-5-piridilo	rt 2,49	634
2-04	C-CH3	C-i-C3F7	C-CF3	H	C-F	C-H	C-H	2-Cl-5-piridilo	rt 2,57	643
2-05	C-CH3	C-i-C3F7	C-CF3	H	C-F	C-H	C-H	3-CH3O-4-F-fenilo	rt 2,62	656
2-06	C-CH3	C-i-C3F7	C-CF3	H	C-F	C-H	C-H	3-F-4-CH3O-fenilo	rt 2,59	656

(continuación)

Ej. N°	B ₁	B ₃	B ₅	R ¹	A ₁	A ₃	A ₄	Q	Tiempo de retención [min] ^{d)}	Masa [m/z] ¹⁾
2-07	C-CH ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CF ₃	H	C-F	C-H	C-H	3-CH ₃ O-fenilo	rt 2,61	638
2-08	C-CH ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CF ₃	H	C-F	C-H	C-H	3-CH ₃ O-4-CN-fenilo	rt 2,55	663
2-09	C-CH ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CF ₃	H	C-F	C-H	C-H	3-Tienilo	rt 4,67 ^{c)}	613
2-10	C-CH ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CF ₃	H	C-F	C-H	C-H	Fenilo	rt 1,36 ^{b)}	607
2-11	C-CH ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CF ₃	H	C-F	C-H	C-H	5-Oxazolilo	rt 2,35	599
2-12	C-CH ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CF ₃	H	C-F	C-H	C-H	4-Oxazolilo	rt 1,28 ^{b)}	598
2-13	C-A	C-i-C ₃ F ₇	C-CF ₃	H	C-F	C-H	C-H	4-Piridilo	rt 2,30	673
2-14	C-A	C-i-C ₃ F ₇	C-CF ₃	H	C-F	C-H	C-H	4-Oxazolilo	rt 1,32	662

Tabla 3: Productos intermedios

Ej. N°	B ₁	B ₃	B ₅	A ₁	A ₂	A ₃	A ₄	IgP ^{a)} o tiempo de retención [min] ^{b)}	Masa [m/z] ¹⁾
II-1	C-Cl	C-CF ₃	C-Cl	C-H	C-H	C-H	C-H	IgP 4,32	402,0; 404,0
II-2	C-Cl	C-CF ₃	C-Cl	C-H	C-H	C-Cl	C-H		
II-3	C-Cl	C-CF ₃	C-Cl	C-H	C-H	C-F	C-H		
II-4	C-Cl	C-CF ₃	C-Cl	C-H	C-H	C-F	C-F		
II-5	C-Cl	C-CF ₃	C-Cl	C-H	C-H	C-H	C-F		
II-6	C-CH ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	C-H	C-H	C-H	C-H		
II-7	C-CH ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	C-H	C-H	C-Cl	C-H	IgP 5,39	496,0
II-8	C-CH ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	C-H	C-H	C-F	C-H		
II-9	C-CH ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	C-H	C-H	C-F	C-F		
II-10	C-CH ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	C-H	C-H	C-H	C-F		
II-11	C-CH ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CF ₃	C-H	C-H	C-H	C-H		
II-12	C-CH ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CF ₃	C-H	C-H	C-Cl	C-H		
II-13	C-CH ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CF ₃	C-H	C-H	C-F	C-H		



B₂, B₄ = C-H; R¹¹ y R¹²=H.

(continuación)

Ej. N°	B ₁	B ₃	B ₅	A ₁	A ₂	A ₃	A ₄	IgP ^{a)} o tiempo de retención [min] ^{b)}	Masa [m/z] ¹⁾
II-14	C-CH ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CF ₃	C-H	C-H	C-F	C-F		
II-15	C-CH ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CF ₃	C-H	C-H	C-H	C-F		
II-16	C-Cl	C-i-C ₃ F ₇	C-CF ₃	C-H	C-H	C-H	C-H		
II-17	C-Cl	C-i-C ₃ F ₇	C-CF ₃	C-H	C-H	C-Cl	C-H		
II-18	C-Cl	C-i-C ₃ F ₇	C-CF ₃	C-H	C-H	C-F	C-H		
II-19	C-Cl	C-i-C ₃ F ₇	C-CF ₃	C-H	C-H	C-F	C-F		
II-20	C-Cl	C-i-C ₃ F ₇	C-CF ₃	C-H	C-H	C-H	C-F		
II-21	C-A	C-i-C ₃ F ₇	C-CF ₃	C-H	C-H	C-H	C-H		
II-22	C-A	C-i-C ₃ F ₇	C-CF ₃	C-H	C-H	C-Cl	C-H		
II-23	C-A	C-i-C ₃ F ₇	C-CF ₃	C-H	C-H	C-F	C-H		
II-24	C-A	C-i-C ₃ F ₇	C-CF ₃	C-H	C-H	C-F	C-F		
II-25	C-A	C-i-C ₃ F ₇	C-CF ₃	C-H	C-H	C-H	C-F		
II-26	C-CH ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CF ₃	C-F	C-H	C-H	C-H		
II-27	C-A	C-i-C ₃ F ₇	C-CF ₃	C-F	C-H	C-H	C-H		
II-28	C-CH ₃	C-CF ₃	C-CH ₃	C-H	C-H	C-H	C-F		
III-1	C-Cl	CF ₃	C-Cl	C-H	C-H	C-H	C-H	IgP 2,90	371,9; 373,9
III-2	C-Cl	CF ₃	C-Cl	C-H	C-H	C-Cl	C-H		
III-3	C-Cl	CF ₃	C-Cl	C-H	C-H	C-F	C-H		
III-4	C-Cl	CF ₃	C-Cl	C-H	C-H	C-F	C-F		
III-5	C-Cl	CF ₃	C-Cl	C-H	C-H	C-H	C-F		
III-6	C-CH ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	C-H	C-H	C-H	C-H	rt 1,22	432
III-7	C-CH ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	C-H	C-H	C-Cl	C-H	IgP 4,93	466,0
III-8	C-CH ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	C-H	C-H	C-F	C-H	IgP 4,47	450,1
III-9	C-CH ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	C-H	C-H	C-F	C-F	IgP 4,81	468,1
III-10	C-CH ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	C-H	C-H	C-H	C-F	IgP 4,61	450,2
III-11	C-CH ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CF ₃	C-H	C-H	C-H	C-H		
III-12	C-CH ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CF ₃	C-H	C-H	C-Cl	C-H	rt 1,18	521
III-13	C-CH ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CF ₃	C-H	C-H	C-F	C-H	rt 1,59 ^{e)}	504
III-14	C-CH ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CF ₃	C-H	C-H	C-F	C-F	rt 1,35	522
III-15	C-CH ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CF ₃	C-H	C-H	C-H	C-F	rt 1,31	504
III-16	C-Cl	C-i-C ₃ F ₇	C-CF ₃	C-H	C-H	C-H	C-H		
III-17	C-Cl	C-i-C ₃ F ₇	C-CF ₃	C-H	C-H	C-Cl	C-H		

(continuación)

Ej. N°	B ₁	B ₃	B ₅	A ₁	A ₂	A ₃	A ₄	lgP ^{a)} o tiempo de retención [min] ^{b)}	Masa [m/z] ¹⁾
III-18	C-Cl	C-i-C ₃ F ₇	C-CF ₃	C-H	C-H	C-F	C-H	rt 1,31	490
III-19	C-Cl	C-i-C ₃ F ₇	C-CF ₃	C-H	C-H	C-F	C-F		
III-20	C-Cl	C-i-C ₃ F ₇	C-CF ₃	C-H	C-H	C-H	C-F		
III-21	C-A	C-i-C ₃ F ₇	C-CF ₃	C-H	C-H	C-H	C-H		
III-22	C-A	C-i-C ₃ F ₇	C-CF ₃	C-H	C-H	C-Cl	C-H		
III-23	C-A	C-i-C ₃ F ₇	C-CF ₃	C-H	C-H	C-F	C-H		
III-24	C-A	C-i-C ₃ F ₇	C-CF ₃	C-H	C-H	C-F	C-F		
III-25	C-A	C-i-C ₃ F ₇	C-CF ₃	C-H	C-H	C-H	C-F	rt 1,30	568
III-26	C-Cl	C-i-C ₃ F ₇	C-Cl	C-H	N	C-CH ₃	C-H	rt 0,82	487
III-27	C-Cl	C-i-C ₃ F ₇	C-Cl	C-H	N	C-CF ₃	C-H	rt 3,76 ^{c)}	491
III-28	C-CH ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	C-H	C-H	C-N(CH ₃) ₂	C-H	rt 1,17	475
III-29	C-CH ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	C-H	N	C-Cl	C-H	rt 1,20	467
III-30	C-CF ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	C-H	C-H	C-N(CH ₃) ₂	C-H	rt 1,56 ^{e)}	529
III-31	C-CF ₃	C-i-C ₃ F ₇	C-CH ₃	C-F	C-H	C-H	C-H		
III-32	C-A	C-i-C ₃ F ₇	C-CF ₃	C-F	C-H	C-H	C-H		
III-33	C-CH ₃	C-CF ₃	C-CH ₃	C-H	C-H	C-H	C-F		

^{a)} Nota para determinar los valores de logP (lgP): La determinación de los valores de logP especificados se realizó según la Directriz CEE 79/831 Anexo V.A8 por HPLC (cromatografía líquida de alta resolución) en una columna de fase inversa (C18). Sistema Agilent 1100 LC; 50×4,6 Zorbax Eclipse Plus C18 1,8 micrómetros; eluyente A acetonitrilo (0,1 % de ácido fórmico); eluyente B: agua (0,09 % de ácido fórmico); gradiente lineal de 10 % de acetonitrilo a 95 % de acetonitrilo en 4,25 min, luego 95 % de acetonitrilo durante 1,25 min adicionales; temperatura del horno 55 °C; caudal: 2,0 ml/min.

^{b)} Nota para determinar los tiempos de retención (tr): Instrumento: sistema Waters ACQUITY SQD UPLC; columna: Waters Acquity UPLC HSS T3 1,8 μ 50 x 1 mm; eluyente A 1 l de agua + 0,25 ml de ácido fórmico al 99 %, eluyente B: 1 l de acetonitrilo + 0,25 ml de ácido fórmico al 99 %; gradiente: 0,0 min 90 % de A → 1,2 min 5 % de A → 2,0 min 5 % de A; horno: 50 °C; caudal: 0,40 ml/min; detección UV: 208 - 400 nm.

^{c)} Nota para determinar los tiempos de retención (tr): Instrumento: sistema Waters ACQUITY SQD UPLC; columna: Waters Acquity UPLC HSS T3 1,8 μ 50 x 1 mm; eluyente A 1 l de agua + 0,25 ml de ácido fórmico al 99 %, eluyente B: 1 l de acetonitrilo + 0,25 ml de ácido fórmico al 99 %; gradiente: 0,0 min 95 % de A → 6,0 min 5 % de A → 7,5 min 5 % de A; horno: 50 °C; caudal: 0,35 ml/min; detección UV: 210 - 400nm.

^{d)} Nota para determinar los tiempos de retención (tr): Instrumento: UHPLC+: Thermo Scientific UltiMate 3000; columna: Waters, HSST3, 2,1 x 75 mm, C18 1,8 μm; eluyente A 1 l de agua + 0,01 % de ácido fórmico; eluyente B: 1 l de acetonitrilo + 0,01 % de ácido fórmico; gradiente: 0,0 min 10 % de B → 2,5 min 95 % de B → 3,5 min 95 % de B; horno: 50 °C; caudal: 0,90 ml/min; detección UV: 210 nm/ óptimo de la trayectoria de integración 210-300 nm.

^{e)} Nota para determinar los tiempos de retención (tr): Instrumento: Agilent MS Quad 6150; HPLC: Agilent 1290; columna: Waters Acquity UPLC HSS T3 1,8 μ 50 x 2,1 mm; eluyente A 1 l de agua + 0,25 ml de ácido fórmico al 99 %, eluyente B: 1 l de acetonitrilo + 0,25 ml de ácido fórmico al 99 %; gradiente: 0,0 min 90 % de A → 0,3 min 90 % de A → 1,7 min 5 % de A → 3,0 min 5 % de A; horno: 50 °C; caudal: 1,20 ml/min; detección UV: 205 - 305 nm.

¹⁾ La detección de masa se realizó mediante un sistema Agilent MSD o un Thermo Scientific FT-MS. En el caso de la masa especificada se trata del pico del patrón del isótopo del ion [M+H]⁺ con la intensidad más alta.

