



19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA

11 Número de publicación: **2 358 683**

51 Int. Cl.:

C07D 261/04 (2006.01)

C07D 413/12 (2006.01)

C07D 417/12 (2006.01)

A01N 43/80 (2006.01)

C07D 401/04 (2006.01)

A01P 17/00 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Número de solicitud europea: **06848263 .7**

96 Fecha de presentación : **28.12.2006**

97 Número de publicación de la solicitud: **1973888**

97 Fecha de publicación de la solicitud: **01.10.2008**

54 Título: **Isoxazolinas para controlar plagas invertebradas.**

30 Prioridad: **30.12.2005 US 755247 P**
23.08.2006 US 839988 P
07.11.2006 US 857307 P

45 Fecha de publicación de la mención BOPI:
12.05.2011

45 Fecha de la publicación del folleto de la patente:
12.05.2011

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

72 Inventor/es: **Lahm, George, Philip;**
Shoop, Wesley, Lawrence y
Xu, Ming

74 Agente: **Elzaburu Márquez, Alberto**

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

Isoxazolinás para controlar plagas invertebradas.

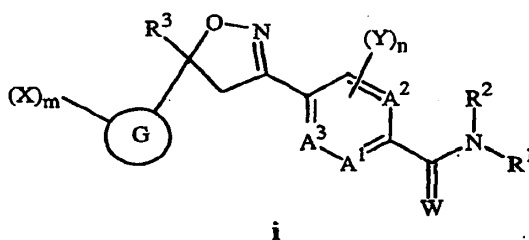
CAMPO DE LA INVENCIÓN

- 5 Esta invención se refiere a ciertas isoxalinas, sus N-óxidos, sales y composiciones adecuadas para usos agronómicos y no agronómicos, que incluyen aquellos usos listados a continuación, y métodos para su uso en el control de plagas de invertebrados tales como artrópodos en entornos tanto agronómicos como no agronómicos.

ANTECEDENTES DE LA INVENCIÓN

- 10 El control de plagas de invertebrados es extremadamente importante para conseguir una alta eficacia en los cultivos. Los daños ocasionados por las plagas de invertebrados en los cultivos agronómicos en crecimiento y almacenados pueden producir una reducción significativa de la productividad y, por lo tanto, pueden ocasionar un aumento en los costes para el consumidor. También es importante el control de las plagas de invertebrados en silvicultura, cultivos de invernaderos, plantas ornamentales, cultivos de viveros, productos de fibra y alimentarios almacenados, en ganadería, en artículos domésticos, césped, productos de la madera, y en la salud pública y de los animales.
- 15 Muchos productos están disponibles en el mercado para estos fines, pero sigue existiendo la necesidad de nuevos compuestos que sean más eficaces, menos costosos, menos tóxicos, más seguros desde el punto de vista medioambiental o que tengan diferentes modos de acción.

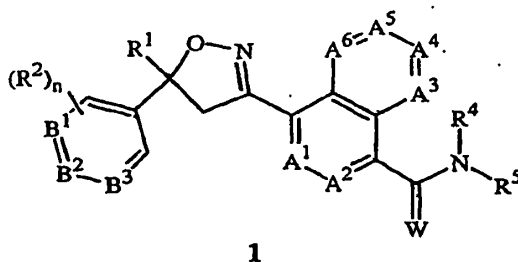
La publicación de patente PCT WO 05/085216 revela derivados de isoxazolina de la fórmula como insecticidas



- 20 en donde, *inter alia*, cada uno de A¹, A² y A³ son, de modo independiente, C o N; G es un anillo benceno; W es O o S; y X es halógeno o haloalquilo C₁-C₆.

SUMARIO DE LA INVENCIÓN

- 25 La presente invención se refiere a compuestos de la fórmula 1 incluyendo todos los isómeros geométricos y estereoisómeros, N-óxidos, y sus sales, y composiciones que los contienen y su uso para el control de plagas de invertebrados:



en la que

A¹, A², A³, A⁴, A⁵ y A⁶ están seleccionados, de modo independiente entre sí, del grupo que consiste en CR³ y N, siempre que, como máximo, 3 de A¹, A², A³, A⁴, A⁵ y A⁶ sean N;

- 30 B¹, B² y B³ están seleccionados, de modo independiente entre sí, del grupo que consiste en CR² y N;

W es O o S;

R¹ es alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alquil-cicloalquilo C₄-C₇ o cicloalquilalquilo C₄-C₇, cada uno opcionalmente sustituido con uno o varios sustituyentes seleccionados, de modo independiente, de R⁶;

- cada R^2 es, de modo independiente, H, halógeno, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 , alquil C_1-C_6 -tio, -haloalquil C_1-C_6 -tio, alquil C_1-C_6 -sulfinilo, haloalquil C_1-C_6 -sulfinilo, alquil C_1-C_6 -sulfonilo, haloalquil C_1-C_6 -sulfonilo, alquil C_1-C_6 -amino, dialquil C_2-C_6 -amino, alcoxi C_2-C_4 -carbonilo, -CN o -NO₂;
- 5 cada R^3 es, de modo independiente, H, halógeno, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , halocicloalquilo C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 , alquil C_1-C_6 -tio, haloalquil C_1-C_6 -tio, alquil C_1-C_6 -sulfinilo, haloalquil C_1-C_6 -sulfinilo, alquil C_1-C_6 -sulfonilo, haloalquil C_1-C_6 -sulfonilo, alquil C_1-C_6 -amino, dialquil C_2-C_6 -amino, -CN o -NO₂;
- R^4 es H, alquilo C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alquil-cicloalquilo C_4-C_7 , cicloalquilalquilo C_4-C_7 , alquil C_2-C_7 -carbonilo o alcoxi C_2-C_7 -carbonilo;
- 10 R^5 es H, OR¹⁰, NR¹¹R¹² o Q¹; o alquilo C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alquil-cicloalquilo C_4-C_7 o cicloalquilalquilo C_4-C_7 , cada uno opcionalmente sustituido con uno o varios sustituyentes seleccionados, de modo independiente, de R^7 ; o
- R^4 y R^5 se toman junto con el nitrógeno al que están unidos para formar un anillo que contiene 2 a 6 átomos de carbono y opcionalmente un átomo adicional seleccionado del grupo que consiste en N, S y O, dicho anillo opcionalmente sustituido con 1 a 4 sustituyentes seleccionados, de modo independiente, del grupo que consiste en
- 15 alquilo C_1-C_2 , halógeno, -CN, -NO₂ y alcoxi C_1-C_2 ;
- cada R^6 es, de modo independiente, halógeno, alquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , alquil C_1-C_6 -tio, alquil C_1-C_6 -sulfinilo, alquil C_1-C_6 -sulfonilo, -CN o -NO₂;
- cada R^7 es, de modo independiente, halógeno, alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , alquil C_1-C_6 -tio, alquil C_1-C_6 -sulfinilo, alquil C_1-C_6 -sulfonilo, alquil C_1-C_6 -amino, dialquil C_2-C_8 -amino, cicloalquil C_3-C_6 -amino, alquil C_2-C_7 -carbonilo, alcoxi C_2-C_7 -carbonilo, alquil C_2-C_7 -aminocarbonilo, dialquil C_3-C_9 -aminocarbonilo, haloalquil C_2-C_7 -carbonilo, haloalcoxi C_2-C_7 -carbonilo, haloalquil C_2-C_7 -aminocarbonilo, haloalquil C_3-C_9 -aminocarbonilo, hidroxilo, -NH₂, -CN o -NO₂; o Q²;
- 20 cada R^8 es, de modo independiente, halógeno, alcoxi C_1-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 , alquil C_1-C_6 -tio, haloalquil C_1-C_6 -tio, alquil C_1-C_6 -sulfinilo, haloalquil C_1-C_6 -sulfinilo, alquil C_1-C_6 -sulfonilo, haloalquil C_1-C_6 -sulfonilo, alquil C_1-C_6 -amino, dialquil C_2-C_6 -amino, alcoxi C_2-C_4 -carbonilo, -CN o -NO₂;
- cada R^9 es, de modo independiente, halógeno, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , halocicloalquilo C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 , alquil C_1-C_6 -tio, haloalquil C_1-C_6 -tio, alquil C_1-C_6 -sulfinilo, haloalquil C_1-C_6 -sulfinilo, alquil C_1-C_6 -sulfonilo, haloalquil C_1-C_6 -sulfonilo, alquil C_1-C_6 -amino, dialquil C_2-C_6 -amino, -CN, -NO₂, fenilo o piridinilo;
- 30 R^{10} es H; o alquilo C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alquil C_4-C_7 -cicloalquilo o cicloalquilalquilo C_4-C_7 , cada uno opcionalmente sustituido con uno o varios halógenos;
- R^4 es H, alquilo C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alquil-cicloalquilo C_4-C_7 , cicloalquilalquilo C_4-C_7 , alquil C_2-C_7 -carbonilo o alcoxi C_2-C_7 -carbonilo;
- R^{12} es H; Q³; o alquilo C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alquil-cicloalquilo C_4-C_7 o cicloalquilalquilo C_4-C_7 , cada uno opcionalmente sustituido con uno o varios sustituyentes seleccionados, de modo independiente, de R^7 ; o
- 35 R^{11} y R^{12} se toman junto con el nitrógeno al que están unidos para formar un anillo que contiene 2 a 6 átomos de carbono y opcionalmente un átomo adicional seleccionado del grupo que consiste en N, S y O, dicho anillo opcionalmente sustituido con 1 a 4 sustituyentes seleccionados, de modo independiente, del grupo que consiste en
- 40 alquilo C_1-C_2 , halógeno, -CN, -NO₂ y alcoxi C_1-C_2 ;
- Q¹ es un anillo fenilo, un anillo heterocíclico de 5 ó 6 miembros, o un sistema de anillos bicíclicos fusionados de 8, 9 ó 10 miembros que opcionalmente contiene uno a tres heteroátomos seleccionados de hasta 1 O, hasta 1 S y hasta 3 N, cada anillo o sistema de anillos opcionalmente sustituido con uno o varios sustituyentes seleccionados, de modo independiente, de R^9 ;
- 45 cada Q² es, de modo independiente, un anillo fenilo o un anillo heterocíclico de 5 ó 6 miembros, cada anillo opcionalmente sustituido con uno o varios sustituyentes seleccionados, de modo independiente, de R^9 ;
- Q³ es un anillo fenilo o un anillo heterocíclico de 5 ó 6 miembros, cada anillo opcionalmente sustituido con uno o varios sustituyentes seleccionados, de modo independiente, de R^9 ; y n es 0, 1 ó 2.
- La presente invención también provee una composición que comprende un compuesto de la fórmula 1, uno de sus N-óxidos o sales, y al menos un componente adicional seleccionado del grupo que consiste en un tensioactivo, un diluyente sólido y un diluyente líquido. En una forma de realización, esta invención también proporciona una composición para controlar una plaga de invertebrados que comprende una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto de Fórmula I, un N-óxido del mismo o una sal agronómica o no agronómica adecuada del mismo, y al
- 50