Datos de RMN de ejemplos seleccionados

Listas de picos de RMN

ES 2 836 399 T3

(continuación)

Ejemplo 3:	¹ H-RMN(400,0 MHz, d ₆ -DMSO):	δ=
10,566(3,8);8,813(5,9);8,809(3,9);8,802(3,8);8,798(6,3);8,537(7,0);8,262(16,0);8,051(3,5);7,896(5,8);7,892(3,9);7,885(3,7);7,881(5,8);7,678(1,6);7,659(1,9);7,477(1,2);7,473(0,9);7,457(3,5);7,447(3,0);7,428(3,1);7,409(1,0);4,056(0,5);4,038(1,5);4,020(1,5);4,003(0,5);3,326(32,7);2,511(17,9);2,507(35,6);2,503(47,2);2,498(35,6);1,989(6,4);1,193(1,7);1,175(3,4);1,158(1,7);0,008(2,5);0,000(58,5);-0,008(3,0)		
Ejemplo 4:	¹ H-RMN(400,0MHz,d ₆ -DMSO):	δ=
10,208(2,2);8,580(3,3);8,316(0,7);8,305(3,4);8,109(1,3);8,104(0,6);8,096(1,5);8,087(1,6);8,079(0,6);8,073(1,4);7,849(1,8);7,844(2,0);7,644(0,7);7,639(0,6);7,623(1,5);7,618(1,5);7,592(4,8);7,572(1,3);7,415(1,5);7,393(2,9);7,376(0,5);7,371(1,4);3,324(175,7);2,675(1,0);2,671(1,4);2,666(1,1);2,662(0,6);2,524(3,3);2,511(75,9);2,506(157,4);2,502(212,1);2,497(158,1);2,493(80,0);2,333(1,0);2,328(1,3);2,324(1,0);2,127(16,0);2,098(0,4);1,398(8,1);0,008(0,8);0,000(24,9);-0,008(1,1)		
Ejemplo 5:	¹ H-RMN(400,0 MHz, d ₆ -DMSO):	δ=
10,230(2,1);8,509(3,3);8,239(3,3);8,098(1,3);8,093(0,6);8,085(1,5);8,076(1,6);8,068(0,6);8,063(1,4);7,844(0,8);7,838(0,8);7,825(0,8);7,820(0,8);7,607(0,5);7,602(0,6);7,587(4,1);7,575(0,7);7,569(0,5);7,410(1,5);7,405(0,5);7,388(3,0);7,370(1,4);7,365(1,6);7,349(0,9);7,345(1,1);7,323(0,8);3,325(31,4);2,675(0,3);2,671(0,5);2,666(0,3);2,524(1,1);2,511(25,3);2,506(51,9);2,502(69,0);2,497(50,4);2,493(24,6);2,328(0,4);2,324(0,3);2,127(16,0);1,398(5,4);0,008(0,5);0,000(13,7);-0,009(0,5)		
Ejemplo 6:	¹ H-RMN(400,0 MHz, d ₆ -DMSO):	δ=
10,514(1,9);8,821(2,7);8,817(1,7);8,809(1,7);8,805(2,9);8,519(3,2);8,245(3,3);7,905(2,2);7,902(1,5);7,894(1,4);7,890(2,1);7,874(0,8);7,869(0,8);7,856(0,8);7,851(0,8);7,637(0,4);7,631(0,4);7,625(0,5);7,619(0,5);7,615(0,5);7,610(0,6);7,604(0,6);7,598(0,7);7,588(3,5);7,396(0,9);7,374(0,9);7,371(1,0);7,349(0,7);4,038(0,4);4,020(0,4);3,326(38,2);3,325(38,3);2,675(0,4);2,671(0,6);2,666(0,4);2,524(1,2);2,519(1,9);2,511(30,0);2,506(62,9);2,502(84,5);2,497(61,1);2,493(29,2);2,333(0,4);2,329(0,5);2,324(0,4);2,128(16,0);1,989(1,7);1,193(0,4);1,175(0,9);1,157(0,4);0,008(0,3);0,000(11,6);-0,009(0,4)		
Ejemplo 7:	¹ H-RMN(400,0 MHz, d ₆ -DMSO):	δ=
10,264(2,3);8,513(2,0);8,271(2,3);8,113(1,2);8,099(1,5);8,091(1,6);8,077(1,3);7,822(0,7);7,807(0,7);7,786(0,4);7,592(4,0);7,428(1,4);7,406(2,7);7,384(1,4);7,330(0,6);7,308(1,1);7,286(0,5);3,326(27,0);2,506(38,2);2,502(49,1);2,498(37,6);2,121(16,0);1,989(0,5);1,398(9,2);0,000(4,3)		
Ejemplo 8:	¹ H-RMN(400,0 MHz, d ₆ -DMSO):	δ=
10,290(2,2);8,585(3,3);8,309(3,4);7,887(0,9);7,868(1,1);7,851(1,9);7,846(2,0);7,821(0,5);7,815(0,7);7,811(0,6);7,796(0,6);7,790(0,7);7,656(0,7);7,651(0,7);7,635(1,7);7,630(2,0);7,613(0,9);7,608(0,8);7,602(3,0);7,591(4,0);7,581(1,6);7,510(0,5);7,505(0,4);7,490(0,7);7,484(0,7);7,468(0,3);3,325(29,0);2,671(0,4);2,524(1,1);2,511(23,7);2,506(49,2);2,502(66,0);2,497(48,5);2,493(23,8);2,328(0,4);2,128(16,0);1,398(3,5);0,000(7,4)		
Ejemplo 9:	¹ H-RMN(400,0 MHz, d ₆ -DM SO):	δ=
10,583(2,1);8,843(2,5);8,839(1,7);8,832(1,7);8,828(2,7);8,526(1,8);8,524(1,9);8,278(2,2);7,922(2,2);7,911(1,6);7,907(2,2);7,874(0,3);7,859(0,5);7,853(0,7);7,838(0,7);7,832(0,4);7,816(0,3);7,594(3,8);7,357(0,5);7,334(1,0);7,314(0,5);5,758(5,5);3,332(6,8);2,513(5,9);2,508(11,9);2,504(15,9);2,499(11,7);2,495(5,8);2,124(16,0);1,990(1,1);1,176(0,6);0,000(1,3)		
Ejemplo 10:	¹ H-RMN(400,0 MHz, d ₆ -DMSO):	δ=
10,056(1,2);10,049(1,2);8,589(2,6);8,290(2,5);8,013(1,1);7,813(0,4);7,796(0,9);7,778(0,5);7,633(0,6);7,619(0,9);7,592(7,4);7,571(0,4);7,407(0,6);7,388(1,1);7,371(1,4);7,353(0,8);3,326(32,1);2,671(0,4);2,502(55,8);2,329(0,3);2,131(16,0);1,398(7,3);0,000(2,3)		
Ejemplo 11:	¹ H-RMN(400,0 MHz, d ₆ -DMSO):	δ=
10,370(2,1);8,714(2,1);8,708(2,2);8,700(3,3);8,423(3,4);8,325(2,0);8,319(2,0);8,121(1,4);8,116(0,6);8,107(1,5);8,099(1,6);8,090(0,6);8,085(1,5);7,602(3,6);7,439(1,5);7,434(0,5);7,417(2,9);7,400(0,5);7,395(1,4);3,334(60,4);2,676(0,5);2,671(0,7);2,666(0,5);2,524(1,8);2,519(2,7);2,511(38,6);2,506(79,4);2,502(105,6);2,497(77,2);2,493(37,7);2,333(0,5);2,329(0,7);2,324(0,5);2,133(16,0);1,398(4,9);0,146(0,5);0,008(3,3);0,000(104,1);-0,009(3,5);-0,150(0,5)		

ES 2 836 399 T3

(continuación)

Ejemplo 12:	¹ H-RMN(400,0 MHz,	d ₆ -DMSO):	δ=
8,845(2,8);8,841(1,8);8,834(1,8);8,830(3,0);8,734(2,1);8,729(2,1);8,704(3,3);8,424(3,4);8,357(2,3);8,351(2,2);7,926(2,8);7,922(1,8);7,915(1,7);7,911(2,8);7,603(3,7);5,758(1,4);3,329(9,0);2,672(0,3);2,525(0,9);2,511(16,7);2,507(3 3,6);2,502(44,3);2,498(32,5);2,494(16,0);2,134(16,0);0,008(1,0);0,000(31,3);-0,009(1,1)			
Ejemplo 13:	¹ H-RMN(400,0 MHz,	d ₆ -DMSO):	δ= 10,
107(1,2);8,694(2,2);8,688(2,2);8,672(3,3);8,389(3,3);8,232(2,1);8,226(2,1);7,600(3,7);6,712(1,9);3,605(1,2);3,587(2,5);3,570(1,2);3,325(16,2);2,995(15,3);2,951(0,6);2,671(0,4);2,549(0,4);2,524(0,9);2,511(20,1);2,506(40,9);2,502(54,3);2,497(40,2);2,493(19,9);2,434(0,9);2,416(1,9);2,399(0,9);2,329(0,3);2,121(16,0);1,796(0,7);1,782(1,7);1,773(2,5);1,764(1,2);1,727(0,4);1,691(1,2);1,681(2,5);1,672(1,7);1,658(0,7);1,423(0,6);1,398(0,3);1,235(0,3);0,008(1,1);0,000(35,3);-0,009(1,4)			
Ejemplo 14:	¹ H-RMN(400,0 MHz,	d ₆ -DMSO):	δ=
10,846(1,9);8,751(3,3);8,401(2,1);8,389(1,6);8,371(3,7);8,151(1,4);8,145(0,6);8,137(1,6);8,128(1,6);8,120(0,6);8,115(1,5);7,604(3,7);7,477(1,1);7,473(1,2);7,464(1,1);7,460(1,2);7,380(1,5);7,357(2,9);7,340(0,5);7,335(1,5);5,758(0,8);4,038(0,4);4,020(0,4);3,324(18,9);3,175(0,4);3,162(0,4);2,671(0,4);2,524(1,1);2,511(23,2);2,507(47,3);2,502(62,9);2,498(46,8);2,493(23,5);2,329(0,4);2,134(16,0);1,989(1,6);1,193(0,4);1,175(0,8);1,157(0,4);0,008(2,0);0,000(58,5);-0,008(2,2)			
Ejemplo 15:	¹ H-RMN(400,0MHz,	d ₆ -DMSO):	δ=
10,626(2,0);9,397(3,6);9,300(6,0);8,516(3,3);8,316(0,5);8,229(3,4);7,944(0,8);7,938(0,8);7,925(0,8);7,920(0,8);7,630(0,4);7,624(0,5);7,618(0,5);7,612(0,5);7,609(0,6);7,603(0,7);7,589(3,8);7,409(0,9);7,387(0,8);7,383(1,0);7,362(0,7);4,038(0,3);4,020(0,3);3,323(131,1);2,675(1,2);2,671(1,7);2,666(1,3);2,524(4,3);2,510(88,3);2,506(185,2);2,501(251,6);2,497(189,6);2,493(96,7);2,333(1,1);2,328(1,6);2,324(1,2);2,128(16,0);1,989(1,5);1,233(0,4);1,193(0,4);1,175(0,8);1,157(0,5);0,146(1,0);0,008(6,9);0,000 227,9);-0,009(9,3);-0,150(1,0)			
Ejemplo 16:	¹ H-RMN(400,0 MHz,	d ₆ -DMSO):	δ=
10,622(1,9);9,460(2,0);9,457(2,1);9,178(2,1);9,166(2,1);8,521(3,2);8,228(3,3);8,175(0,4);8,165(1,4);8,161(1,4);8,152(2,2);8,149(2,1);8,137(0,9);8,132(0,8);8,101(0,3);8,080(0,4);7,607(0,5);7,589(4,3);7,573(0,7);7,568(0,7);7,419(0,9);7,398(0,9);7,393(1,0);7,372(0,7);6,640(0,9);3,324(33,3);2,671(0,4);2,511(22,2);2,507(43,2);2,502(56,2);2,498(41,9);2,494(21,3);2,32F (0,4);2,132(16,0);2,111(0,4);1,989(0,7);1,398(1,0);1,175(0,4);0,008(2,3);0,000(50,8);-0,008(2,3)			
Ejemplo 78:	¹ H-RMN(400,0 MHz,	d ₆ -DMSO):	δ=
10,211(2,1);8,514(2,1);8,274(2,2);8,100(1,4);8,086(1,6);8,078(1,7);8,064(1,4);8,009(0,4)8,001(0,4);7,987(0,3);7,708(0,5);7,691(1,0);7,674(0,6);7,592(4,1);7,492(0,5);7,474(1,0);7,456(0,6);7,404(1,5);7,382(2,8);7,360(1,4);7,342(0,3);7,319(0,6);7,297(0,4);7,287(0,9);7,268(1,5);7,248(0,7);3,320(10,8);2,507(18,6);2,503(23,5);2,498(17,7);2,130(16,0);1,398(11,4);0,00C (24,6)			
Ejemplo 79:	¹ H-RMN(400,0 MHz,	d ₆ -DMSO):	δ=
10,418(2,1);9,153(1,7);9,149(1,7);8,795(1,2);8,792(1,2);8,783(1,3);8,779(1,2);8,524(2,1)8,345(1,0);8,340(0,7);8,330(0,7);8,325(1,0);8,321(0,7);8,281(2,3);7,725(0,5);7,709(1,0);7,691(0,6);7,604(1,2);7,594(4,9);7,574(0,9);7,539(0,5);7,521(1,0);7,504(0,6);7,304(0,9);7,285(1,5);7,265(0,7);5,754(4,5);3,321(10,1);2,507(14,4);2,503(18,3);2,499(13,8);2,132(16,0);1,989(1,1);1,176(0,6);1,072(0,7);0,000(20,7)			
Ejemplo 80:	¹ H-RMN(400,0 MHz,	d ₆ -DMSO):	δ=
10,493(2,2);8,817(2,7);8,813(1,9);8,806(1,8);8,802(3,0);8,524(2,0);8,280(2,2);7,907(2,5)7,903(1,8);7,896(1,7);7,892(2,6);7,738(0,5);7,721(0,9);7,705(0,5);7,701(0,5);7,593(3,9);7,522(0,4);7,504(0,9);7,488(0,5);7,309(0,8);7,290(1,5);7,270(0,7);5,753(8,6);3,320(14,4);3,179(0,5);3,166(0,5);2,892(0,5);2,733(0,5);2,507(12,4);2,503(17,5);2,499(13,4);2,131 (16,0); 1,989(0,5);0,000(3,1)			

Tabla 5: Lista de picos de RMN (2)

Número de ejemplo	Lista de picos de RMN
17	1 H-RMN (400 MHz, DMSO-d6) delta [ppm]: -0,149 (0,49), -0,008 (4,55), 0,008 (3,94), 0,146 (0,49), 2,322 (0,42), 2,327 (0,54), 2,366 (0,84), 2,456 (16,00), 2,522 (1,28), 2,665 (0,39), 2,669 (0,57), 2,674 (0,44), 2,709 (0,84), 7,380 (2,83), 7,386 (0,91), 7,397 (1,11), 7,403 (5,86), 7,408 (1,13), 7,419 (0,96), 7,425 (3,03), 8,021 (3,18), 8,027 (3,15), 8,074 (2,86), 8,079 (1,40), 8,087 (4,80), 8,092 (11,77), 8,096 (5,44), 8,104 (1,38), 8,110 (2,78), 8,435 (5,93), 8,437 (6,18), 8,717 (3,69), 8,722 (3,67), 8,735 (6,01), 8,737 (6,13), 10,164 (4,04).
18	1H-RMN (400 MHz, DMSO-d6) delta [ppm]: -0,141 (1,75), -0,000 (15,95), 0,016 (14,47), 0,154 (1,81), 1,156 (0,77), 2,335 (1,64), 2,374 (2,25), 2,473 (16,00), 2,677 (1,86), 2,718 (2,36), 3,293 (1,59), 7,912 (4,11), 7,927 (4,44), 8,059 (3,01), 8,064 (3,12), 8,101 (10,03), 8,447 (5,81), 8,751 (8,16), 8,825 (4,71), 8,829 (3,23), 8,836 (3,07), 8,840 (4,66), 10,437 (4,00).
19	1 H-RMN (400 MHz, DMSO-d6) delta [ppm]: -0,149 (0,95), -0,008 (7,93), 0,008 (7,34), 0,146 (0,91), 1,237 (0,41), 2,323 (0,59), 2,328 (0,82), 2,332 (0,68), 2,366 (1,59), 2,524 (2,13), 2,665 (0,63), 2,670 (0,91), 2,674 (0,68), 2,710 (1,63), 3,287 (1,04), 5,527 (7,89), 7,315 (2,90), 7,320 (3,04), 7,341 (2,95), 7,347 (2,99), 7,641 (3,22), 7,647 (5,89), 7,652 (3,04), 7,889 (6,48), 7,893 (3,94), 7,900 (3,99), 7,904 (6,71), 8,078 (16,00), 8,099 (11,69), 8,248 (9,56), 8,250 (9,34), 8,454 (7,03), 8,456 (7,25), 8,467 (9,38), 8,486 (2,36), 8,491 (1,54), 8,571 (9,20), 8,573 (9,56), 8,764 (6,48), 8,766 (6,75), 8,818 (6,39), 8,822 (3,81), 8,829 (3,72), 8,833 (6,12), 10,710 (1,86).
20	1H-RMN(400 MHz, DMSO-d6) delta [ppm]: -0,008 (1,44), 0,008 (1,27), 2,127 (12,94), 2,684(16,00), 7,208 (1,14), 7,229 (1,30), 7,479 (0,89), 7,484 (0,87), 7,500 (0,72), 7,505 (0,74), 7,577 (2,90), 7,881 (1,48), 7,886 (1,07), 7,892 (1,11), 7,897 (1,52), 8,017 (1,13), 8,022 (1,10), 8,159 (2,44), 8,160 (2,35), 8,426 (2,51), 8,428 (2,44), 8,797 (1,97), 8,801 (1,21), 8,808 (1,22), 8,812 (1,86), 9,924 (1,48).
21	1 H-RMN (400 MHz, DMSO-d6) delta [ppm]: -0,008 (0,92), 0,008 (0,90), 2,126 (11,89), 2,519 (0,43), 2,678 (16,00), 7,210 (1,22), 7,231 (1,40), 7,363 (1,06), 7,380 (0,46), 7,385 (2,17), 7,391 (0,45), 7,408 (1,12), 7,446 (0,82), 7,452 (0,82), 7,467 (0,67), 7,473 (0,70), 7,576 (2,69), 8,044 (1,07), 8,050 (0,48), 8,058 (1,26), 8,064 (2,01), 8,066 (2,00), 8,070 (1,56), 8,075 (0,58), 8,080 (1,02), 8,148 (2,19), 8,150 (2,34), 8,417 (2,22), 8,419 (2,28), 9,652 (1,45).
22	1H-RMN(400 MHz, DMSO-d6) delta [ppm]: -0,008 (0,43), 0,008 (0,44), 3,937 (16,00), 7,350 (1,03), 7,368 (1,45), 7,371 (1,58), 7,376 (1,24), 7,389 (1,56), 7,396 (2,16), 7,417 (1,40), 7,571 (0,65), 7,577 (0,73), 7,583 (0,76), 7,589 (0,75), 7,593 (0,69), 7,599 (0,69), 7,604 (0,61), 7,610 (0,64), 7,616 (0,73), 7,622 (0,80), 7,627 (0,80), 7,633 (0,80), 7,637 (0,69), 7,643 (0,74), 7,649 (0,64), 7,654 (0,63), 7,764 (1,23), 7,769 (1,17), 7,784 (1,23), 7,790 (1,15), 7,826 (1,14), 7,831 (1,14), 7,844 (1,16), 7,850 (1,07), 8,084 (7,03), 8,338 (4,17), 8,340 (4,18), 8,636 (4,10), 8,638 (4,14), 10,221 (2,95).
23	1H-RMN(400 MHz, DMSO-d6) delta [ppm]: -0,008(1,78), 0,008 (1,65), 1,148(0,43), 2,138(16,00), 2,150 (12,05), 2,328 (0,48), 2,367 (0,78), 2,670 (0,48), 2,710 (0,78), 3,289 (1,21), 3,335 (0,95), 5,272 (4,99), 5,885 (1,78), 6,881 (0,52), 6,896 (0,69), 6,903 (1,21), 6,918 (1,43), 6,922 (1,52), 6,938 (2,34), 6,942 (1,73), 6,964 (1,95), 6,968 (1,39), 6,988 (0,69), 7,295 (3,25), 7,300 (2,91), 7,316 (1,34), 7,318 (1,34), 7,321 (1,21), 7,341 (0,69), 7,343 (0,69), 7,381 (2,12), 7,386 (0,74), 7,403 (4,38), 7,420 (0,74), 7,425 (2,30), 7,654 (1,60), 7,659 (1,56), 7,794 (0,48), 7,809 (0,61), 7,815 (0,95), 7,830 (0,95), 7,837 (0,65), 7,852 (0,48), 7,911 (3,60), 7,919 (1,95), 8,074 (2,08), 8,079 (0,95), 8,088 (2,34), 8,096 (2,38), 8,104 (0,95), 8,110 (2,12), 8,187 (2,60), 8,203 (2,17), 8,213 (4,38), 8,217 (3,38), 8,341 (3,64), 8,440 (2,78), 8,446 (2,64), 8,572 (2,25), 10,258 (3,64).
24	1H-RMN(400 MHz, DMSO-d6) delta [ppm]: -0,008(0,84), 0,008 (0,77), 2,163(10,26), 3,288(0,64), 3,939 (16,00), 7,396 (1,19), 7,417 (1,46), 7,424 (1,23), 7,445 (1,39), 7,643 (0,69), 7,648 (0,82), 7,654 (0,80), 7,659 (0,84), 7,664 (0,69), 7,669 (0,73), 7,675 (0,62), 7,681 (0,66), 7,772 (1,25), 7,777 (1,19), 7,793 (1,23), 7,798 (1,12), 7,933 (1,78), 8,219 (1,80), 8,314 (2,98), 8,320 (3,08), 8,484 (4,01), 8,485 (4,63), 8,716 (2,99), 8,722 (2,98), 8,778 (3,56), 10,357 (3,01).
25	1 H-RMN (400 MHz, DMSO-d6) delta [ppm]: -0,149 (0,99), -0,008 (9,64), 0,008 (7,24), 0,146 (0,93), 1,147 (0,64), 2,073 (0,47), 2,150 (16,00), 2,366 (2,22), 2,558 (1,52), 2,671 (0,70), 2,710 (2,28), 3,287 (2,63), 7,320 (0,93), 7,341 (1,87), 7,344 (1,99), 7,366 (0,99), 7,821 (0,64), 7,842 (1,23), 7,857 (1,28), 7,879 (0,64), 7,900 (4,79), 7,904 (3,33), 7,911 (4,91), 7,915 (7,59), 8,200 (2,80), 8,347 (5,02), 8,583 (3,27), 8,822 (5,66), 8,827 (3,39), 8,833 (3,56), 8,838 (5,20), 10,574 (3,50).

ES 2 836 399 T3

(continuación)

Número de ejemplo	Lista de picos de RMN
26	1H-RMN (400 MHz, DMSO-d6) delta [ppm]: -0,149 (0,55), -0,008 (4,90), 0,008 (4,45), 0,146 (0,55), 2,138 (10,12), 2,150 (16,00), 2,367 (0,67), 2,710 (0,71), 3,288 (0,91), 5,273 (3,13), 6,896 (0,43), 6,903(0,75), 6,918 (0,89), 6,922 (0,89), 6,938 (1,50), 6,964 (1,20), 6,988 (0,45), 7,245 (2,38), 7,255 (2,58), 7,258 (2,62), 7,267 (2,48), 7,297 (0,94), 7,299 (0,89), 7,318 (1,85), 7,320 (1,89), 7,322 (1,81), 7,340 (1,04), 7,795 (0,69), 7,810 (0,89), 7,817 (1,26), 7,831 (1,28), 7,838 (0,77), 7,853 (0,65), 7,900 (2,91), 7,903 (3,90), 7,912 (5,55), 7,916 (5,61), 8,019 (2,52), 8,022 (2,58), 8,029 (2,62), 8,032 (2,34), 8,187 (1,69), 8,201 (2,93), 8,214 (2,97), 8,343 (4,88), 8,441 (1,81), 8,446 (1,65), 8,578 (2,93), 8,584 (2,60), 10,260 (4,84).
27	1H-RMN(400 MHz, DMSO-d6) delta [ppm]: -0,008 (2,53), 0,008 (2,23), 2,073 (1,39), 2,139 (4,48), 2,151 (10,87), 2,367 (0,44), 2,711 (0,44), 3,288 (0,56), 3,936 (16,00), 5,272 (1,32), 6,938 (0,66), 6,964 (0,53), 7,301 (0,60), 7,303 (0,64), 7,323 (1,27), 7,325 (1,31), 7,327 (1,21), 7,346 (0,68), 7,348 (0,68), 7,350 (0,64), 7,383 (1,18), 7,404 (1,48), 7,410 (1,24), 7,432 (1,38), 7,630 (0,68), 7,635 (0,79), 7,641 (0,78), 7,646 (0,79), 7,651 (0,68), 7,656 (0,72), 7,662 (0,64), 7,667 (0,62), 7,768 (1,24), 7,774 (1,17), 7,789 (1,26), 7,794 (1,29), 7,813 (0,60), 7,819 (0,88), 7,834 (0,89), 7,841 (0,59), 7,856 (0,44), 7,904 (0,71), 7,921 (1,67), 8,186 (0,74), 8,201 (1,92), 8,214 (1,30), 8,217 (0,92), 8,345 (3,40), 8,441 (0,80), 8,446 (0,73), 8,577 (2,10), 8,583 (1,84), 10,249 (3,29).
28	1H-RMN(500 MHz, DICLOROMETANO-d2) delta [ppm]: 0,862(1,34), 0,876 (1,50), 0,881 (1,56), 0,891 (1,02), 1,265 (5,16), 1,524 (13,20), 2,167 (12,03), 3,970 (16,00), 5,331 (7,63), 5,332 (11,90), 7,183 (1,30), 7,191 (1,28), 7,199 (1,75), 7,204 (1,64), 7,209 (1,86), 7,213 (1,47), 7,221 (1,71), 7,230 (1,60), 7,307 (0,82), 7,312 (1,00), 7,317 (1,01), 7,321 (1,03), 7,329 (0,83), 7,334 (0,75), 7,339 (0,71), 7,395(0,75), 7,400 (0,96), 7,404 (1,04), 7,408 (0,91), 7,412 (0,90), 7,417 (0,90), 7,421 (0,82), 7,425 (0,78), 7,592 (1,38), 7,597 (1,42), 7,609 (1,39), 7,613 (1,36), 7,842 (2,19), 7,852 (3,86), 7,910 (2,06), 8,070 (4,14), 8,071 (4,07), 8,642 (1,24), 8,646 (1,37), 8,657 (1,37), 8,661 (1,30).
29	1H-RMN(500 MHz, DICLOROMETANO-d2) delta [ppm]: 1,266(1,01), 1,387 (1,02), 1,401 (2,10), 1,415 (1,04), 1,457 (6,15), 1,470 (12,66), 1,484 (6,20), 1,538 (3,66), 2,142 (2,79), 2,167 (16,00), 4,043 (0,94), 4,057 (0,92), 4,177 (1,86), 4,191 (5,72), 4,205 (5,60), 4,219 (1,72), 5,332 (4,75), 7,176 (1,86), 7,187 (1,70), 7,193 (2,36), 7,197 (2,06), 7,204 (2,36), 7,208 (1,86), 7,214 (2,72), 7,225 (2,15), 7,231 (0,64), 7,250 (0,56), 7,304 (1,14), 7,308 (1,19), 7,313 (1,24), 7,318 (1,25), 7,321 (1,05), 7,325 (0,98), 7,330 (0,89), 7,335 (0,85), 7,385 (1,09), 7,390 (1,21), 7,394 (1,20), 7,398 (1,20), 7,402 (1,04), 7,407 (1,12), 7,411 (1,25), 7,415 (1,21), 7,574 (1,93), 7,578 (1,82), 7,584 (0,40), 7,590 (1,92), 7,594 (1,82), 7,781 (0,71), 7,843 (2,78), 7,850 (4,29), 7,851 (4,74), 7,853 (3,40), 7,911 (2,67), 7,916 (2,07), 7,992 (0,92), 7,994 (0,93), 8,040 (1,27), 8,047 (1,25), 8,068 (5,50), 8,070 (5,56), 8,638 (1,67), 8,643 (1,65), 8,653 (1,68), 8,658 (1,57), 9,366 (0,83), 9,367 (0,79).
30	1 H-RMN (400 MHz, DMSO-d6) delta [ppm]: -0,149 (1,00), -0,008 (9,17), 0,008 (7,82), 0,146 (1,00), 0,648 (1,53), 0,658 (4,73), 0,665 (4,80), 0,674 (1,67), 1,080 (1,53), 1,088 (4,02), 1,095 (3,84), 1,104 (1,32), 1,146 (0,50), 1,407 (16,00), 2,142 (13,40), 2,328 (0,46), 2,366 (0,39), 2,670 (0,50), 3,287 (1,60), 7,256 (1,39), 7,277 (1,85), 7,281 (1,60), 7,303 (1,60), 7,497 (0,85), 7,503 (0,96), 7,508 (0,96), 7,514 (1,00), 7,518 (0,89), 7,524 (0,89), 7,530 (0,78), 7,536 (0,78), 7,690 (1,46), 7,696 (1,49), 7,708 (1,53), 7,714 (1,42), 7,916 (2,28), 8,195 (2,31), 8,266 (5,12), 8,268 (5,58), 8,541 (4,52), 9,122 (3,48).
31	1H-RMN (400 MHz, DMSO-d6) delta [ppm]: -0,149 (1,21), -0,008 (10,77), 0,008 (9,56), 0,146 (1,25), 1,147 (0,82), 2,085 (0,51), 2,153 (16,00), 2,327 (0,74), 2,332 (0,59), 2,523 (1,29), 2,665 (0,62), 2,669 (0,82), 3,286 (1,83), 7,327 (1,56), 7,348 (2,30), 7,352 (1,83), 7,374 (1,87), 7,555 (0,94), 7,561 (1,09), 7,566 (1,13), 7,572 (1,17), 7,577 (1,05), 7,582 (1,05), 7,588 (0,94), 7,594 (0,86), 7,627 (1,83), 7,630 (1,95), 7,639 (3,59), 7,643 (3,63), 7,660 (3,32), 7,668 (3,40), 7,673 (1,68), 7,680 (1,72), 7,816 (1,76), 7,821 (1,72), 7,834 (1,76), 7,840 (1,64), 7,920 (2,85), 7,922 (2,50), 8,200 (2,85), 8,298 (6,36), 8,300 (6,24), 8,372 (2,58), 8,375 (2,85), 8,379 (2,73), 8,382 (2,50), 8,575 (5,23), 10,019 (4,49).
32	1H-RMN (400 MHz, DMSO-d6) delta [ppm]: -0,008 (0,98), 0,001 (16,00), 0,009 (0,71), 2,156 (3,00), 3,842 (4,32), 7,353 (0,41), 7,458 (0,65), 7,540 (0,42), 7,545 (0,61), 7,551 (0,43), 7,578(0,69), 7,595(0,50), 7,915 (0,53), 7,918 (0,58), 8,197 (0,55), 8,302 (1,36), 8,577 (1,03), 10,167 (0,85).
33	1H-RMN (500 MHz, DMSO-d6) delta [ppm]: -0,007 (2,77), 0,007 (2,16), 1,147 (0,49), 1,236 (0,73), 2,145 (1,47), 2,154 (16,00), 2,362 (0,53), 2,519 (0,65), 2,523 (0,45), 2,635 (0,53), 3,289 (1,91), 3,334 (0,49), 7,356 (1,47), 7,373 (1,99), 7,377 (1,75), 7,394 (1,63), 7,591 (0,94), 7,596 (1,10), 7,600 (1,14), 7,604 (1,10), 7,608 (1,06), 7,613 (1,02), 7,617 (0,90), 7,622 (0,81), 7,851 (1,63), 7,856 (1,67), 7,866