menos un componente adicional seleccionado del grupo que consiste en un tensioactivo, un diluyente sólido y un diluyente líquido, y dicha composición comprende opcionalmente además una cantidad eficaz de al menos un compuesto o agente biológicamente activo adicional.

La presente invención también provee una composición en spray para controlar una plaga de invertebrados que comprende una cantidad biológicamente efectiva de un compuesto de la fórmula 1, uno de sus *N*-óxidos o sales, o la composición descrita con anterioridad y un propelente. La presente invención también provee una composición de cebo para controlar una plaga de invertebrados que comprende una cantidad biológicamente efectiva de un compuesto de la fórmula 1, uno de sus *N*-óxidos o sales, o la composición descrita en la forma de realización anterior, uno o varios materiales alimenticios, opcionalmente un atrayente, y opcionalmente un humectante.

Esta invención proporciona además un dispositivo trampa para controlar una plaga de invertebrados que comprende dicha composición señuelo y una carcasa adaptada para alojar a dicha composición señuelo, en el que la carcasa tiene al menos una abertura dimensionada para permitir que la plaga de invertebrados pase a través de la abertura de tal modo que la plaga de invertebrados pueda acceder a dicha composición señuelo desde una localización exterior a la carcasa, y en el que la carcasa se adapta además para que esté situada dentro o cerca del lugar de una potencial o conocida actividad para la plaga de invertebrados.

La presente invención también provee un compuesto de la fórmula 1 para usar en un método para controlar una plaga de invertebrados que comprende poner en contacto la plaga de invertebrados o su medio ambiente con una cantidad biológicamente efectiva de un compuesto de la fórmula 1, uno de sus *N*-óxidos o sus sales, (por ejemplo, como una composición descrita en la presente). La presente invención también se refiere a un compuesto de la fórmula 1 para usar en dicho método, en donde la plaga de invertebrados o su medio ambiente se pone en contacto con una composición que comprende una cantidad biológicamente efectiva de un compuesto de la fórmula 1, uno de sus *N*-óxidos o sus sales, y al menos un componente adicional seleccionado del grupo que consiste en un tensioactivo, un diluyente sólido y un diluyente líquido, en donde dicha composición opcionalmente también comprende una cantidad biológicamente efectiva de al menos un compuesto o agente adicional biológicamente activo.

DETALLES DE LA INVENCION

Según se usa en la presente memoria, los términos "comprende", "que comprende", "incluye", "que incluye", "tiene", "que tiene", "contiene" o "que contiene" o cualquier otra de sus variaciones están destinados a cubrir una inclusión no exclusiva. Por ejemplo, una composición, una mezcla, proceso, método, artículo, o aparato que comprende una lista de elementos no está necesariamente limitada a solo aquellos elementos si no que puede incluir otros elementos no expresamente nombrados o inherentes a dicha composición, mezcla, proceso, método, artículo o aparato. Además, a menos que se exprese lo contrario, "o" se refiere a una "o" inclusiva y no a una "o" exclusiva. Por ejemplo, una condición A o B es satisfecha por cualquiera de los siguientes: A es verdadero (o está presente) y B es falso (o no está presente), A es falso (o no está presente) y B es verdadero (o está presente), y tanto A como B son verdaderos (o están presentes).

Asimismo, se pretende que los artículos indefinidos "un" y "uno(a)" que preceden a un elemento o componente de la invención no sean restrictivos con respecto al número de casos (es decir, sucesos) del elemento o componente. Por lo tanto "un" o "uno(a)" deben leerse para que incluyan uno o al menos uno, y la forma singular de la palabra del elemento o componente también incluye el plural a menos que el número signifique obviamente el singular.

Cuando se menciona en esta descripción, la expresión "plaga de invertebrados" incluye artrópodos, gasterópodos y nematodos de interés económico como plagas. El término "artrópodo" incluye insectos, ácaros, arañas, escorpiones, ciempiés, milpiés, cochinillas y sínfilos. El término "gasterópodo" incluye caracoles, babosas y otros estomatóforos. El término "helmintos" incluye gusanos en el filo de nematelminto, platihelminto y acantocéfalos tales como: gusanos redondos, gusanos de corazón, y Nematoda, Trematoda, Cestoda y gusanos de cabeza espinosa.

En el contexto de esta descripción, "control de plagas de invertebrados" implica inhibición del desarrollo de plagas de invertebrados (incluso mortalidad, reducción de alimentación, y/o disrupción de apareamiento), y las expresiones relacionadas se definen de manera análoga.

El término "agronómico" se refiere a la producción de cultivos tales como para alimentos y fibras e incluye el cultivo de maíz, soja y otras leguminosas, arroz, cereal (por ejemplo, trigo, avena, cebada, centeno, arroz, maíz), hortalizas de hoja (por ejemplo, lechuga, col, y otros cultivos de col), hortalizas de fruto (por ejemplo, tomates, pimiento, berenjena, repollos y cucurbitáceas), patatas, batatas, uvas, algodón, frutos de árboles (por ejemplo, frutos de pepitas, grano y cítricos), frutas pequeñas (bayas, guindas) y otros cultivos especiales (por ejemplo, colza, girasol, olivos). El término "no agronómico" se refiere a otras aplicaciones de cultivos hortícolas (por ejemplo, plantas de invernadero, viveros u ornamentales no cultivados en el campo), estructuras residenciales y comerciales en establecimientos urbanos e industriales, césped (comercial, golf, residencial, recreativo, etc.), productos de la madera, productos agro-forestales almacenados y administración de vegetación, salud pública (humanos) y salud animal (plagas, ganadería, volatería, animales no domesticados tales como animales salvajes).

En las indicaciones anteriores, el término "alquilo", usado sólo o en palabras compuestas tales como "alquiltio" o "haloalquilo" incluye alquilo de cadena lineal o ramificada, tal como metilo, etilo, *n*-propilo, *i*-propilo, o los diferentes isómeros de butilo, pentilo o hexilo. "Alquenilo" incluye alquenos de cadena lineal o ramificados tales como etenilo, 1-propenilo, 2-propenilo, y los diferentes isómeros de butenilo, pentenilo y hexenilo. "Alquienilo" también incluye polienos tales como 1,2-propadienilo y 2,4-hexadienilo. "Alquinilo" incluye alquinos de cadena lineal o ramificados tales como etinilo, 1-propinilo, 2-propinilo y los diferentes isómeros de butinilo, pentinilo y hexinilo. "Alquinilo" también puede incluir restos compuestos por múltiples triples enlaces tales como 2,5-hexadiinilo.

"Alcoxi" incluye, por ejemplo, metoxi, etoxi, *n*-propiloxi, isopropiloxi y los diferentes isómeros de butoxi, pentoxi y hexiloxi. "Alquiltio" incluye restos alquiltio de cadena lineal o ramificada tales como metiltio, etiltio, y los diferentes isómeros de propiltio, butiltio, pentiltio y hexiltio. "Alquilsulfonilo" incluye ambos enantiómeros de un grupo alquil-sulfonilo. Los ejemplos de "alquil-sulfonilo" incluyen $\text{CH}_3\text{S}(\text{O})-$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})-$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(\text{O})-$, $(\text{CH}_3)_2\text{CHS}(\text{O})-$ y los diferentes isómeros de butilsulfonilo, pentilsulfonilo y hexilsulfonilo. Los ejemplos de "alquilsulfonilo" incluyen $\text{CH}_3\text{S}(\text{O})_2-$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2-$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2-$, $(\text{CH}_3)_2\text{CHS}(\text{O})_2-$, y los diferentes isómeros de butilsulfonilo, pentilsulfonilo y hexilsulfonilo. "Alquilamino", "dialquilamino", y similares, se definen análogamente a los ejemplos anteriores. "Cicloalquilo" incluye, por ejemplo, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo y ciclohexilo. El término "alquilocicloalquilo" denota sustitución de alquilo en un resto de cicloalquilo e incluye, por ejemplo, etilciclopropilo, *i*-propilciclobutilo, 3-metilciclopentilo y 4-metilcicloheilo. El término "cicloalquilalquilo" denota sustitución de cicloalquilo en un resto de alquilo: Ejemplos de "cicloalquilalquilo" incluyen ciclopropilmetilo, ciclopentiletilo, y otros restos cicloalquilo unidos a grupos alquilo de cadena lineal o ramificados.