ES 2 836 399 T3

(continuación)

Número de ejemplo	Lista de picos de RMN
	(1,79), 7,870 (1,59), 7,916 (2,65), 7,921 (2,77), 8,038 (4,52), 8,042 (1,83), 8,051 (2,20), 8,055 (6,64), 8,135 (5,37), 8,139 (2,12), 8,148 (1,75), 8,152 (3,79), 8,199 (2,81), 8,300 (5,98), 8,302 (6,55), 8,577 (5,37), 10,475 (4,19).
35	1H-RMN(500 MHz, DMSO-d6) delta [ppm]:-0,007(1,26), 0,007 (1,14), 1,236(0,43), 2,154(11,71), 3,283 (0,40), 3,289 (0,80), 3,293 (0,91), 3,297 (1,26), 3,300 (1,94), 3,322 (2,91), 3,324 (2,51), 3,337 (0,57), 4,024 (16,00), 7,366 (1,06), 7,382 (1,40), 7,386 (1,31), 7,403 (1,20), 7,601 (0,69), 7,606 (0,80), 7,610 (0,83), 7,615 (0,80), 7,618 (0,77), 7,623 (0,74), 7,627 (0,66), 7,632 (0,63), 7,668 (1,29), 7,671 (1,40), 7,684 (1,46), 7,687 (1,57), 7,765 (2,71), 7,768 (2,74), 7,835 (1,23), 7,840 (1,26), 7,850 (1,26), 7,854 (1,20), 7,917 (2,00), 7,924 (4,49), 7,940 (2,69), 8,201 (2,00), 8,306 (4,46), 8,307 (4,91), 8,585 (3,94), 10,457 (3,31).
36	1H-RMN(400 MHz, DMSO-d6) delta [ppm]:-0,008(1,45), 0,008 (1,25), 0,695(0,61), 0,704(1,78), 0,711 (1,82), 0,721 (0,70), 1,099 (0,62), 1,107 (1,59), 1,115(1,50), 1,124(0,54), 1,455 (5,80), 2,133 (5,51), 2,661 (16,00), 7,250 (1,07), 7,271 (1,61), 7,339 (0,95), 7,344 (0,95), 7,360 (0,60), 7,365 (0,62), 7,901 (0,95), 7,903 (0,83), 8,142 (2,15), 8,144 (2,28), 8,177 (0,95), 8,295 (1,44), 8,300 (1,45), 8,433 (1,86), 8,950 (1,13).
37	1 H-RMN (400 MHz, DMSO-d6) delta [ppm]: -0,149 (0,43), -0,008 (3,54), 0,008 (3,06), 2,150 (5,46), 2,680 (16,00), 3,286 (0,86), 7,199 (1,19), 7,220 (1,39), 7,428 (0,83), 7,433 (0,82), 7,449 (0,66), 7,454 (0,67), 7,604 (0,84), 7,608 (0,86), 7,617 (1,10), 7,620 (1,15), 7,670 (1,11), 7,677 (1,13), 7,682 (0,79), 7,690 (0,78), 7,905 (0,92), 8,029 (1,36), 8,034 (1,35), 8,188 (0,96), 8,206 (2,35), 8,208 (2,27), 8,363 (0,98), 8,366 (1,10), 8,370 (1,05), 8,374 (0,90), 8,479 (1,88), 9,444 (1,37).
38	1H-RMN (400 MHz, DMSO-d6) delta [ppm]: -0,008 (1,12), 0,008 (0,95), 3,312 (16,00), 3,362 (14,17), 3,668 (5,33), 6,898 (0,42), 6,932 (0,48), 7,083 (0,52), 7,104 (0,67), 7,111 (0,78), 7,128(1,18), 7,146 (0,97), 7,149 (0,89), 7,227 (0,65), 7,249 (1,09), 7,274 (0,71), 7,586 (0,61), 7,592 (0,72), 7,598 (0,75), 7,603 (0,77), 7,605 (0,74), 7,608 (0,73), 7,614 (0,68), 7,619 (0,62), 7,625 (0,54), 7,949 (1,30), 7,955 (1,32), 7,968 (1,33), 7,974 (1,25), 8,475 (5,01), 8,697 (4,39).
39	1H-RMN (400 MHz, DMSO-d6) delta [ppm]: -0,008 (1,13), 0,008 (0,94), 2,156 (16,00), 7,356 (1,61), 7,375 (2,15), 7,377 (3,38), 7,382 (3,57), 7,396 (1,88), 7,403 (3,64), 7,586 (1,01), 7,592 (1,16), 7,597 (1,21), 7,603 (1,20), 7,607 (1,10), 7,613 (1,09), 7,619 (0,97), 7,625 (0,93), 7,867 (1,78), 7,872 (1,79), 7,885 (1,84), 7,890 (1,72), 7,917 (2,67), 7,921 (2,79), 7,923 (2,53), 8,200 (2,72), 8,298 (6,55), 8,300 (6,50), 8,506 (0,99), 8,513 (1,02), 8,525 (1,40), 8,527 (1,49), 8,532 (1,56), 8,534 (1,43), 8,547 (0,97), 8,553 (0,97), 8,579 (5,38), 8,851 (2,70), 8,857 (2,59), 10,456 (4,76).
40	1H-RMN (400 MHz, DMSO-d6) delta [ppm]: -0,008 (2,10), 0,008 (1,89), 2,151 (16,00), 7,317 (0,90), 7,319 (0,94), 7,321 (0,94), 7,339 (1,85), 7,341 (1,91), 7,343 (1,85), 7,362 (0,99), 7,363 (1,01), 7,366 (0,95), 7,397 (1,69), 7,403 (1,65), 7,418 (1,79), 7,425 (1,68), 7,814 (0,68), 7,830 (0,88), 7,836 (1,35), 7,851 (1,31), 7,858 (0,85), 7,873 (0,68), 7,919 (2,81), 7,921 (2,48), 8,201 (2,72), 8,346 (4,90), 8,524 (0,95), 8,531 (1,01), 8,544 (1,39), 8,546 (1,49), 8,552 (1,47), 8,565 (1,01), 8,572 (1,14), 8,580 (3,06), 8,586 (2,71), 8,874 (2,76), 8,881 (2,70), 10,509 (4,92).
41	1 H-RMN (400 MHz, DMSO-d6) delta [ppm]: -0,149 (0,53), -0,008 (4,82), 0,008 (4,05), 0,146 (0,53), 1,150 (0,98), 2,126 (12,30), 2,152 (0,80), 3,286 (0,69), 3,336 (1,17), 3,350 (16,00), 5,754 (0,78), 7,128 (1,36), 7,135 (1,41), 7,150 (1,47), 7,156 (1,43), 7,215 (0,79), 7,238 (1,63), 7,240 (1,53), 7,261 (0,85), 7,753 (0,56), 7,768 (0,73), 7,775 (1,16), 7,790 (1,11), 7,797 (0,72), 7,812 (0,56), 7,904 (1,01), 7,911 (2,62), 7,912 (3,08), 7,932 (1,40), 7,945 (0,73), 7,951 (0,72), 8,161 (2,22), 8,168 (2,08), 8,199 (2,85), 8,201 (2,78), 8,269 (3,35), 8,533 (2,90).
42	1H-RMN(400 MHz, DMSO-d6) delta [ppm]: -0,008 (1,47), 0,008 (1,41), 2,157 (16,00), 3,287 (0,95), 5,754 (0,48), 7,280 (1,39), 7,300 (3,00), 7,319 (1,69), 7,371 (1,70), 7,377(1,74), 7,392(1,80), 7,399(1,74), 7,519 (0,96), 7,524 (1,03), 7,540 (1,75), 7,543 (1,52), 7,557 (0,85), 7,559 (0,79), 7,562 (0,79), 7,694 (0,96), 7,698 (1,04), 7,711 (1,49), 7,714 (1,81), 7,731 (0,97), 7,735 (0,84), 7,921 (2,89), 7,923 (2,56), 8,201 (2,51), 8,204 (2,87), 8,350 (4,77), 8,503 (0,97), 8,510 (1,00), 8,523 (1,58), 8,530 (1,66), 8,544 (0,95), 8,550 (0,95), 8,586 (3,02), 8,591 (2,78), 8,848 (2,75), 8,854 (2,66), 10,444 (4,42).
43	1H-RMN(400 MHz, DMSO-d6) delta [ppm]: -0,008 (1,80), 0,008 (1,54), 2,158 (16,00), 3,288 (0,91), 7,262 (1,36), 7,281 (2,96), 7,301 (1,71), 7,483 (0,91), 7,487 (1,07), 7,501 (1,56), 7,504 (1,77), 7,506 (1,67), 7,524 (2,09), 7,527 (2,23), 7,531 (0,85), 7,544 (4,94), 7,548 (2,56), 7,560 (1,56), 7,564 (3,66),

ES 2 836 399 T3

(continuación)