El término "halógeno", ya sea solo o en palabras compuestas tales como "haloalquilo", o cuando se usa en descripciones tales como "alquilo sustituido con halógeno" incluye flúor, cloro, bromo o yodo. Además, cuando se usa en palabras compuestas tales como "haloalquilo", o cuando se usa en descripciones tales como "alquilo sustituido con halógeno", dicho alquilo puede estar parcial o totalmente sustituido con átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes. Los ejemplos de "haloalquilo" o "alquilo sustituido con halógeno" incluyen $\text{F}_3\text{C}-$, ClCH_2- , CF_3CH_2- y CF_3CCl_2- . Los términos "halocicloalquilo", "haloalcoxi", "haloalquiltio", y similares se definen de forma análoga al término "haloalquilo". Los ejemplos de "haloalcoxi" incluyen $\text{CF}_3\text{O}-$, $\text{CCl}_3\text{CH}_2\text{O}-$, $\text{HCF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}-$ y $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{O}-$. Los ejemplos de "haloalquiltio" incluyen $\text{CCl}_3\text{S}-$, $\text{CF}_3\text{S}-$, $\text{CCl}_3\text{CH}_2\text{S}-$ y $\text{ClCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S}-$. Los ejemplos de "haloalquil-sulfonilo" incluyen $\text{CF}_3\text{S}(\text{O})-$, $\text{CCl}_3\text{S}(\text{O})-$, $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})-$ y $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{S}(\text{O})-$. Los ejemplos de "haloalquilsulfonilo" incluyen $\text{CF}_3\text{S}(\text{O})_2-$, $\text{CCl}_3\text{S}(\text{O})_2-$, $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{S}(\text{O})_2-$ y $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{S}(\text{O})_2-$.

"Alquilcarbonilo" denota restos alquilo de cadena lineal o ramificada unidos a un resto de $\text{C}(=\text{O})$. Los ejemplos de "alquil-carbonilo" incluyen $\text{CH}_3\text{C}(=\text{O})-$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{C}(=\text{O})-$ y $(\text{CH}_3)_2\text{CHC}(=\text{O})-$. Los ejemplos de "alcoxi-carbonilo" incluyen $\text{CH}_3\text{OC}(=\text{O})-$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})-$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OC}(=\text{O})-$, $(\text{CH}_3)_2\text{CHOC}(=\text{O})-$ y los diferentes isómeros de butoxi- o pentoxycarbonilo.

El número total de átomos de carbono en un grupo sustituyente se indica mediante el prefijo " $\text{C}_i\text{-C}_j$ " donde *i* y *j* son números de 1 a 8. Por ejemplo, alquil-sulfonilo $\text{C}_1\text{-C}_4$ indica de metilsulfonilo a butilsulfonilo; alcoxialquilo C_2 indica CH_3OCH_2 ; alcoxialquilo C_3 indica, por ejemplo, $\text{CH}_3\text{CH}(\text{OCH}_3)$, $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2$ o $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2$; y alcoxialquilo C_4 indica los diversos isómeros de un grupo alquilo sustituido con un grupo alcoxi que contiene un total de cuatro átomos de carbono, donde los ejemplos incluyen $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2$ y $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2$.

Cuando un compuesto está sustituido con un sustituyente que porta un subíndice que indica que la cantidad de dichos sustituyentes puede exceder de 1, dichos sustituyentes (cuando excede de 1) están seleccionados, de modo independiente, del grupo de sustituyentes definidos, por ejemplo, $(\text{R}^2)_n$, *n* es 1, 2, 3, 4 ó 5. Cuando un grupo contiene un sustituyente que puede ser hidrógeno, por ejemplo R^2 , entonces, cuando este sustituyente se toma como hidrógeno, se sabe que este es equivalente a dicho grupo que no está sustituido.

El término "anillo heterocíclico", "heterociclo" o "sistema de anillos heterocíclicos" denota anillos o sistemas de anillos en donde al menos un átomo del anillo no es carbono, por ejemplo, nitrógeno, oxígeno o azufre. Típicamente, un anillo heterocíclico contiene no más de 4 nitrógenos, no más de 2 oxígenos y no más de 2 azufres. El anillo o sistema de anillos heterocíclicos puede unirse a través de cualquier carbono o nitrógeno disponible por reemplazo de un hidrógeno sobre dicho carbono o nitrógeno. El anillo heterocíclico puede ser un anillo saturado, parcialmente insaturado o completamente insaturado. Cuando un anillo heterocíclico completamente insaturado satisface la regla de Hückel, entonces dicho anillo también se denomina un "anillo heteroaromático" o "anillo heterocíclico aromático".

El término "anillo aromático" o "sistema de anillos aromáticos" denota carbociclos y heterociclos completamente insaturados en los que al menos un anillo del sistema de anillos policíclicos es aromático (donde aromático indica que la regla de Hückel está satisfecha para el sistema de anillos). El término "sistema de anillos bicíclicos fusionados" incluye un sistema de anillos compuesto por dos anillos fusionados en los que el anillo puede ser saturado, parcialmente insaturado o completamente insaturado. El término "sistema de anillos heterobícíclicos fusionados" incluye un sistema de anillos compuesto por dos anillos fusionados en los que al menos un átomo del anillo no es carbono y puede ser aromático o no aromático, tal como se definió con anterioridad.

El término "opcionalmente sustituido" en conexión con los anillos heterocíclicos se refiere a grupos que no están sustituidos o que tienen al menos un sustituyente no hidrógeno que no extingue la actividad biológica poseída por el

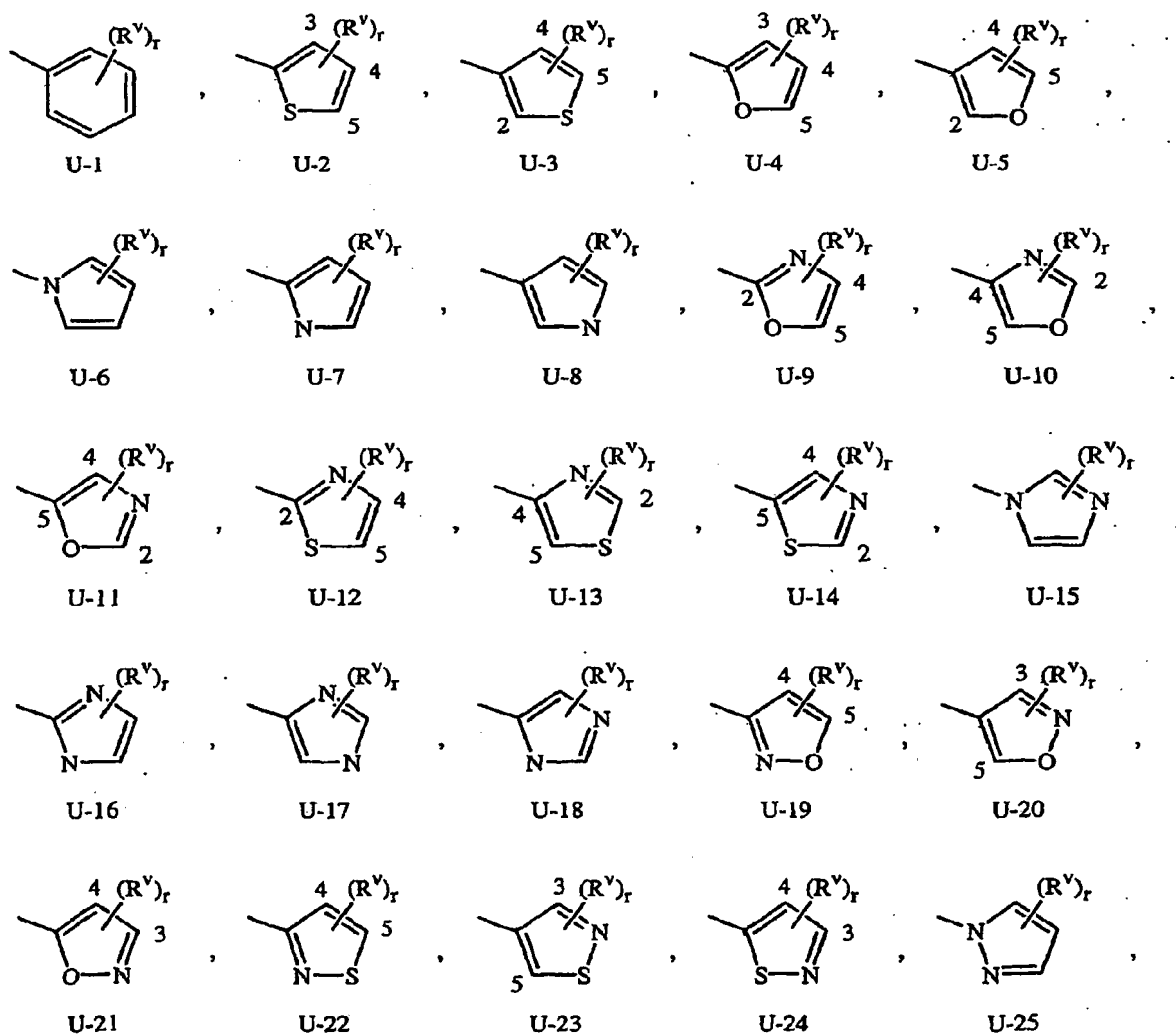
análogo no sustituido. Tal como se usa en la presente, las siguientes definiciones se pueden aplicar a menos que se indique otra cosa. El término "opcionalmente sustituido" se usa indistintamente con la frase "sustituido o no sustituido" o con el término "(no) sustituido." A menos que se indique otra cosa, un grupo opcionalmente sustituido puede tener un sustituyente en cada posición sustituible del grupo, y cada sustitución es independientemente de la otra.

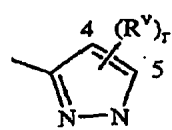
- 5 Cuando Q^1 es un anillo heterocíclico de 5 ó 6 miembros que contiene nitrógeno, puede estar unido al resto de la fórmula 1 a través de cualquier átomo del anillo de carbono o nitrógeno disponible, a menos que se describa otra cosa. De modo similar, cuando Q^2 o Q^3 es un heterociclo de 5 ó 6 miembros que contiene nitrógeno, puede estar unido a través de cualquier anillo de carbono o nitrógeno disponible, a menos que se describa otra cosa.

- 10 Tal como se describió con anterioridad, Q^1 , Q^2 o Q^3 pueden ser (entre otros) fenilo opcionalmente sustituido con uno o varios sustituyentes seleccionados de un grupo de sustituyentes tal como se definen en el compendio de la invención. Un ejemplo de fenilo opcionalmente sustituido con uno a cinco sustituyentes es el anillo ilustrado como U-1 en el Objeto 1, en donde R^v es R^8 o R^9 tal como se define en el compendio de la invención para Q^1 , Q^2 o Q^3 y r es un número entero de 0 a 5.

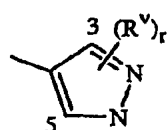
- 15 Tal como se notó con anterioridad, Q^1 , Q^2 o Q^3 puede ser (entre otros) un anillo heterocíclico de 5 ó 6 miembros que puede ser saturado o insaturado, opcionalmente sustituido con uno o varios sustituyentes seleccionados de un grupo de sustituyentes tal como se define en el compendio de la invención. Los ejemplos de un anillo heterocíclico aromático insaturado de 5 ó 6 miembros opcionalmente sustituido con uno o varios sustituyentes incluyen los anillos U-2 a U-61 ilustrados en el Objeto 1 en donde R^v es cualquier sustituyente tal como se define en el compendio de la invención para Q^1 , Q^2 o Q^3 (es decir, R^8 o R^9) y r es un número entero de 0 a 4.