Número de ejemplo	Lista de picos de RMN
	7,595 (1,10), 7,599 (2,02), 7,603 (1,20), 7,612 (0,77), 7,617 (2,45), 7,624 (0,53), 7,632 (0,51), 7,636 (0,72), 7,674 (0,95), 7,678 (1,00), 7,691 (1,49), 7,694 (1,81), 7,711 (0,96), 7,715 (0,83), 7,920 (2,88), 7,922 (2,62), 7,990 (3,60), 7,994 (4,73), 7,999 (1,23), 8,007 (2,09), 8,011 (4,24), 8,014 (3,01), 8,020 (0,47), 8,202 (2,88), 8,347 (4,75), 8,579 (3,04), 8,584 (2,74), 10,178 (4,25).
44	1 H-RMN (400 MHz, DMSO-d6) delta [ppm]: -0,008 (2,67), 0,008 (3,34), 2,116 (13,55), 3,287 (2,37), 3,344 (1,68), 3,375 (16,00), 3,780 (1,00), 5,754 (0,49), 7,116 (0,72), 7,217 (0,72), 7,237 (1,44), 7,257 (0,91), 7,383 (0,92), 7,402 (1,54), 7,403 (1,49), 7,421 (0,77), 7,686 (0,81), 7,705(1,43), 7,723(0,80), 7,911 (3,66), 8,189 (3,30), 8,192 (3,50), 8,249 (2,76), 8,264 (0,57), 8,493 (2,37).
45	1H-RMN(400 MHz, DMSO-d6) delta [ppm]: -0,008(0,77), 0,000 (16,00), 0,008 (0,94), 2,117(5,23), 3,287 (0,46), 3,310 (6,38), 7,172 (0,46), 7,249 (0,60), 7,278 (0,88), 7,297 (1,01), 7,316 (1,01), 7,336 (0,58), 7,645 (0,44), 7,909 (1,10), 7,911 (0,99), 8,186 (1,08), 8,188 (1,12), 8,228 (0,97), 8,493 (0,96), 8,495 (1,00).
46	1H-RMN(400 MHz, DMSO-d6) delta [ppm]: -0,008(1,19), 0,000 (16,00), 0,008 (1,08), 0,013(0,59), 2,155 (1,53), 7,918 (0,48), 8,294 (0,61), 8,579 (0,52), 10,673 (0,41).
47	1H-RMN(400 MHz, DMSO-d6) delta [ppm]: -0,008 (2,30), 0,008 (1,90), 2,156 (10,69), 2,226 (10,07), 3,286 (0,98), 3,880 (16,00), 5,754 (0,41), 7,289 (1,27), 7,292 (1,39), 7,310 (1,52), 7,312 (1,69), 7,330 (1,08), 7,352 (1,44), 7,356 (1,24), 7,377 (1,24), 7,524 (1,19), 7,529 (1,84), 7,540 (2,26), 7,545 (4,98), 7,563 (0,69), 7,569 (0,78), 7,575 (0,80), 7,581 (0,79), 7,585 (0,72), 7,591 (0,71), 7,596 (0,63), 7,602 (0,61), 7,812 (1,14), 7,818 (1,18), 7,831 (1,19), 7,836 (1,11), 7,916 (1,76), 7,921 (1,86), 7,922 (1,68), 8,199 (1,73), 8,200 (1,86), 8,305 (3,99), 8,307 (4,47), 8,582 (3,61), 10,112 (3,09).
48	1H-RMN (400 MHz, DMSO-d6) delta [ppm]: -0,008 (1,20), 0,008 (1,19), 2,073 (0,57), 2,142 (13,31), 2,366 (0,50), 2,710 (0,51), 3,287 (2,65), 3,395 (16,00), 7,123 (0,76), 7,146 (0,80), 7,201 (0,61), 7,224 (1,05), 7,248 (0,67), 7,557 (0,63), 7,596 (0,65), 7,906 (1,66), 7,912 (1,91), 7,925 (4,39), 7,931 (2,61), 8,206 (3,44), 8,312 (5,76), 8,553 (4,34).
49	1 H-RMN (400 MHz, DMSO-d6) delta [ppm]: -0,149 (0,79), -0,008 (6,75), 0,008 (6,43), 0,146 (0,74), 1,146 (0,69), 1,266 (1,16), 2,154 (16,00), 2,367 (1,04), 2,710 (1,06), 3,162 (4,28), 3,175 (4,28), 3,285 (4,72), 4,074 (1,09), 4,087 (1,06), 4,100 (0,42), 7,357 (1,43), 7,379 (2,00), 7,404 (1,76), 7,586 (0,96), 7,605 (1,06), 7,626 (0,87), 7,724 (3,41), 7,745 (3,64), 7,869 (1,61), 7,875 (1,66), 7,887 (1,63), 7,893 (1,63), 7,921 (2,94), 8,202 (2,97), 8,298 (7,02), 8,364 (1,98), 8,370 (1,98), 8,385 (1,90), 8,391 (1,93), 8,578 (5,47), 8,977 (3,19), 8,983 (3,12), 10,500 (4,50).
50	1H-RMN (400 MHz, DMSO-d6) delta [ppm]: -0,008(0,84), 0,000 (16,00), 0,008 (0,50), 2,155(1,59), 7,887 (0,51), 7,903 (0,51), 8,305 (0,62), 8,307 (0,65), 8,583 (0,53), 8,804 (0,62), 8,819 (0,56), 10,509 (0,41).
51	1H-RMN (400 MHz, DMSO-d6) delta [ppm]: -0,149 (0,89), -0,008 (8,31), 0,008 (7,50), 0,146 (0,92), 1,148 (0,41), 2,155 (16,00), 2,366 (0,70), 2,710 (0,74), 3,285 (2,51), 7,370 (1,55), 7,391 (2,07), 7,395(1,83), 7,417 (1,83), 7,606 (1,02), 7,612 (1,16), 7,617 (1,20), 7,623 (1,20), 7,628 (1,11), 7,633 (1,11), 7,639 (0,98), 7,645 (0,98), 7,677 (3,10), 7,854 (1,18), 7,858 (1,85), 7,865 (2,51), 7,871 (3,18), 7,875(1,66), 7,883(1,70), 7,889 (1,53), 7,923 (2,68), 8,199 (2,49), 8,202 (2,81), 8,301 (6,28), 8,303 (6,39), 8,474 (2,94), 8,487 (2,81), 8,583 (5,32), 10,598 (4,14).
52	1H-RMN(400 MHz, DMSO-d6) delta [ppm]: -0,008 (2,13), 0,008 (1,92), 2,155(12,30), 2,304(11,70), 2,308 (16,00), 2,310 (14,60), 3,286 (1,87), 7,287 (1,96), 7,307 (2,19), 7,317 (1,31), 7,338 (1,63), 7,342(1,46), 7,364 (1,44), 7,547 (0,74), 7,554 (0,88), 7,559 (0,88), 7,565 (0,89), 7,569 (0,83), 7,575 (0,78), 7,580 (0,71), 7,587 (0,69), 7,722 (1,27), 7,727 (1,44), 7,741 (1,12), 7,747 (1,26), 7,796 (2,48), 7,800 (2,47), 7,812 (1,42), 7,817 (1,38), 7,830 (1,36), 7,836 (1,27), 7,919 (2,12), 8,200 (2,12), 8,295 (4,67), 8,296 (5,20), 8,572 (4,14), 10,047 (3,42).
53	1H-RMN(400 MHz, DMSO-d6) delta [ppm]: -0,008 (3,69), 0,008 (2,52), 2,155 (16,00), 2,319 (10,19), 2,324 (9,83), 3,286 (2,82), 7,288 (1,65), 7,310 (2,51), 7,328 (1,89), 7,334 (1,96), 7,350 (2,24), 7,354 (1,87), 7,375 (1,83), 7,561 (1,05), 7,567 (1,20), 7,572 (1,26), 7,578 (1,24), 7,582 (1,10), 7,588 (1,09), 7,594 (0,96), 7,600 (0,89), 7,810 (1,80), 7,816 (1,81), 7,828 (1,83), 7,834 (1,65), 7,862 (0,91), 7,869 (1,08), 7,875 (1,08), 7,882 (1,39), 7,889 (1,10), 7,896 (0,98), 7,902 (1,06), 7,915 (2,59), 7,917 (3,02), 7,951 (1,54), 7,959 (1,35), 7,970 (1,53), 7,978 (1,16), 8,198 (2,72), 8,200 (2,96), 8,295 (6,32), 8,297

ES 2 836 399 T3

(continuación)

Número de ejemplo	Lista de picos de RMN
	(6,43), 8,573 (5,37), 10,164 (4,61).
54	1H-RMN (400 MHz, DMSO-d6) delta [ppm]: -0,008 (1,11), 0,008 (1,03), 2,155(13,45), 2,582 (16,00), 3,287 (1,68), 5,754 (0,98), 7,352 (1,28), 7,373 (1,75), 7,377 (1,54), 7,399 (1,51), 7,589 (0,80), 7,595 (0,97), 7,601 (1,00), 7,607 (0,99), 7,608 (0,85), 7,611 (0,92), 7,617 (0,90), 7,623 (0,80), 7,628 (0,77), 7,676 (1,42), 7,678 (1,52), 7,680 (1,53), 7,687 (1,39), 7,691 (1,61), 7,693 (1,49), 7,765 (2,56), 7,767 (3,07), 7,836 (1,37), 7,842 (1,44), 7,855 (1,45), 7,860 (1,36), 7,916 (2,17), 7,921 (2,42), 8,200 (2,27), 8,201 (2,41), 8,303 (5,54), 8,581 (4,52), 8,653 (2,38), 8,666 (2,32), 10,442 (3,76).
55	1H-RMN(400 MHz, DMSO-d6) delta [ppm]: -0,008 (0,84), 0,008 (0,76), 2,154 (10,26), 2,524 (0,44), 3,287 (1,19), 3,935 (16,00), 5,754 (4,07), 7,313 (1,05), 7,327 (1,22), 7,334 (1,87), 7,349 (1,55), 7,353 (1,63), 7,357 (1,09), 7,374 (1,21), 7,561 (0,63), 7,567 (0,73), 7,573 (0,77), 7,579 (0,76), 7,583 (0,69), 7,588 (0,67), 7,594 (0,61), 7,600 (0,59), 7,806 (1,10), 7,812 (1,13), 7,825 (1,17), 7,831 (1,16), 7,837 (1,26), 7,842 (1,49), 7,869 (3,78), 7,874 (1,49), 7,888 (1,05), 7,890 (1,12), 7,893 (0,87), 7,896 (0,78), 7,915 (1,60), 7,921 (1,70), 8,199 (1,77), 8,203 (1,55), 8,298 (4,11), 8,299 (4,43), 8,573 (3,48), 10,123 (2,91).
56	1H-RMN(400 MHz, DMSO-d6) delta [ppm]: -0,008 (1,45), 0,008 (1,17), 2,073(0,43), 2,154(16,00), 3,288 (1,82), 5,754 (1,15), 7,348 (1,62), 7,370 (2,22), 7,374 (1,94), 7,395 (1,87), 7,585 (1,05), 7,591 (1,21), 7,596 (1,28), 7,602 (1,24), 7,606 (1,16), 7,612 (1,13), 7,618 (1,01), 7,624 (0,94), 7,791 (1,57), 7,809 (2,08), 7,812 (2,82), 7,830 (4,15), 7,835 (2,12), 7,847 (1,87), 7,853 (1,77), 7,868 (2,55), 7,874 (2,35), 7,889 (1,40), 7,895 (1,38), 7,922 (2,73), 7,986 (2,14), 7,991 (2,01), 8,011 (2,06), 8,016 (1,97), 8,199 (2,74), 8,299 (6,25), 8,301 (6,72), 8,578 (5,42), 10,373 (4,54).
57	1 H-RMN (400 MHz, DMSO-d6) delta [ppm]: -0,149 (0,91), -0,008 (7,60), 0,008 (7,45), 0,146 (0,81), 1,147 (1,20), 1,234 (0,49), 2,073 (1,41), 2,366 (1,41), 2,709 (1,34), 3,286 (9,39), 7,270 (4,11), 7,289 (8,69), 7,309 (4,89), 7,490 (2,85), 7,493 (3,20), 7,509 (5,10), 7,512 (5,49), 7,524 (4,40), 7,527 (8,19), 7,532 (4,96), 7,545 (15,19), 7,548 (8,55), 7,560 (4,57), 7,564 (10,65), 7,596 (3,34), 7,599 (6,22), 7,603 (3,80), 7,612 (2,32), 7,618 (7,60), 7,624 (1,69), 7,632 (1,37), 7,636 (2,29), 7,681 (2,74), 7,685 (3,13), 7,702 (5,38), 7,718 (2,85), 7,722 (2,50), 7,989 (10,76), 7,993 (14,87), 7,998 (4,04), 8,006 (6,08), 8,010 (12,45), 8,014 (9,49), 8,093 (9,00), 8,095 (8,40), 8,390 (16,00), 8,534 (8,51), 8,540 (8,65), 8,637 (9,21), 8,642 (8,76), 10,182 (12,45).
58	1 H-RMN (400 MHz, DMSO-d6) delta [ppm]: -0,149 (0,44), -0,008 (3,96), 0,008 (3,37), 0,146 (0,45), 2,366 (0,60), 2,710 (0,52), 3,286 (3,10), 3,342 (16,00), 7,167 (0,63), 7,186 (1,23), 7,205 (0,94), 7,316 (3,02), 7,337 (1,80), 7,638 (0,68), 7,654 (1,07), 7,673 (0,62), 8,076 (2,67), 8,081 (2,80), 8,273 (2,63), 8,519 (2,76), 8,525 (2,90), 8,543 (2,43).
65	1H-RMN(400 MHz, DMSO-d6) delta [ppm]: -0,008 (0,72), 0,008 (0,63), 2,143 (16,00), 3,200 (1,76), 3,223 (3,83), 3,246 (2,08), 3,287 (0,77), 3,510 (3,36), 3,530 (4,58), 3,533 (4,89), 3,554 (2,99), 4,275 (0,91), 4,296 (1,36), 4,319 (0,82), 5,754 (4,66), 7,236 (0,84), 7,238 (0,90), 7,240 (0,88), 7,259 (1,72), 7,261 (1,83), 7,263 (1,75), 7,281 (0,92), 7,283 (0,96), 7,285 (0,90), 7,731 (0,61), 7,746 (0,81), 7,753 (1,23), 7,768 (1,22), 7,774 (0,81), 7,789 (0,59), 7,912 (2,67), 7,917 (2,64), 8,197 (2,68), 8,312 (4,71), 8,315 (3,65), 8,548 (2,90), 8,554 (2,78), 9,703 (2,95).
66	1H-RMN (400 MHz, DMSO-d6) delta [ppm]: -0,008(1,35), 0,008 (1,13), 2,148(16,00), 3,152 (1,75), 3,175 (3,79), 3,198 (2,03), 3,287 (1,41), 3,534 (3,26), 3,555 (4,81), 3,557 (5,04), 3,578 (3,01), 4,299 (1,17), 4,320 (1,82), 4,343 (1,06), 5,754 (1,02), 7,279 (1,48), 7,300 (2,06), 7,306 (1,69), 7,327 (1,86), 7,444 (0,81), 7,450 (0,98), 7,456 (1,03), 7,463 (0,96), 7,465 (0,96), 7,471 (0,85), 7,477 (0,76), 7,483 (0,69), 7,917 (2,74), 8,070 (1,16), 8,075 (1,23), 8,088 (1,19), 8,094 (1,16), 8,194 (2,63), 8,241 (5,82), 8,536 (5,09), 9,693 (2,71).
67	1 H-RMN (400 MHz, DMSO-d6) delta [ppm]: -0,149 (0,66), -0,008 (5,48), 0,008 (5,15), 0,146 (0,67), 2,157 (16,00), 3,287 (2,63), 7,293 (1,33), 7,312 (2,90), 7,332 (1,69), 7,522 (0,89), 7,538 (1,54), 7,559 (0,75), 7,680 (3,30), 7,716 (0,99), 7,720 (1,05), 7,737 (1,69), 7,752 (0,95), 7,855 (1,82), 7,868 (1,79), 7,922 (2,76), 8,203 (2,69), 8,352 (4,81), 8,468 (3,08), 8,481 (2,96), 8,591 (3,05), 10,583 (3,86).
68	1H-RMN(400 MHz, DMSO-d6) delta [ppm]: -0,008 (3,44), 0,008 (3,01), 2,073 (2,73), 2,157 (16,00), 3,287 (1,60), 7,284 (1,33), 7,303 (2,92), 7,323 (1,66), 7,503 (0,85), 7,507 (0,92), 7,525 (1,51), 7,541 (0,79), 7,545 (0,73), 7,706 (0,99), 7,710 (1,02), 7,727 (1,71), 7,743 (0,95), 7,747 (0,84), 7,887 (5,43), 7,891 (3,39), 7,898 (3,54), 7,902 (5,59), 7,918 (2,77), 8,203 (2,70), 8,352 (4,66), 8,588 (3,04), 8,799

ES 2 836 399 T3

(continuación)