20 Objeto 1

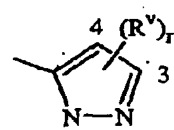




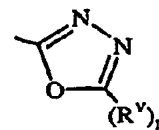
U-26



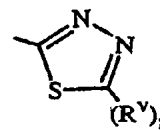
U-27



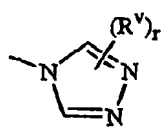
U-28



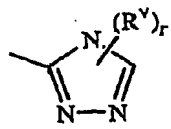
U-29



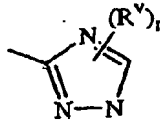
U-30



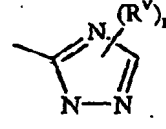
U-31



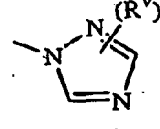
U-32



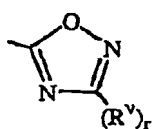
U-33



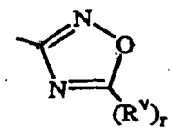
U-34



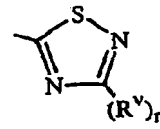
U-35



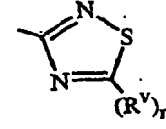
U-36



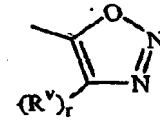
U-37



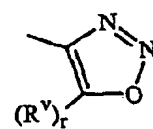
U-38



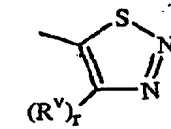
U-39



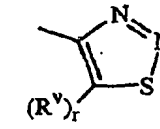
U-40



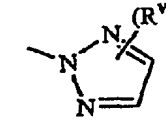
U-41



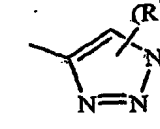
U-42



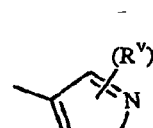
U-43



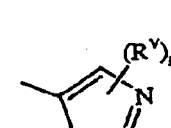
U-44



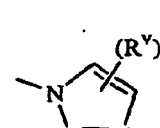
U-45



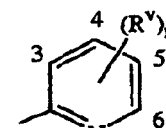
U-46



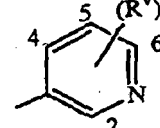
U-47



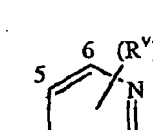
U-48



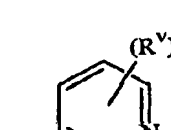
U-49



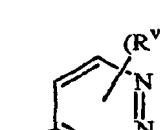
U-50



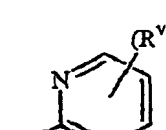
U-51



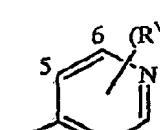
U-52



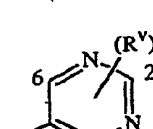
U-53



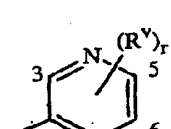
U-54



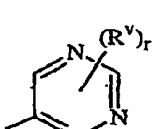
U-55



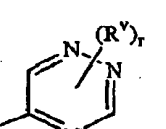
U-56



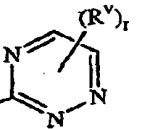
U-57



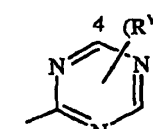
U-58



U-59



U-60



U-61

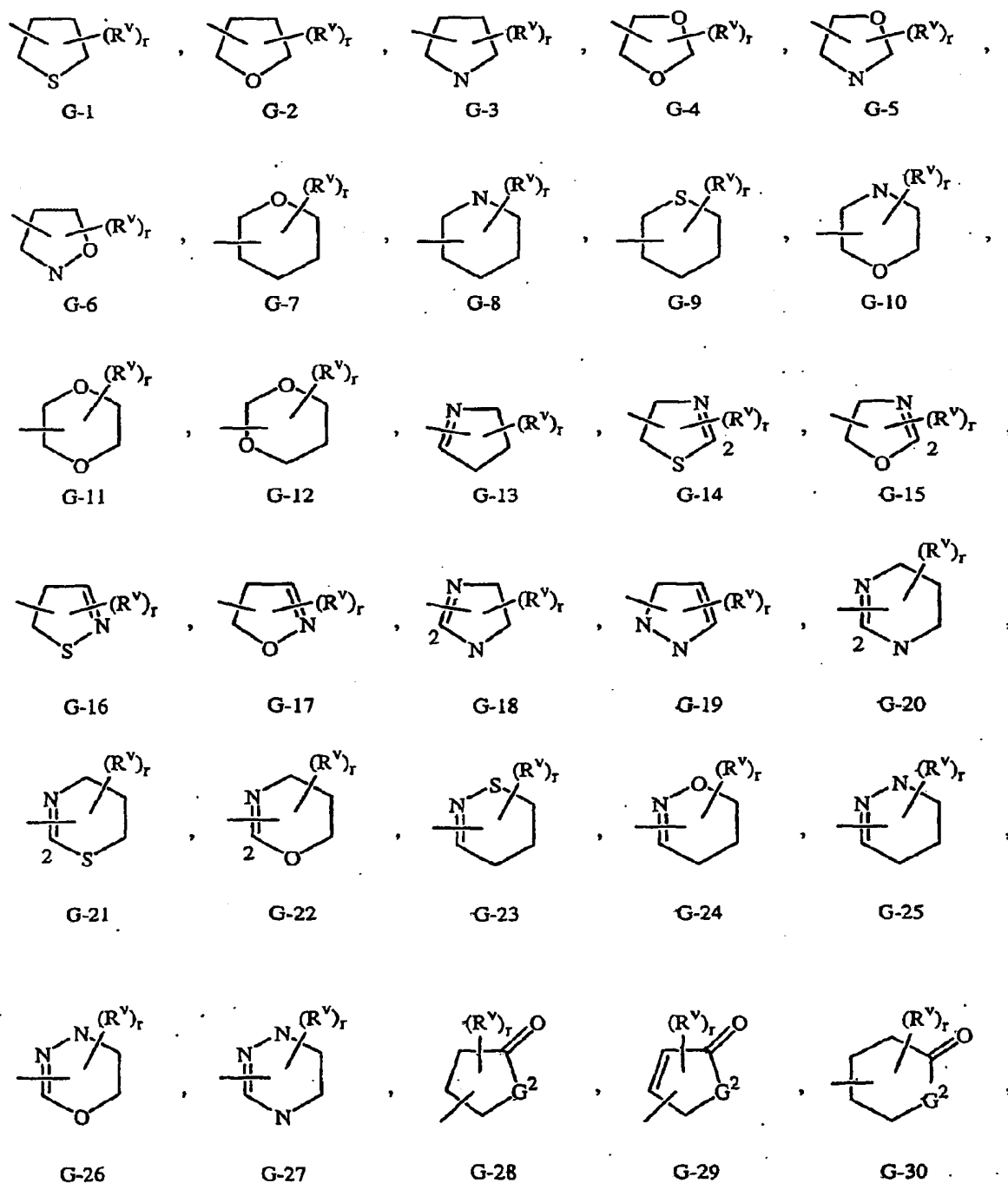
5

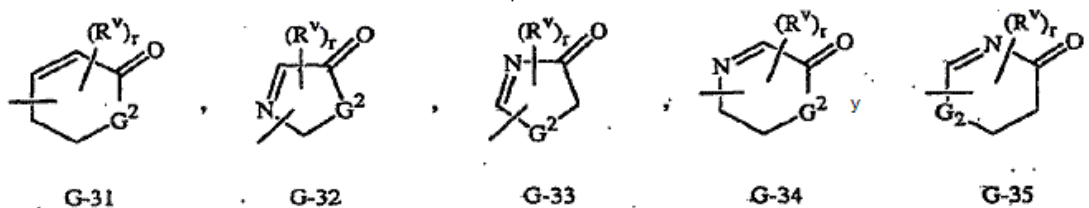
y

Notar que, cuando Q^1 , Q^2 o Q^3 es un anillo heterocíclico saturado o insaturado de 5 ó 6 miembros no aromático opcionalmente sustituido con uno o varios sustituyentes seleccionados del grupo de sustituyentes tal como se define en la síntesis de la invención para Q^1 , Q^2 o Q^3 , uno o dos miembros del anillo del heterociclo pueden estar opcionalmente en la forma oxidada de un resto carbonilo.

- 5 Los ejemplos de un anillo heterocíclico saturado o insaturado no aromático de 5 ó 6 miembros incluyen los anillos G-1 a G-35 tal como se ilustra en el objeto 2. Téngase en cuenta que cuando el punto de unión de estos grupos G se ilustra como flotante, el grupo G puede estar unido a la Fórmula I restante a través de cualquier carbono o nitrógeno disponible del grupo G por sustitución de un átomo de hidrógeno. Los sustituyentes opcionales pueden unirse a cualquier carbono o nitrógeno disponible reemplazando un átomo de hidrógeno.
- 10 Nótese que, cuando Q^1 , Q^2 o Q^3 comprende un anillo seleccionado de G-28 a G-35, G^2 está seleccionado de O, S o N. Nótese que, cuando G^2 es N, el átomo de nitrógeno puede completar su valencia por sustitución con H o los sustituyentes tal como se definen en el síntesis de la invención para Q^1 , Q^2 o Q^3 (es decir, R^8 o R^9).

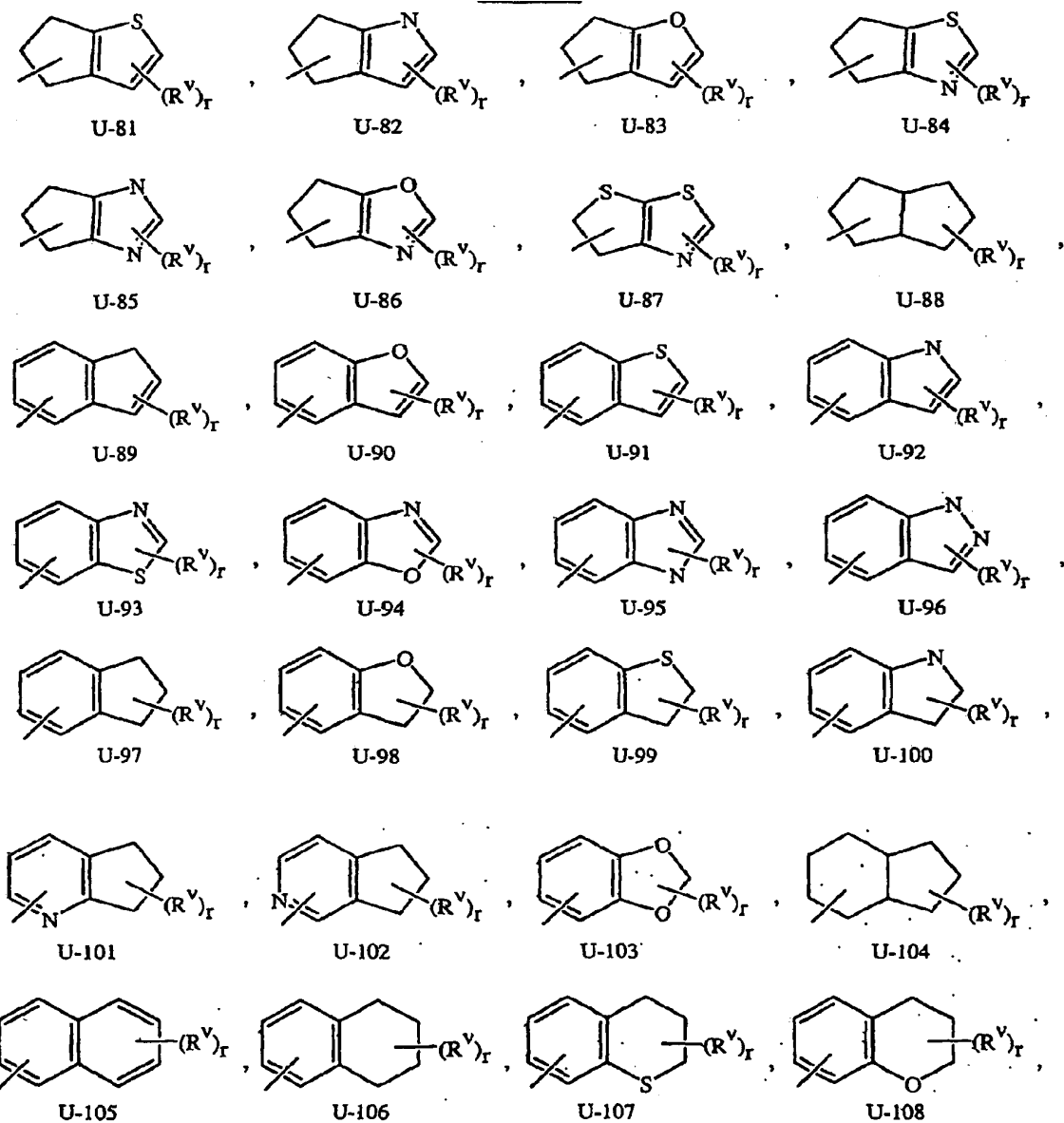
Objeto 2

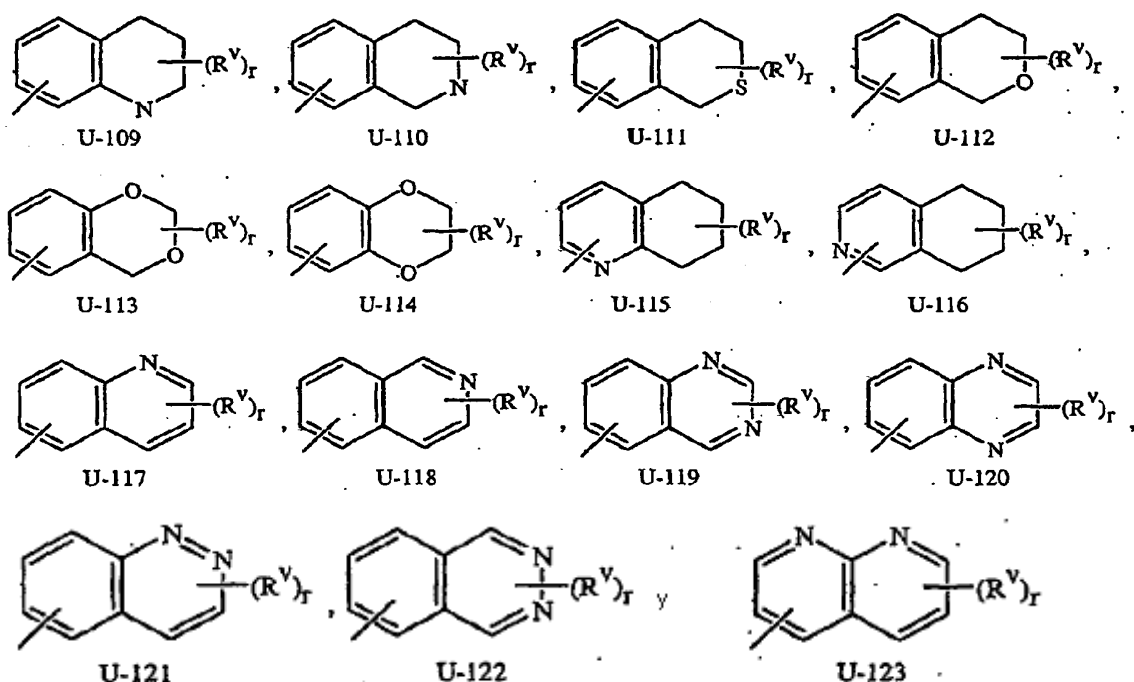




Tal como se notó con anterioridad, Q¹, Q² o Q³ puede ser (entre otros) un anillo heterocíclico de 8 9 ó 10 miembros que puede ser saturado o insaturado, opcionalmente sustituido con uno o varios sustituyentes seleccionados de un grupo de sustituyentes tal como se define en el compendio de la invención. Los ejemplos de un anillo heterocíclico aromático insaturado de 8 9 ó 10 miembros opcionalmente sustituido con uno o varios sustituyentes incluyen los anillos U-81 a U-123 ilustrados en el Objeto 3 en donde R^v es cualquier sustituyente tal como se define en el compendio de la invención para Q¹, Q² o Q³ (es decir, R⁸ o R⁹) y r es un número entero de 0 a 4.