Número de ejemplo	Lista de picos de RMN
	(6,20), 8,804 (3,61), 8,810 (3,55), 8,815 (5,91), 10,495 (3,83).
69	1 H-RMN (400 MHz, DMSO-d6) delta [ppm]: -0,149 (0,94), -0,011 (4,87), -0,008 (10,96), 0,008 (6,75), 0,146 (0,87), 1,147 (0,74), 2,073 (0,87), 2,156 (16,00), 2,327 (0,59), 2,366 (0,76), 2,670 (0,59), 2,710 (0,76), 3,286 (7,64), 7,293 (1,40), 7,313 (2,90), 7,333 (1,58), 7,564 (0,97), 7,582 (1,58), 7,598 (0,82), 7,706 (1,04), 7,710 (1,12), 7,727 (1,76), 7,743 (0,99), 7,747 (0,89), 7,919 (2,85), 8,204 (2,83), 8,239 (2,80), 8,241 (2,80), 8,259 (3,06), 8,261 (3,08), 8,351 (4,69), 8,532 (2,27), 8,537 (2,19), 8,552 (1,94), 8,558 (1,96), 8,590 (3,13), 9,243 (2,45), 9,245 (2,62), 9,248 (2,55), 10,661 (3,92).
70	1H-RMN(400 MHz, DMSO-d6) delta [ppm]: -0,008 (3,51), 0,008 (2,14), 2,073 (1,82), 2,157 (16,00), 3,287 (2,39), 7,281 (1,41), 7,300 (2,95), 7,320 (1,64), 7,525 (0,97), 7,529 (1,06), 7,547 (1,62), 7,563 (0,85), 7,567 (0,77), 7,696 (1,14), 7,700 (1,19), 7,718 (4,78), 7,720 (4,49), 7,733(1,26), 7,739 (3,77), 7,740 (3,59), 7,918 (2,81), 8,203 (2,80), 8,350 (4,88), 8,363 (2,65), 8,369 (2,53), 8,384 (2,34), 8,390 (2,32), 8,587 (3,17), 8,974 (2,98), 8,976 (3,06), 8,980 (2,99), 8,982 (2,80), 10,488 (4,26).
71	1H-RMN(400 MHz, DMSO-d6) delta [ppm]: -0,008 (1,05), 0,008 (0,86), 2,157 (9,82), 3,288 (0,86), 3,936 (16,00), 7,269 (0,81), 7,289 (1,79), 7,309 (1,07), 7,363 (1,24), 7,384 (1,49), 7,391 (1,26), 7,412 (1,40), 7,486 (1,06), 7,612 (0,69), 7,618 (0,76), 7,623 (0,77), 7,629 (0,79), 7,639 (0,74), 7,644 (0,66), 7,650 (0,67), 7,705 (1,06), 7,762 (1,20), 7,767 (1,13), 7,783 (1,21), 7,788 (1,10), 7,919 (1,68), 8,203 (1,66), 8,350 (3,04), 8,583 (1,90), 10,199 (2,48).
72	1H-RMN(400 MHz, DMSO-d6) delta [ppm]: 2,156 (10,40), 3,934 (16,00), 7,256 (0,88), 7,276 (1,94), 7,296 (1,13), 7,310 (1,07), 7,332 (1,89), 7,354 (0,95), 7,479 (1,13), 7,691 (1,16), 7,838 (1,13), 7,844 (1,46), 7,869 (2,78), 7,875 (1,45), 7,887 (1,17), 7,894 (0,81), 7,920 (1,87), 8,202 (1,85), 8,345 (3,13), 8,577 (2,08), 10,111 (2,84).
73	1H-RMN(400 MHz, DMSO-d6) delta [ppm]: -0,008 (0,86), 0,008 (0,82), 2,157 (11,52), 3,288 (0,63), 3,312 (16,00), 3,757 (0,84), 7,163 (0,98), 7,165 (1,10), 7,169 (1,09), 7,171 (1,10), 7,183(1,14), 7,186(1,21), 7,190 (1,26), 7,192 (1,14), 7,263 (0,99), 7,282 (2,15), 7,302 (1,21), 7,436 (1,51), 7,456 (2,66), 7,469 (0,78), 7,476 (2,04), 7,488 (1,22), 7,492 (1,22), 7,507 (0,64), 7,511 (0,59), 7,539 (1,61), 7,543 (2,17), 7,550 (1,76), 7,573 (1,38), 7,576 (1,79), 7,579 (1,14), 7,592 (1,06), 7,595 (1,30), 7,599 (0,83), 7,678 (0,70), 7,682 (0,74), 7,699 (1,23), 7,715 (0,67), 7,719 (0,60), 7,918 (2,04), 8,202 (1,99), 8,349 (3,55), 8,582 (2,31), 10,159 (2,92).
74	1H-RMN(400 MHz, DMSO-d6) delta [ppm]: -0,149 (0,62), -0,008 (5,17), 0,008 (4,31), 0,146 (0,59), 2,073 (0,92), 2,155 (10,58), 3,286 (3,94), 4,024 (16,00), 7,286 (0,87), 7,306 (1,94), 7,326 (1,06), 7,509 (1,04), 7,660 (1,40), 7,664 (1,38), 7,680 (1,57), 7,684 (1,69), 7,725 (1,18), 7,743 (0,73), 7,764 (2,75), 7,768 (2,68), 7,918 (4,94), 7,938 (2,67), 8,137 (1,49), 8,203 (1,82), 8,352 (3,20), 8,590 (2,08), 10,437 (2,59).
75	1H-RMN (400 MHz, DMSO-d6) delta [ppm]: -0,149 (0,85), -0,011 (7,25), -0,008 (13,48), 0,008 (6,23), 0,146 (0,85), 1,147 (0,90), 2,155 (16,00), 2,332 (0,67), 2,366 (0,72), 2,669 (0,90), 2,709 (0,85), 3,286 (8,08), 7,254 (1,47), 7,273 (3,06), 7,293 (1,65), 7,474 (1,21), 7,488 (1,72), 7,628 (2,34), 7,631 (2,34), 7,640 (4,60), 7,644 (4,30), 7,658 (4,63), 7,666 (5,40), 7,671 (2,42), 7,679 (3,27), 7,699 (0,95), 7,916 (2,83), 8,204 (2,70), 8,343 (4,91), 8,375 (3,42), 8,378 (3,68), 8,382 (3,34), 8,386 (3,04), 8,577 (3,14), 10,003 (3,96).
76	1H-RMN(400 MHz, DMSO-d6) delta [ppm]: -0,008 (1,44), 0,008 (1,34), 2,073(0,79), 2,139 (2,57), 2,156 (16,00), 3,289 (1,63), 7,167 (0,44), 7,227 (2,40), 7,237 (2,63), 7,240 (2,68), 7,249 (2,54), 7,260 (1,38), 7,279 (2,90), 7,300 (1,68), 7,418 (0,45), 7,437 (0,75), 7,458 (1,29), 7,473 (1,77), 7,492 (0,91), 7,508 (0,48), 7,678 (0,98), 7,682 (1,04), 7,698 (1,78), 7,715 (0,92), 7,872 (2,63), 7,875 (2,89), 7,884 (2,63), 7,887 (2,71), 7,918 (2,87), 8,013 (0,56), 8,025 (3,02), 8,028 (3,11), 8,034 (2,73), 8,037 (2,57), 8,202 (2,81), 8,349 (4,99), 8,585 (3,10), 8,611 (0,51), 9,539 (1,13), 10,211 (4,07).
77	1H-RMN (400 MHz, DMSO-d6) delta [ppm]: -0,008 (1,12), 0,008 (0,94), 2,157 (16,00), 3,288 (1,39), 7,258 (1,36), 7,278 (2,80), 7,297 (1,53), 7,645 (0,84), 7,649 (1,11), 7,667 (1,89), 7,683 (1,11), 7,691 (1,88), 7,710 (0,96), 7,923 (2,72), 8,205 (2,61), 8,347 (4,73), 8,590 (3,14), 8,639 (5,70), 8,642 (5,86), 8,852 (6,10), 8,855 (5,94), 9,843 (3,13).
2-01	1H-RMN(400 MHz, DMSO-d6) delta [ppm]: -0,008 (4,69), 0,008 (2,78), 2,154 (16,00), 3,286 (3,27), 7,331 (1,66), 7,353 (2,20), 7,357 (1,83), 7,380 (1,79), 7,656 (1,05), 7,663 (1,31), 7,667 (1,36), 7,681

ES 2 836 399 T3

(continuación)

Número de ejemplo	Lista de picos de RMN
	(4,17), 7,696 (0,89), 7,842 (1,44), 7,847 (2,00), 7,851 (1,46), 7,855 (1,54), 7,859 (2,00), 7,864 (1,28), 7,916 (2,87), 8,096 (1,70), 8,103 (1,70), 8,114 (1,68), 8,120 (1,56), 8,199 (3,06), 8,214 (4,72), 8,469 (3,14), 8,482 (2,91), 8,540 (3,31), 10,667 (3,66).
2-02	1H-RMN (400 MHz, DMSO-d6) delta [ppm]: -0,149 (0,69), -0,008 (9,62), 0,146 (0,62), 1,148 (0,89), 2,154 (16,00), 2,327 (0,67), 2,366 (0,93), 2,670 (0,69), 2,710 (0,96), 3,287 (8,93), 7,318 (1,51), 7,344 (2,13), 7,367 (1,67), 7,672 (1,38), 7,876 (5,24), 7,880 (4,38), 7,887 (3,82), 7,891 (5,62), 7,919 (3,31), 8,115 (1,78), 8,127 (1,78), 8,132 (1,76), 8,201 (3,44), 8,217 (4,82), 8,539 (3,71), 8,801 (5,58), 8,805 (4,51), 8,812 (3,60), 8,816 (5,58), 10,603 (3,69).
2-03	1H-RMN(400 MHz, DMSO-d6) delta [ppm]: -0,008 (2,66), 0,008 (1,16), 2,073 (2,82), 2,154 (16,00), 3,287 (2,26), 7,333 (1,67), 7,355 (2,26), 7,359 (1,91), 7,381 (1,76), 7,657 (0,99), 7,664 (1,19), 7,668 (1,18), 7,675 (1,14), 7,679 (1,04), 7,686 (1,06), 7,691 (0,91), 7,697 (0,77), 7,917 (2,98), 8,096 (1,70), 8,103 (1,74), 8,114 (1,67), 8,120 (1,48), 8,199 (3,26), 8,213 (4,74), 8,250 (2,85), 8,252 (2,82), 8,270 (3,18), 8,272 (3,14), 8,528 (2,76), 8,533 (2,88), 8,542 (3,75), 8,548 (4,23), 8,553 (2,16), 9,242 (2,78), 9,244 (2,97), 9,248 (2,76), 9,250 (2,47), 10,753 (4,03).
2-04	1H-RMN(400 MHz, DMSO-d6) delta [ppm]: -0,008 (8,45), 0,008 (3,72), 1,147 (0,65), 2,153(16,00), 2,366 (0,94), 2,710 (0,82), 3,285 (7,20), 7,317 (1,63), 7,339 (2,23), 7,343 (1,96), 7,366 (1,76), 7,643 (1,00), 7,650 (1,20), 7,661 (1,16), 7,665 (1,09), 7,672 (1,07), 7,683 (0,87), 7,727 (3,25), 7,748 (3,39), 7,916 (3,08), 8,084 (1,76), 8,091 (1,83), 8,102 (1,72), 8,108 (1,60), 8,198 (3,30), 8,211 (4,64), 8,359 (2,38), 8,365 (2,30), 8,380 (2,14), 8,386 (2,09), 8,535 (3,43), 8,970 (3,03), 8,976 (2,74), 10,588 (4,10).
2-05	1H-RMN(400 MHz, DMSO-d6) delta [ppm]: -0,008 (2,38), 0,008 (2,30), 2,153 (9,91), 3,286 (2,64), 3,942 (16,00), 7,301 (1,02), 7,323 (1,32), 7,327 (1,23), 7,350 (1,15), 7,372 (1,20), 7,393 (1,47), 7,400 (1,25), 7,421 (1,44), 7,599 (0,68), 7,605 (0,77), 7,610 (0,76), 7,616 (0,78), 7,626 (0,70), 7,637 (1,18), 7,724 (1,21), 7,729 (1,15), 7,745 (1,25), 7,750 (1,15), 7,916 (1,70), 8,072 (1,08), 8,078 (1,10), 8,089 (1,11), 8,096 (1,04), 8,198 (1,67), 8,215 (2,87), 8,530 (2,00), 10,328 (2,47).
2-06	1 H-RMN (400 MHz, DMSO-d6) delta [ppm]: -0,008 (1,18), 0,008 (1,18), 2,153 (10,18), 3,287 (1,47), 3,935 (16,00), 7,284 (1,06), 7,307 (1,43), 7,311 (1,40), 7,315 (1,20), 7,333 (1,84), 7,336 (2,06), 7,358 (0,83), 7,674 (0,71), 7,843 (0,98), 7,849 (1,77), 7,856 (1,57), 7,877 (3,62), 7,916 (1,79), 8,085 (1,14), 8,092 (1,13), 8,103 (1,16), 8,109 (1,07), 8,197 (1,83), 8,207 (3,22), 8,521 (2,08), 10,240 (2,63).
2-07	1H-RMN(400 MHz, DMSO-d6) delta [ppm]: -0,008 (1,92), 0,008 (1,68), 2,154(10,25), 3,286 (2,00), 3,846 (16,00), 3,935 (1,60), 5,754 (1,67), 7,160 (0,74), 7,162 (0,81), 7,166 (0,83), 7,168 (0,81), 7,180 (0,87), 7,182 (0,91), 7,187 (0,98), 7,189 (0,87), 7,289 (0,96), 7,311 (1,34), 7,315 (1,24), 7,337 (1,22), 7,444 (1,11), 7,463 (2,10), 7,483 (1,34), 7,509 (1,23), 7,513 (1,72), 7,519 (1,41), 7,551 (1,11), 7,554 (1,45), 7,558 (0,97), 7,570 (0,77), 7,573 (1,00), 7,918 (1,84), 8,107 (1,06), 8,114 (1,01), 8,125 (1,02), 8,131 (0,98), 8,198 (1,88), 8,208 (3,11), 8,523 (2,05), 10,308 (2,27).
2-08	1H-RMN(400 MHz, DMSO-d6) delta [ppm]: -0,008 (0,98), 0,008 (0,83), 2,074 (3,55), 2,154 (10,48), 3,288 (0,76), 4,030 (16,00), 7,322 (1,08), 7,345 (1,40), 7,349 (1,22), 7,371 (1,19), 7,651 (1,77), 7,655 (2,02), 7,671 (2,11), 7,675 (2,01), 7,729 (2,85), 7,732 (2,62), 7,918 (1,89), 7,928 (3,16), 7,949 (2,58), 8,080 (1,06), 8,086 (1,08), 8,097 (1,09), 8,104 (1,00), 8,199 (1,81), 8,218 (3,07), 8,538 (2,11), 10,547 (2,66).
2-09	1H-RMN(400 MHz, DMSO-d6) delta [ppm]: -0,008 (1,90), 0,008 (1,80), 2,153 (16,00), 3,287 (1,54), 7,282 (1,62), 7,305 (2,12), 7,309 (1,89), 7,331 (1,80), 7,629 (1,06), 7,635 (2,42), 7,638 (2,68), 7,647 (4,69), 7,650 (4,53), 7,658 (1,33), 7,664 (4,12), 7,671 (3,85), 7,676 (1,58), 7,684 (1,56), 7,916 (2,83), 8,066 (1,75), 8,073 (1,75), 8,084 (1,80), 8,091 (1,67), 8,198 (2,90), 8,208 (4,90), 8,350 (2,59), 8,354 (2,85), 8,358 (2,73), 8,361 (2,53), 8,521 (3,32), 10,150 (3,85).
2-10	1 H-RMN (400 MHz, DMSO-d6) delta [ppm]: -0,008 (2,18), 0,008 (2,07), 2,073 (0,59), 2,156 (16,00), 3,287 (2,43), 7,289 (1,68), 7,311 (2,15), 7,315 (1,93), 7,337 (1,88), 7,528 (1,13), 7,532 (1,86), 7,536 (0,76), 7,549 (4,90), 7,554 (2,48), 7,565 (1,70), 7,568 (3,88), 7,589 (1,19), 7,593 (2,26), 7,596 (1,34), 7,605 (0,74), 7,611 (2,48), 7,629 (0,66), 7,669 (0,94), 7,675 (1,10), 7,680 (1,12), 7,686 (1,05), 7,691 (1,02), 7,697 (1,08), 7,702 (0,97), 7,709 (0,90), 7,919 (2,79), 7,968 (3,63), 7,972 (4,98), 7,978 (1,28), 7,985 (2,10), 7,989 (4,23), 7,993 (3,27), 8,120 (1,74), 8,127 (1,77), 8,138 (1,81), 8,144 (1,67), 8,199 (2,94), 8,207 (5,13), 8,522 (3,17), 10,343 (3,93).

(continuación)

Número de ejemplo	Lista de picos de RMN
2-11	1H-RMN (400 MHz, DMSO-d6) delta [ppm]: -0,008(0,69), 2,151 (16,00), 3,288 (2,63), 7,304(1,63), 7,326 (2,13), 7,330 (1,90), 7,353 (1,85), 7,628 (0,94), 7,635 (1,13), 7,639 (1,13), 7,646 (1,08), 7,650 (1,04), 7,657 (1,05), 7,662 (0,97), 7,669 (0,89), 7,918 (2,84), 7,991 (6,91), 8,046 (1,76), 8,052 (1,76), 8,063 (1,82), 8,070 (1,67), 8,199 (2,87), 8,214 (4,57), 8,529 (3,16), 8,677 (5,04), 10,530 (3,93).
2-12	1H-RMN (400 MHz, DMSO-d6) delta [ppm]: -0,008 (2,14), 0,008 (2,06), 2,152 (16,00), 3,287 (2,80), 7,274 (1,71), 7,296 (2,11), 7,300 (1,95), 7,323 (1,87), 7,752 (0,92), 7,759 (1,08), 7,763 (1,12), 7,770 (1,08), 7,775 (1,05), 7,781 (1,06), 7,786 (1,01), 7,792 (0,92), 7,915 (2,72), 8,158(1,76), 8,164(1,80), 8,175(1,85), 8,182 (1,76), 8,198 (2,76), 8,212 (4,89), 8,506 (3,13), 8,643 (5,46), 8,646 (5,57), 8,815 (5,74), 8,818 (5,67), 10,239 (3,86).
2-13	1H-RMN(400 MHz, DMSO-d6) delta [ppm]: -0,149(0,93), -0,008 (12,41), 0,008 (6,58), 0,146 (0,93), 1,147 (1,54), 2,328 (1,07), 2,366 (2,29), 2,669 (1,07), 2,710 (2,19), 3,287 (16,00), 7,292 (3,03), 7,311 (6,34), 7,331 (3,64), 7,514 (2,33), 7,531 (3,78), 7,548 (1,82), 7,717 (2,43), 7,735 (4,10), 7,750 (2,01), 7,886 (11,15), 7,890 (7,74), 7,897 (7,65), 7,902 (11,10), 8,091 (7,04), 8,396 (11,38), 8,538 (7,23), 8,646 (7,14), 8,800 (11,76), 8,804 (7,79), 8,811 (7,42), 8,815 (11,20), 10,500 (8,72).
2-14	1H-RMN(400 MHz, DMSO-d6) delta [ppm]: -0,149 (1,25), -0,008 (10,18), 0,008 (9,00), 0,146 (1,25), 1,147 (1,87), 2,327 (1,45), 2,366 (2,63), 2,670 (1,52), 2,710 (2,70), 3,286 (12,95), 7,264 (4,16), 7,284 (8,66), 7,304 (4,71), 7,655 (3,46), 7,673 (8,52), 7,693 (8,17), 7,709 (2,98), 8,099 (9,07), 8,388 (15,93), 8,545 (9,07), 8,638 (13,37), 8,641 (16,00), 8,651 (9,63), 8,851 (13,23), 8,853 (14,20), 9,857 (10,18).

Ejemplos biológicos

Ctenocephalides felis - Prueba de contacto *in vitro* con pulgas de gato adultas

5 Para el recubrimiento de los tubos de ensayo, se disuelven inicialmente 9 mg de principio activo en 1 ml de acetona p.a. y a continuación se diluye con acetona p.a. hasta la concentración deseada. Se distribuyen homogéneamente 250 µl de la disolución sobre las paredes internas y la base de un tubo de vidrio de 25 ml mediante giro y balanceo en un agitador orbital (2 h de rotación por balanceo a 30 rpm). Con 900 ppm de disolución de principio activo y 44,7 cm² de superficie interna, con distribución homogénea, se consigue una dosis por unidad de área de 5 µg/cm².

10 Después de la evaporación del disolvente, los tubos se pueblan con 5-10 pulgas de gato adultas (*Ctenocephalides felis*), se cierran con una tapa de plástico perforada y se incuban horizontalmente a temperatura ambiente y humedad ambiente. Después de 48 h se determina la eficacia. Para esto, los tubos se ponen verticales y se golpean las pulgas en la base del tubo. Se consideran muertas o moribundas las pulgas que quedan inmóviles sobre la base o se mueven descoordinadamente.

15 Una sustancia muestra buena eficacia contra *Ctenocephalides felis* cuando en esta prueba se logró al menos 80 % de eficacia a una tasa de aplicación de 5 µg/cm². A este respecto, 100 % de eficacia significa que todas las pulgas estaban moribundas o muertas. 0 % de eficacia significa que no se dañó ninguna pulga.

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia del 100 % a una tasa de aplicación de 5 µg/cm² (500 g/ha): 2, 6, 7, 12, 15, 17, 19, 20, 25, 30, 32, 33, 43, 45, 46, 50, 51, 54, 57, 67, 68, 69, 2-14.

20 En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia del 80% a una tasa de aplicación de 5 µg/cm² (500 g/ha): 58, 2-13.

Rhipicephalus sanguineus - Prueba de contacto *in vitro* con garrapatas de perro marrones adultas

25 Para el recubrimiento de los tubos de ensayo, se disuelven inicialmente 9 mg de principio activo en 1 ml de acetona p.a. y a continuación se diluye con acetona p.a. hasta la concentración deseada. Se distribuyen homogéneamente 250 µl de la disolución sobre las paredes internas y la base de un tubo de vidrio de 25 ml mediante giro y balanceo en un agitador orbital (2 h de rotación por balanceo a 30 rpm). Con 900 ppm de disolución de principio activo y 44,7 cm² de superficie interna, con distribución homogénea, se consigue una dosis por unidad de área de 5 µg/cm².

30 Después de la evaporación del disolvente, los tubos se pueblan con 5-10 garrapatas de perro adultas (*Rhipicephalus sanguineus*), se cierran con una tapa de plástico perforada y se incuban horizontalmente en la oscuridad a temperatura ambiente y humedad ambiente. Después de 48 h se determina la eficacia. Para esto, se golpean las garrapatas en la base del tubo y se incuban como máximo 5 min sobre una placa caliente a 45-50 °C. Se consideran muertas o moribundas las garrapatas que quedan inmóviles sobre la base o se mueven tan descoordinadamente

que no pueden evitar deliberadamente el calor trepando hacia arriba.

Una sustancia muestra buena eficacia contra *Rhipicephalus sanguineus* cuando en esta prueba se logró al menos 80 % de eficacia a una tasa de aplicación de 5 µg/cm². A este respecto, 100 % de eficacia significa que todas las garrapatas estaban moribundas o muertas. 0 % de eficacia significa que no se dañó ninguna garrapata.

- 5 En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia del 100 % a una tasa de aplicación de 5 µg/cm² (500 g/ha): 2, 4, 24, 66, 57, 58.

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia del 80% a una tasa de aplicación de 5 µg/cm² (500 g/ha): 5, 7, 11, 12, 16, 33, 43, 50, 2-13, 2-14.

- 10 En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia del 100 % a una tasa de aplicación de 1 µg/cm² (100 g/ha): 6, 23, 77, 2-12.

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia del 80% a una tasa de aplicación de 1 µg/cm² (100 g/ha): 67.

Boophilus microplus – Prueba de inmersión

Animales de prueba: Garrapatas de ganado vacuno (*Boophilus microplus*) cepa Parkhurst, resistentes a SP
Disolvente: Sulfóxido de dimetilo

- 15 Se disolvieron 10 mg de principio activo en 0,5 ml de sulfóxido de dimetilo. Para producir una formulación adecuada, se diluye la disolución de principio activo con agua hasta la concentración respectivamente deseada.

Se pipetea esta preparación de principio activo en tubos. Se transfieren 8-10 garrapatas de ganado vacuno hembra adultas hinchadas (*Boophilus microplus*) a un tubo adicional con orificios. El tubo se sumerge en la preparación de principio activo en donde se mojan completamente las garrapatas. Después de escurrirse el líquido, las garrapatas se transfieren a discos de filtro en placas de plástico y se guardan en una sala climatizada.

- 20 El control de eficacia se realiza después de 7 días por la puesta de huevos fértiles. Los huevos cuya fertilidad no es externamente visible se guardan en un armario de climatización hasta la eclosión de las larvas después de aproximadamente 42 días. Una eficacia del 100 % significa que ninguna de las garrapatas puso huevos fértiles, 0 % significa que todos los huevos son fértiles.

- 25 En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia del 100 % a una tasa de aplicación de 100 ppm: 2, 2-13.

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia del 90 % a una tasa de aplicación de 100 ppm: 31.

Boophilus microplus – Prueba de inyección

Disolvente: Sulfóxido de dimetilo

- 30 Para la preparación de una preparación de principio activo adecuada se mezclan 10 mg de principio activo con 0,5 ml de disolvente y el concentrado se diluye con disolvente hasta la concentración deseada.

Se inyecta 1 µl de la disolución de principio activo en el abdomen de 5 garrapatas de ganado vacuno hembra adultas completamente hinchadas (*Boophilus microplus*). Los animales se transfieren a placas y se guardan en una sala climatizada.

- 35 El control de eficacia se realiza después de 7 días por la puesta de huevos fértiles. Los huevos cuya fertilidad no es externamente visible se guardan en un armario de climatización hasta la eclosión de las larvas después de aproximadamente 42 días. Una eficacia del 100 % significa que ninguna de las garrapatas puso huevos fértiles, 0 % significa que todos los huevos son fértiles.

- 40 En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia del 100 % a una tasa de aplicación de 20 µg/animal: 2, 3, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11, 12, 13, 15, 16, 19, 20, 21, 22, 23, 24, 25, 26, 27, 29, 30, 31, 32, 33, 36, 37, 38, 39, 40, 41, 42, 43, 44, 45, 46, 47, 48, 50, 51, 52, 53, 54, 55, 56, 57, 58, 66, 67, 68, 69, 70, 71, 72, 73, 74, 75, 76, 77, 2-1, 2-2, 2-3, 2-4, 2-5, 2-8, 2-9, 2-10, 2-11, 2-12, 2-13, 2-14.

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia del 80 % a una tasa de aplicación de 20 µg/animal: 14, 65, 2-6.

- 45 En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia del 100 % a una tasa de aplicación de 4 µg/animal: 17.

Ctenocephalides felis – Prueba oral

ES 2 836 399 T3

Disolvente:

Sulfóxido de dimetilo

Para la preparación de una preparación de principio activo adecuada se mezclan 10 mg de principio activo con 0,5 ml de sulfóxido de dimetilo. La concentración deseada se obtiene mediante dilución con sangre vacuna citrada.

5 Se utilizan aproximadamente 20 pulgas de gato adultas en ayunas (*Ctenocephalides felis*) en una cámara que está cerrada por arriba y por abajo con gasa. Se pone un cilindro metálico sobre la cámara cuya parte inferior está cerrada con parafilm. El cilindro contiene la sangre-preparación de principio activo que puede ser absorbida por las pulgas a través de la membrana de parafilm.

Después de 2 días se determina la destrucción en %. A este respecto, 100 % significa que todas las pulgas han sido destruidas; 0 % significa que no se destruyó ninguna pulga.

10 En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia del 100 % a una tasa de aplicación de 100 ppm: 2, 4, 6, 9, 11, 12, 13, 15, 16, 19, 20, 21, 22, 23, 24, 25, 26, 27, 30, 31, 32, 33, 36, 37, 38, 39, 40, 41, 42, 43, 44, 45, 46, 48, 49, 50, 51, 53, 54, 55, 56, 57, 58, 65, 66, 67, 68, 69, 70, 71, 73, 76, 77, 2-3, 2-11, 2-13, 2-14.

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia del 95 % a una tasa de aplicación de 100 ppm: 72, 75, 2-1, 2-2, 2-4, 2-9, 2-12.

15 En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia del 90 % a una tasa de aplicación de 100 ppm: 3, 5.

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia del 80 % a una tasa de aplicación de 100 ppm: 29, 47.

20 En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia del 100 % a una tasa de aplicación de 20 ppm: 17.

Lucilia cuprina - Prueba

Disolvente:

Sulfóxido de dimetilo

Para la preparación de una preparación de principio activo adecuada se mezclan 10 mg de principio activo con 0,5 ml de sulfóxido de dimetilo y el concentrado se diluye con agua hasta la concentración deseada.

25 Se transfieren aproximadamente 20 larvas L1 de moscas de la oveja australiana (*Lucilia cuprina*) a un recipiente de prueba que contiene carne de caballo picada y la preparación de principio activo de la concentración deseada.

Después de 2 días se determina la destrucción en %. A este respecto, 100% significa que se destruyeron todas las larvas; 0 % significa que no se destruyó ninguna larva.

30 En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia del 100 % a una tasa de aplicación de 100 ppm: 2, 4, 5, 6, 9, 11, 15, 19, 22, 23, 24, 25, 26, 30, 31, 32, 33, 36, 37, 38, 39, 40, 41, 42, 43, 44, 45, 46, 48, 49, 50, 51, 54, 56, 57, 58, 65, 66, 67, 68, 69, 70, 72, 73, 74, 76, 77, 2-3, 2-9, 2-11, 2-13.

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia del 98 % a una tasa de aplicación de 100 ppm: 2-1, 2-2.