Objeto 3





- 5 A pesar de que los grupos R^v se muestran en las estructuras U-1 a U-123, se nota que no necesitan estar presentes ya que son sustituyentes opcionales. Nótese que, cuando R^v es H al estar unido a un átomo, es el mismo si dicho átomo no está sustituido. Los átomos de nitrógeno que requieren sustitución para completar su valencia están sustituidos con H o R^v . Debe apreciarse que cuando el punto de unión entre $(R^v)_f$ y el grupo U se ilustra como flotante, $(R^v)_f$ puede unirse a cualquier átomo de carbono o átomo de nitrógeno disponible del grupo U. Téngase en
- 10 cuenta que cuando el punto de unión de estos grupos G se ilustra como flotante, el grupo U puede estar unido a la Fórmula I restante a través de cualquier carbono o nitrógeno disponible del grupo G por sustitución de un átomo de hidrógeno. 1 Nótese que algunos grupos U sólo pueden estar sustituidos con menos de 4 grupos R^v (por ejemplo, U-2 a U-5, U-7 a U-48, y U-52 a U-61).

- 15 Los compuestos de esta invención pueden existir como uno o más estereoisómeros. Los diversos estereoisómeros incluyen enantiómeros, diastereómeros, atropisómeros e isómeros geométricos. Un especialista en la técnica apreciará que un estereoisómero puede ser más activo y/o puede mostrar efectos beneficiosos cuando está enriquecido con respecto al otro u otros estereoisómeros o cuando se separa del otro u otros estereoisómeros. Además, el especialista sabe como separar, enriquecer y/o preparar de forma selectiva dichos estereoisómeros. Los
- 20 compuestos de la invención pueden estar presentes como una mezcla de estereoisómeros, estereoisómeros individuales o como una forma ópticamente activa.

- Un experto en la técnica apreciará que no todos los anillos heterocíclicos que contienen nitrógeno pueden formar *N*-óxidos ya que el nitrógeno requiere un par de electrones disponible para la oxidación al óxido; un experto en la técnica reconocerá los anillos heterocíclicos que contienen nitrógeno que pueden formar *N*-óxidos. Un especialista en la técnica también reconocerá qué aminas terciarias pueden formar *N*-óxidos. Los métodos sintéticos para la
- 25 preparación de *N*-óxidos de heterociclos y aminas terciarias se conocen muy bien por un especialista en la técnica, incluyendo la oxidación de heterociclos y aminas terciarias con peroxiácidos tales como ácido peracético y *m*-cloroperbenzoico (MCPBA), peróxido de hidrógeno, hidroperóxidos de alquilo tales como hidroperóxido de *t*-butilo, perborato sódico y dioxiranos tales como dimetildioxirano. Estos métodos para la preparación de *N*-óxidos se han descrito y revisado exhaustivamente en la bibliografía, véase, por ejemplo: T. L. Gilchrist en *Comprehensive Organic*
- 30 *Synthesis*, vol. 7, pp. 748-750, S. V. Ley, Ed., Pergamon Press; M. Tisler y B. Stanovnik en *Comprehensive Heterocyclic Chemistry*, vol. 3, pp 18-20, A. J. Boulton y A. McKillop, Eds., Pergamon Press; M. R. Grimmett y B. R. T. Keene en *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 43, pp 149-161, A. R. Katritzky, Ed., Academic Press; M. Tisler y B. Stanovnik en *Advances in Heterocyclic Chemistry*, Vol. 9, págs. 285-291, A. R. Katritzky y A. J. Boulton, Eds., Academic Press; y G. W. H. Cheeseman y E. S. G. Werstiuk en *Advances in Heterocyclic Chemistry*, vol. 22,
- 35 pp 390-392, A. R. Katritzky y A. J. Boulton, Eds., Academic Press.

- Las sales de los compuestos de la invención incluyen sales de adición de ácidos con ácidos inorgánicos u orgánicos tales como ácido bromhídrico, clorhídrico, nítrico, fosfórico, sulfúrico, acético, butírico, fumárico, láctico, maleico, malónico, oxálico, propiónico, salicílico, tartárico, 4-toluenosulfónico o valérico. Las sales de los compuestos de la invención incluyen también aquellas formadas con bases orgánicas (por ejemplo, piridina, amoniaco, o trietilamina) o
- 40 bases inorgánicas (por ejemplo, hidruros, hidróxidos, o carbonatos de sodio, potasio, litio, calcio, magnesio o bario) cuando el compuesto contiene un resto ácido tal como un ácido carboxílico o fenol.

Por consiguiente, la presente invención comprende los compuestos seleccionados entre la Fórmula 1, *N*-óxidos y sales de los mismos adecuadas desde el punto de vista agrícola.

Las formas de realización de la presente invención tal como se describen en la Síntesis de la invención incluyen:

- 5 Forma de realización 1. Un compuesto de la fórmula 1 en donde R^1 es alquilo C_1-C_3 opcionalmente sustituido con uno o varios sustituyentes seleccionados, de modo independiente, de R^6 .
- Forma de realización 2. Un compuesto de la forma de realización 1, en donde R^1 es alquilo C_1-C_3 opcionalmente sustituido con halógeno.
- 10 Forma de realización 3. Un compuesto de la forma de realización 2, en donde R^1 es alquilo C_1-C_3 sustituido con halógeno.
- Forma de realización 4. Un compuesto de la forma de realización 3, en donde R^1 es alquilo C_1-C_3 sustituido con F.
- Forma de realización 5. Un compuesto de la forma de realización 4, en donde R^1 es alquilo C_1-C_3 completamente sustituido con F.
- Forma de realización 6. Un compuesto de la forma de realización 5, en donde R^1 es CF_3 .
- 15 Forma de realización 7. Un compuesto de la fórmula 1, en donde cada R^2 es, de modo independiente, H, halógeno, haloalquilo C_1-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 o -CN.
- Forma de realización 8. Un compuesto de la forma de realización 7, en donde cada R^2 es, de modo independiente, H, CF_3 , OCF_3 , halógeno o -CN.
- 20 Forma de realización 9. Un compuesto de la forma de realización 7, en donde cada R^2 es, de modo independiente, halógeno o haloalquilo C_1-C_3 .
- Forma de realización 10. Un compuesto de la fórmula 1, en donde cada R^3 es, de modo independiente, H, halógeno, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , halocicloalquilo C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 , -CN o $-NO_2$.
- Forma de realización 11. Un compuesto de la forma de realización 10, en donde cada R^3 es, de modo independiente, H, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , cicloalquilo C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_4 o -CN.
- 25 Forma de realización 12. Un compuesto de la forma de realización 11, en donde cada R^3 es, de modo independiente, H, alquilo C_1-C_4 o -CN.
- Forma de realización 13. Un compuesto de la forma de realización 12, en donde cada R^3 es H.
- Forma de realización 14. Un compuesto de la fórmula 1, en donde R^4 es H, alquilo C_1-C_6 , alquil C_2-C_7 -carbonilo o alcoxi C_2-C_7 -carbonilo.
- 30 Forma de realización 15. Un compuesto de la forma de realización 14, en donde R^4 es H.
- Forma de realización 16. Un compuesto de la fórmula 1, en donde R^5 es H, OR^{10} , $NR^{11}R^{12}$ o Q^1 ; o alquilo C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alquil-cicloalquilo C_4-C_7 o cicloalquilalquilo C_4-C_7 , cada uno opcionalmente sustituido con uno o varios sustituyentes seleccionados, de modo independiente, de R^7 ;
- 35 Forma de realización 17. Un compuesto de la forma de realización 16, en donde R^5 es H; o alquilo C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alquil-cicloalquilo C_4-C_7 o cicloalquilalquilo C_4-C_7 , cada uno opcionalmente sustituido con uno o varios sustituyentes seleccionados, de modo independiente, de R^7 ;
- Forma de realización 18. Un compuesto de la forma de realización 17, en donde R^5 es H; o alquilo C_1-C_4 opcionalmente sustituido con uno o varios sustituyentes seleccionados, de modo independiente, de R^7 .
- 40 Forma de realización 19. Un compuesto de la forma de realización 18, en donde R^5 es alquilo C_1-C_4 opcionalmente sustituido con uno o varios sustituyentes seleccionados, de modo independiente, de R^7 .
- Forma de realización 20. Un compuesto de la forma de realización 19, en donde R^5 es CH_2CF_3 .
- Forma de realización 21. Un compuesto de la forma de realización 19, en donde R^5 es CH_2 -2-piridinilo.
- Forma de realización 22. Un compuesto de la forma de realización 16, en donde R^5 es OR^{10} , $NR^{11}R^{12}$ o Q^1 .
- Forma de realización 23. Un compuesto de la forma de realización 22, en donde R^5 es $NR^{11}R^{12}$

Forma de realización 24. Un compuesto de la forma de realización 22, en donde R^5 es Q^1 .

Forma de realización 25. Un compuesto de la fórmula 1, en donde R^6 es halógeno.

- 5 Forma de realización 26. Un compuesto de la fórmula 1, en donde cada R^7 es, de modo independiente, halógeno, alquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 , alquil C_1-C_4 -tio, alquil C_1-C_4 -sulfinilo, alquil C_1-C_4 -sulfonilo, alquil C_2-C_4 -carbonilo, alcoxi C_2-C_4 -carbonilo, alquil C_2-C_5 -aminocarbonilo, haloalquil C_2-C_5 -carbonilo, haloalcoxi C_2-C_5 -carbonilo, haloalquil C_2-C_5 -aminocarbonilo, $-NH_2$, $-CN$ o $-NO_2$; o Q^2 .

Forma de realización 27. Un compuesto de la forma de realización 26, en donde cada R^7 es, de modo independiente, halógeno, alcoxi C_2-C_4 -carbonilo, alquil C_2-C_5 -aminocarbonilo, haloalcoxi C_2-C_5 -carbonilo, haloalquil C_2-C_5 -aminocarbonilo, $-NH_2$, $-CN$ o $-NO_2$; o Q^2 .

- 10 Forma de realización 28. Un compuesto de la forma de realización 27, en donde cada R^7 es, de modo independiente, halógeno, alquil C_2-C_5 -aminocarbonilo, haloalquil C_2-C_5 -aminocarbonilo o Q^2 .

Forma de realización 29. Un compuesto de la forma de realización 28, en donde cada R^7 es, de modo independiente, halógeno o Q^2 .

- 15 Forma de realización 30. Un compuesto de la forma de realización 29, en donde cada R^7 es, de modo independiente, F, Cl o Br.

Forma de realización 31. Un compuesto de la forma de realización 30, en donde cada R^7 es F.

Forma de realización 32. Un compuesto de la forma de realización 29, en donde cada R^7 es Q^2 .

Forma de realización 33. Un compuesto de la fórmula 1, en donde cada R^8 es, de modo independiente, halógeno, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 o $-CN$.

- 20 Forma de realización 34. Un compuesto de la fórmula 1, en donde cada R^9 es halógeno, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , $-CN$, fenilo o piridinilo.

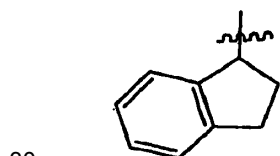
Forma de realización 35. Un compuesto de la fórmula 1, en donde R^{10} es H; o alquilo C_1-C_6 opcionalmente sustituido con uno o varios halógenos.

- 25 Forma de realización 36. Un compuesto de la fórmula 1, en donde R^{11} es H, alquilo C_1-C_6 , alquil C_2-C_7 -carbonilo o alcoxi C_2-C_7 -carbonilo.

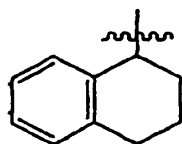
Forma de realización 37. Un compuesto de la forma de realización 34, en donde R^{11} es H.

Forma de realización 38. Un compuesto de la fórmula 1, en donde R^{12} es H o Q^3 ; o alquilo C_1-C_4 opcionalmente sustituido con uno o varios sustituyentes seleccionados, de modo independiente, de R^7 .

Forma de realización 39. Un compuesto de la fórmula 1, en donde Q^1 es fenilo, piridinilo, tiazolilo,



o



cada uno opcionalmente sustituido con uno o varios sustituyentes seleccionados, de modo independiente, de R^8 .

- 35 Forma de realización 40. Un compuesto de la fórmula 1, en donde cada Q^2 es, de modo independiente, fenilo, piridinilo o tiazolilo, cada uno opcionalmente sustituido con uno o varios sustituyentes seleccionados, de modo independiente, de R^9 .

Forma de realización 41. Un compuesto de la forma de realización 34, en donde cada Q^2 es, de modo independiente, fenilo, piridinilo o tiazolilo.

Forma de realización 42. Un compuesto de la fórmula 1, en donde Q^3 es fenilo, piridinilo o tiazolilo, cada uno opcionalmente sustituido con uno o varios sustituyentes seleccionados, de modo independiente, de R^9 .

Forma de realización 43. Un compuesto de la fórmula 1, en donde A^1, A^2, A^3, A^4, A^5 y A^6 son cada uno CR^3 .

Forma de realización 44. Un compuesto de la fórmula 1, en donde A^1 es N; y A^2, A^3, A^4, A^5 y A^6 son cada uno CR^3 .

5 Forma de realización 45. Un compuesto de la fórmula 1, en donde A^2 es N; y A^1, A^3, A^4, A^5 y A^6 son cada uno CR^3 .

Forma de realización 46. Un compuesto de la fórmula 1, en donde A^4 es N; y A^1, A^2, A^3, A^5 y A^6 son cada uno CR^3 .

Forma de realización 47. Un compuesto de la fórmula 1, en donde A^6 es N; y A^1, A^2, A^3, A^4 y A^5 son cada uno CR^3 .

Forma de realización 48. Un compuesto de la fórmula 1, en donde B^1, B^2 y $B^{3'}$ son, de modo independiente, CR^2 .

Forma de realización 49. Un compuesto de la forma de realización 48, en donde B^2 es CH.

10 Forma de realización 50. Un compuesto de la fórmula 1, en donde B^1 es N; y B^2 y $B^{3'}$ son, de modo independiente, CR^2 .

Forma de realización 51. Un compuesto de la fórmula 1, en donde B^2 es N; y B^1 y $B^{3'}$ son, de modo independiente, CR^2 .

Forma de realización 52. Un compuesto de la fórmula 1, en donde B^2 es CR^2 ; y B^1 y B^3 son N.

15 Forma de realización 53. Un compuesto de la fórmula 1, en donde W es O.

Forma de realización 54. Un compuesto de la fórmula 1, en donde n es 0.

20 Las formas de realización de esta invención, incluyendo las formas de realización 1-54 anteriores, así como cualquier otra forma de realización descrita en la presente, se puede combinar de cualquier manera, y las descripciones de las variables en las formas de realización pertenecen no sólo a los compuestos de la fórmula 1 sino también a los compuestos de partida y los compuestos intermediarios. Además, las formas de realización de esta invención, incluyendo las formas de realización 1-54 anteriores, así como cualquier otra forma de realización descrita en la presente y cualquiera de sus combinaciones pertenecen a las composiciones y métodos de la presente invención.

Las combinaciones de formas de realización 1-54 se ilustran por:

25 Forma de realización A. Un compuesto de la fórmula 1, en donde

R^1 es alquilo C_1-C_3 opcionalmente sustituido con uno o varios sustituyentes seleccionados, de modo independiente, de R^6 ;

cada R^2 es, de modo independiente, H, halógeno, haloalquilo C_1-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 o -CN; y

30 cada R^3 es, de modo independiente, H, halógeno, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , halocicloalquilo C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 , -CN o -NO₂.

Forma de realización B. Un compuesto de la forma de realización A, en donde

B^1, B^2 y $B^{3'}$ son, de modo independiente, CR^2 ;

W es O;

R^4 es H, alquilo C_1-C_6 , alquil C_2-C_7 .carbonilo o alcoxi C_2-C_7 .carbonilo; y

35 R^5 es H, $NR^{11}R^{12}$ o Q^1 ; o alquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alquil-cicloalquilo C_4-C_7 o cicloalquilalquilo C_4-C_7 , cada uno opcionalmente sustituido con uno o varios sustituyentes seleccionados, de modo independiente, de R^7 ;

Forma de realización C. Un compuesto de la forma de realización B, en donde

R^1 es alquilo C_1-C_3 opcionalmente sustituido con halógeno;

40 cada R^2 es, de modo independiente, H, CF₃, OCF₃, halógeno o -CN;

cada R^3 es, de modo independiente, H, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , ciclopropilo C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_4

o -CN; y cada R^7 es, de modo independiente, halógeno, alquilo C_1-C_4 , alcoxi C_1-C_4 , alquil C_1-C_4 -tio, alquil C_1-C_4 -sulfinilo, alquil C_1-C_4 -sulfonilo, alquil C_2-C_4 -carbonilo, alcoxi C_2-C_4 -carbonilo, alquil C_2-C_5 -aminocarbonilo, haloalquil C_2-C_5 -carbonilo, haloalcoxi C_2-C_5 -carbonilo, haloalquil C_2-C_5 -aminocarbonilo, $-NH_2$, $-CN$ o $-NO_2$; o Q^2 .

Forma de realización D. Un compuesto de la forma de realización C, en donde

5 R^4 es H;

R^5 es alquilo C_1-C_4 opcionalmente sustituido con uno o varios sustituyentes seleccionados, de modo independiente, de R^7 ;

cada R^7 es, de modo independiente, halógeno o Q^2 ; y

cada Q^2 es, de modo independiente, fenilo, piridinilo o tiazolilo.

10 Forma de realización E. Un compuesto de la forma de realización D, en donde

R^1 es CF_3 ;

A^1 , A^2 , A^3 , A^4 , A^5 y A^6 son cada uno CR^3 ;

B^2 es CR^2 ; y

cada R^3 es, de modo independiente, H, alquilo C_1-C_4 o $-CN$.

15 Forma de realización F. Un compuesto de la forma de realización E, en donde

B^2 es CH ;

cada R^2 es, de modo independiente, halógeno o haloalquilo C_1-C_3 ;

R^3 es H;

R^5 es CH_2CF_3 o CH_2 -2-piridinilo; y

20 n es 0.

Las formas de realización específicas incluyen compuestos de la fórmula 1 seleccionados del grupo que consiste en:

4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]-*N*-(2,2,2-trifluoroetil)-1-naftalencarboxamida,

4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]-*N*-(2-piridinilmetil)-1-naftalencarboxamida,

4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]-*N*-(2-piridinilmetil)-1-naftalencarbotioamida,

25 4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]-*N*-etil-1-naftalencarboxamida,

4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]-*N*-(2-metoxietil)-1-naftalencarboxamida,

4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]-*N*-[2-(2,2,2-trifluoroetil)-2-oxoetil]-1-naftalencarboxamida,

5-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]-*N*-(2-piridinilmetil)-8-quinolincarboxamida,

30 5-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]-*N*-(2-piridinilmetil)-8-isoquinolincarboxamida, y

1-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]-*N*-(2-piridinilmetil)-4-isoquinolincarboxamida.