35 En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia del 95 % a una tasa de aplicación de 100 ppm: 16.

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia del 90 % a una tasa de aplicación de 100 ppm: 12, 13, 27, 2-4, 2-8, 2-12, 2-14.

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia del 80 % a una tasa de aplicación de 100 ppm: 7, 55, 75.

40 En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia del 100 % a una tasa de aplicación de 20 ppm: 17.

Musca domestica - Prueba

Disolvente:

Sulfóxido de dimetilo

Para la preparación de una preparación de principio activo adecuada se mezclan 10 mg de principio activo con 0,5 ml de sulfóxido de dimetilo y el concentrado se diluye con agua hasta la concentración deseada.

Se pueblan con 10 moscas domésticas adultas (*Musca domestica*) recipientes que contienen una esponja que se trató con la disolución de azúcar y la preparación de principio activo de la concentración deseada.

Después de 2 días se determina la destrucción en %. A este respecto, 100 % significa que se destruyeron todas las moscas; 0 % significa que no se destruyó ninguna mosca.

- 5 En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia del 100 % a una tasa de aplicación de 100 ppm: 2, 6, 9, 11, 12, 15, 16, 19, 22, 24, 25, 30, 31, 39, 40, 41, 42, 43, 44, 45, 46, 48, 49, 50, 51, 52, 53, 54, 57, 58, 65, 66, 67, 68, 70, 77, 2-1, 2-3, 2-13.

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia del 90 % a una tasa de aplicación de 100 ppm: 20, 32, 33, 2-2, 2-14.

- 10 En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia del 80 % a una tasa de aplicación de 100 ppm: 5, 13, 23.

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia del 100 % a una tasa de aplicación de 20 ppm: 17.

Meloidogyne incognita - Prueba

Disolvente: 125,0 partes en peso de acetona

- 15 Para la preparación de una preparación de principio activo adecuada se mezcla 1 parte en peso de principio activo con la cantidad especificada de disolvente y el concentrado se diluye con agua hasta la concentración deseada.

Se llenan recipientes con arena, disolución de principio activo, una suspensión de huevos/larvas del nematodo del nudo de la raíz del sur (*Meloidogyne incognita*) y semillas de lechuga. Germinan las semillas de lechuga y se desarrollan las plantas. Se desarrollan agallas en las raíces.

- 20 Después de 14 días se determina la eficacia nematocida en % mediante la formación de agallas. A este respecto, 100 % significa que no se encontraron agallas; 0 % significa que el número de agallas en las plantas tratadas corresponde al control no tratado.

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran eficacia del 90 % a una tasa de aplicación de 20 ppm: 2-3, 2-4.

- 25 **Phaedon cochleariae – Prueba de pulverización**

Disolvente: 78,0 partes en peso de acetona
1,5 partes en peso de dimetilformamida
Emulsionante: alquilarilpoliglicol éter

Para la preparación de una preparación de principio activo adecuada se disuelve 1 parte en peso de principio activo con las partes especificadas en peso de disolvente y se llena con agua, que contiene una concentración de emulsionante de 1000 ppm, para lograr la concentración deseada. Para la preparación de concentraciones de prueba adicionales se diluye con agua que contiene emulsionante.

- 30 Se pulverizan discos de hoja de col china (*Brassica pekinensis*) con una preparación de principio activo de la concentración deseada y después de secarse se puebla con larvas del escarabajo de la hoja del rábano (*Phaedon cochleariae*).

Después de 7 días se determina la eficacia en %. A este respecto, 100 % significa que se destruyeron todas las larvas de escarabajo; 0 % significa que no se destruyó ninguna larva de escarabajo.

- 35 En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran eficacia del 100 % a una tasa de aplicación de 500 g/ha: 2, 3, 4, 5

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran eficacia del 100 % a una tasa de aplicación de 100 g/ha: 6, 7, 9, 11, 12, 15, 16, 17, 19, 20, 22, 23, 24, 25, 26, 28, 30, 31, 32, 33, 35, 36, 37, 38, 39, 40, 41, 42, 43, 44, 45, 46, 48, 49, 50, 51, 54, 55, 57, 58, 65, 66, 67, 68, 69, 70, 71, 72, 73, 74, 76, 77, 2-1, 2-2, 2-3, 2-4, 2-11, 2-12, 2-13, 2-14.

- 40 En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran eficacia del 83 % a una tasa de aplicación de 100 g/ha: 18, 2-8.

Spodoptera frugiperda – Prueba de pulverización

Disolvente: 78,0 partes en peso de acetona

1,5 partes en peso de dimetilformamida

Emulsionante: alquilarilpoliglicol éter

Para la preparación de una preparación de principio activo adecuada se disuelve 1 parte en peso de principio activo con las partes especificadas en peso de disolvente y se llena con agua, que contiene una concentración de emulsionante de 1000 ppm, para lograr la concentración deseada. Para la preparación de concentraciones de prueba adicionales se diluye con agua que contiene emulsionante.

- 5 Se pulverizan discos de hoja de maíz (*Zea mays*) con una preparación de principio activo de la concentración deseada y después de secarse se puebla con orugas del gusano cogollero (*Spodoptera frugiperda*).

Después de 7 días se determina la eficacia en %. A este respecto, 100 % significa que se destruyeron todas las orugas; 0 % significa que no se destruyó ninguna oruga.

- 10 En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran eficacia del 100 % a una tasa de aplicación de 500 g/ha: 2, 4, 5

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran eficacia del 100 % a una tasa de aplicación de 100 g/ha: 2, 4, 5, 6, 9, 11, 12, 15, 16, 17, 18, 19, 20, 21, 22, 23, 24, 25, 26, 30, 31, 32, 33, 35, 36, 37, 39, 40, 42, 43, 44, 45, 46, 48, 49, 50, 51, 54, 65, 66, 57, 58, 67, 68, 69, 70, 71, 73, 74, 76, 77, 2-1, 2-2, 2-3, 2-4, 2-11, 2-12, 2-13, 2-14.

- 15 En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran eficacia del 83 % a una tasa de aplicación de 100 g/ha: 7, 13, 41.

Tetranychus urticae – Prueba de pulverización, resistente a OP

Disolvente: 78,0 partes en peso de acetona

1,5 partes en peso de dimetilformamida

Emulsionante: alquilarilpoliglicol éter

- 20 Para la preparación de una preparación de principio activo adecuada se disuelve 1 parte en peso de principio activo con las partes especificadas en peso de disolvente y se llena con agua, que contiene una concentración de emulsionante de 1000 ppm, para lograr la concentración deseada. Para la preparación de concentraciones de prueba adicionales se diluye con agua que contiene emulsionante.

Se pulverizan discos de hoja de judía (*Phaseolus vulgaris*), que están infestados por todos los estadios de las arañas rojas (*Tetranychus urticae*), con una preparación de principio activo de la concentración deseada.

- 25 Después de 6 días se determina la eficacia en %. A este respecto, 100 % significa que se destruyeron todos los arañas rojas; 0 % significa que no se destruyó ninguna araña roja.

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia del 100 % a una tasa de aplicación de 500 g/ha: 2, 5.

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia del 90 % a una tasa de aplicación de 500 g/ha: 3, 4.

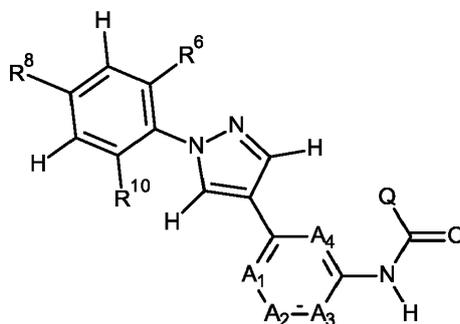
- 30 En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia del 100 % a una tasa de aplicación de 100 g/ha: 2, 4, 5, 6, 7, 9, 12, 17, 19, 20, 22, 24, 25, 31, 39, 40, 42, 50, 54, 65, 66, 67, 68.

En esta prueba, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una eficacia del 90 % a una tasa de aplicación de 100 g/ha: 11, 33, 51, 2-1, 2-2, 2-3, 2-13

- 35

REIVINDICACIONES

1. Compuesto de la fórmula (I')



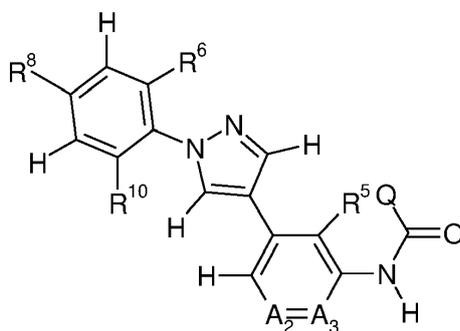
(I')

donde

- 5 A₁ representa CR², en donde R² representa hidrógeno,
 A₂ representa CR³ o N, en donde R³ representa hidrógeno,
 A₃ representa CR⁴ o N, en donde R⁴ representa hidrógeno, Cl, F, o alquilo C₁-C₃ o -N(alquilo C₁-C₃)₂,
 A₄ representa CR⁵, en donde R⁵ representa hidrógeno o F,
 R⁶ representa Cl, Br o alquilo C₁-C₃,
 10 R⁸ representa alquilo C₁-C₄ perfluorado,
 R¹⁰ representa Cl, alquilo C₁-C₃ o alquilo C₁-C₃ perfluorado,
 Q representa (a) cicloalquilo C₃-C₆ opcionalmente sustituido con un sustituyente seleccionado del grupo
 constituido por halógeno, alquilo C₁-C₃ y ciano, (b) heterociclilo C₂-C₅ opcionalmente sustituido con un
 sustituyente seleccionado del grupo constituido por halógeno o ciano, (c) un arilo sustituido con 0, 1 o 2
 15 sustituyentes V o un heteroarilo de 5 o 6 miembros sustituido con 0, 1, 2, 3 o 4 sustituyentes V, en donde V
 representa, independientemente entre sí, halógeno, ciano, alquilo C₁-C₆ opcionalmente halogenado, alcoxi C₁-
 C₆ opcionalmente halogenado,

así como sales, N-óxidos y formas tautómeras de los compuestos de la fórmula (I').

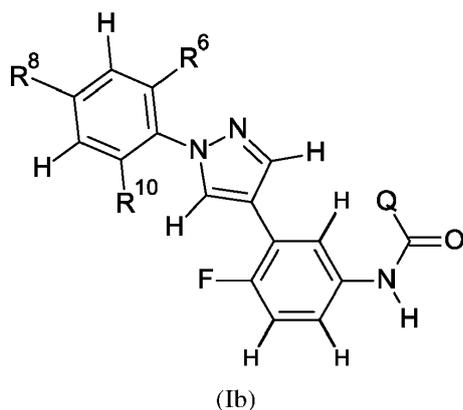
- 20 2. Compuesto según la reivindicación 1, en donde Q representa
 ciclopropilo o tietanilo (tiaciclobutanilo) opcionalmente sustituido con ciano o alquilo C₁-C₃, o
 fenilo sustituido con 0, 1 o 2 sustituyentes V seleccionados, independientemente entre sí, del grupo constituido por
 F, Cl, alcoxi C₁-C₃, alquilo C₁-C₃, alquilo C₁-C₃ halogenado y ciano, o
 piridilo, pirimidinilo, tiofenilo, tienilo u oxazolilo sustituido con 0, 1 o 2 sustituyentes V seleccionados,
 independientemente entre sí, del grupo constituido por F, Cl, alquilo C₁-C₃, alquilo C₁-C₃ halogenado y ciano.
 25 3. Compuesto según una de las reivindicaciones precedentes, en donde un compuesto de la fórmula (I') es un
 compuesto de la fórmula (Ia):



(Ia)

donde A₂, A₃, R⁵, R⁶, R⁸ y R¹⁰ se definen según una de las reivindicaciones 1 o 2 precedentes.

4. Compuesto de la fórmula (Ib)



donde

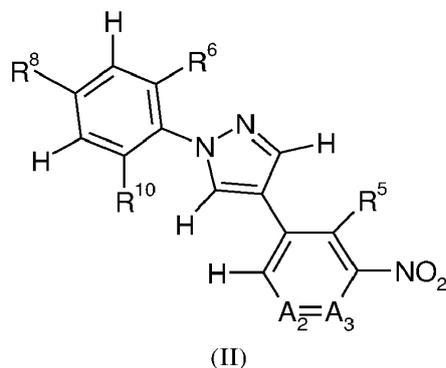
R⁶ representa Cl, Br o alquilo C₁-C₃,

R⁸ representa alquilo C₁-C₆ perfluorado,

R¹⁰ representa Cl, alquilo C₁-C₃ o perfluorado alquilo C₁-C₃, y

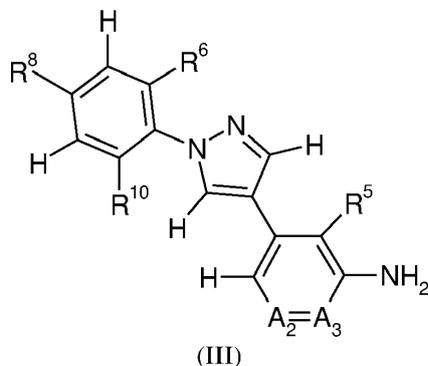
Q representa cicloalquilo C₃-C₆ opcionalmente sustituido con un sustituyente seleccionado del grupo constituido por halógeno, alquilo C₁-C₃ y ciano, heterociclilo C₂-C₅ opcionalmente sustituido con un sustituyente seleccionado del grupo constituido por halógeno o ciano, representa un arilo sustituido con 0, 1 o 2 sustituyentes V o representa un heteroarilo de 5 o 6 miembros sustituido con 0, 1, 2, 3 o 4 sustituyentes V, en donde V representa, independientemente entre sí, halógeno, ciano, representa alquilo C₁-C₆ opcionalmente halogenado, representa alcoxi C₁-C₆ opcionalmente halogenado.

5. Compuesto de la fórmula (II)



donde A₂, A₃, R⁵, R⁶, R⁸ y R¹⁰ se definen según una de las reivindicaciones 1 o 2 precedentes.

15 6. Compuesto de la fórmula (III)



donde A₂, A₃, R⁵, R⁶, R⁸ y R¹⁰ se definen según una de las reivindicaciones 1 o 2 precedentes.

7. Composiciones farmacéuticas que contienen por lo menos un compuesto según una de las reivindicaciones 1 a 4.

8. Compuestos de la fórmula (I') según la reivindicación 1 para su uso para combatir parásitos animales.