Se han de notar formas de realización específicas que incluyen compuestos de la fórmula 1 seleccionados del grupo que consiste en:

4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]-*N*-(2,2,2-trifluoroetil)-1-naftalencarboxamida,

35 4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]-*N*-(2-piridinilmetil)-1-naftalencarboxamida,

4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]-*N*-(2-piridinilmetil)-1-naftalencarbotioamida,

5-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]-*N*-(2-piridinilmetil)-8-quinolincarboxamida,

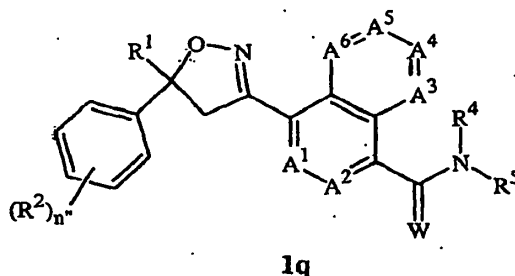
5-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]-*N*-(2-piridinilmetil)-8-isoquinolincarboxamida, y

1-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]-*N*-(2-piridinilmetil)-4-isoquinolincarboxamida.

Otras formas de realización específicas incluyen cualquier combinación de los compuestos de la fórmula 1 seleccionados del grupo inmediatamente anterior.

Las formas de realización de la presente invención también incluyen:

Forma de realización AA. Un compuesto de la fórmula 1q, un *N*-óxido, o sus sales,



5

en la que

A¹, A², A³, A⁴, A⁵ y A⁶ están seleccionados, de modo independiente entre sí, del grupo que consiste en CR³ y N, siempre que, como máximo, 3 de A¹, A², A³, A⁴, A⁵ y A⁶ sean N;

W es O o S;

- 10 R¹ es alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alquil-cicloalquilo C₄-C₇ o cicloalquilalquilo C₄-C₇, cada uno opcionalmente sustituido con uno o varios sustituyentes seleccionados, de modo independiente, de R⁶;

- 15 cada R² es, de modo independiente, H, halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆, tio, -haloalquil C₁-C₆, tio, alquil C₁-C₆, sulfinilo, haloalquil C₁-C₆, sulfinilo, alquil C₁-C₆, sulfonilo, haloalquil C₁-C₆, sulfonilo, alquil C₁-C₆, amino, dialquil C₂-C₆, amino, alcoxi C₂-C₄, carbonilo, -CN o -NO₂;

- 20 cada R³ es, de modo independiente, H, halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆, tio, haloalquil C₁-C₆, tio, alquil C₁-C₆, sulfinilo, haloalquil C₁-C₆, sulfinilo, alquil C₁-C₆, sulfonilo, haloalquil C₁-C₆, sulfonilo, alquil C₁-C₆, amino, dialquil C₂-C₆, amino, -CN o -NO₂;

- 25 R⁴ es H, alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alquil-cicloalquilo C₄-C₇, cicloalquilalquilo C₄-C₇, alquil C₂-C₇, carbonilo o alcoxi C₂-C₇, carbonilo;

- 30 R⁵ es H, OR¹⁰, NR¹¹R¹² o Q¹; o alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alquil-cicloalquilo C₄-C₇ o cicloalquilalquilo C₄-C₇, cada uno opcionalmente sustituido con uno o varios sustituyentes seleccionados, de modo independiente, de R⁷; o

- 35 R⁴ y R⁵ se toman junto con el nitrógeno al que están unidos para formar un anillo que contiene 2 a 6 átomos de carbono y opcionalmente un átomo adicional seleccionado del grupo que consiste en N, S y O, dicho anillo opcionalmente sustituido con 1 a 4 sustituyentes seleccionados, de modo independiente, del grupo que consiste en alquilo C₁-C₂, halógeno, -CN, -NO₂ y alcoxi C₁-C₂;

cada R⁶ es, de modo independiente, halógeno, alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆, tio, alquil C₁-C₆, sulfinilo, alquil C₁-C₆, sulfonilo, -CN o -NO₂;

- 40 cada R⁷ es, de modo independiente, halógeno, alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆, tio, alquil C₁-C₆, sulfinilo, alquil C₁-C₆, sulfonilo, alquil C₁-C₆, amino, dialquil C₂-C₆, amino, cicloalquil C₃-C₆, amino, alquil C₂-C₇, carbonilo, alcoxi C₂-C₇, carbonilo, alquil C₂-C₇, aminocarbonilo, dialquil C₃-C₉, aminocarbonilo, haloalquil C₂-C₇, carbonilo, haloalcoxi C₂-C₇, carbonilo, haloalquil C₂-C₇, aminocarbonilo, haloalquil C₃-C₉, aminocarbonilo, hidroxilo, -NH₂, -CN o -NO₂; o Q²;
- 35 cada R⁸ es, de modo independiente, halógeno, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆, tio, haloalquil C₁-C₆, tio, alquil C₁-C₆, sulfinilo, haloalquil C₁-C₆, sulfinilo, alquil C₁-C₆, sulfonilo, haloalquil C₁-C₆, sulfonilo, alquil C₁-C₆, amino, dialquil C₂-C₆, amino, alcoxi C₂-C₄, carbonilo, -CN o -NO₂;

- 40 cada R⁹ es, de modo independiente, halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆, tio, haloalquil C₁-C₆, tio, alquil C₁-C₆, sulfinilo, haloalquil C₁-C₆, sulfinilo, alquil C₁-C₆, sulfonilo, haloalquil C₁-C₆, sulfonilo, alquil C₁-C₆, amino, dialquil C₂-C₆, amino, -CN, -NO₂, fenilo o piridinilo;

R¹⁰ es H; o alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alquil C₄-C₇, cicloalquilo o cicloalquilalquilo C₄-C₇, cada uno opcionalmente sustituido con uno o varios halógenos;

R^4 es H, alquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alquil-cicloalquilo C_4-C_7 , cicloalquilalquilo C_4-C_7 , alquil C_2-C_7 -carbonilo o alcoxi C_2-C_7 -carbonilo;

5 R^{12} es H; Q^3 , o alquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alquil-cicloalquilo C_4-C_7 o cicloalquilalquilo C_4-C_7 , cada uno opcionalmente sustituido con uno o varios sustituyentes seleccionados, de modo independiente, de R^7 ; o

R^{11} y R^{12} se toman junto con el nitrógeno al que están unidos para formar un anillo que contiene 2 a 6 átomos de carbono y opcionalmente un átomo adicional seleccionado del grupo que consiste en N, S y O, dicho anillo opcionalmente sustituido con 1 a 4 sustituyentes seleccionados, de modo independiente, del grupo que consiste en alquilo C_1-C_2 , halógeno, -CN, -NO₂ y alcoxi C_1-C_2 ;

10 Q^1 es un anillo fenilo, un anillo heterocíclico de 5 ó 6 miembros, o un sistema de anillos bicíclicos fusionados de 8, 9 ó 10 miembros que opcionalmente contiene uno a tres heteroátomos seleccionados de hasta 1 O, hasta 1 S y hasta 3 N, cada anillo o sistema de anillos opcionalmente sustituido con uno o varios sustituyentes seleccionados, de modo independiente, de R^8 ;

15 cada Q^2 es, de modo independiente, un anillo fenilo o un anillo heterocíclico de 5 ó 6 miembros, cada anillo opcionalmente sustituido con uno o varios sustituyentes seleccionados, de modo independiente, de R^9 ;

Q^3 es un anillo fenilo o un anillo heterocíclico de 5 ó 6 miembros, cada anillo opcionalmente sustituido con uno o varios sustituyentes seleccionados, de modo independiente, de R^9 ; y n" es 1, 2, 3, 4 ó 5.

20 Se ha de notar que los compuestos de esta invención se caracterizan por patrones metabólicos favorable y/o residuales de suelo y exhiben una actividad de control de un espectro de plagas de invertebrados agronómicas y no agronómicas.

25 Por razones del espectro del control de plagas de invertebrados y por el interés económico, la protección por daños o accidentes en los cultivos agronómicos causados por las plagas de invertebrados mediante el control de las plagas de invertebrados son realizaciones de la invención. Los compuestos de esta invención debido a sus favorables propiedades de translocación o sistemicidad en plantas también protegen las partes foliares u otras partes de plantas que no están directamente en contacto con un compuesto de la fórmula 1 o una composición que comprende el compuesto.

30 También se han de destacar como formas de realización de la presente invención las composiciones que comprenden un compuesto de cualquiera de las formas de realización precedentes, así como cualquier otra forma de realización descrita en la presente y cualquiera de sus combinaciones, y al menos un componente adicional seleccionado del grupo que consiste en un tensioactivo, un diluyente sólido y un diluyente líquido, en donde dichas composiciones opcionalmente también comprenden al menos un compuesto o agente adicional biológicamente activo.

35 También son dignas de mencionar como formas de realización de la presente invención las composiciones para controlar una plaga de invertebrados que comprende una cantidad biológicamente efectiva de un compuesto de cualquiera de las formas de realización precedentes, así como cualquier otra forma de realización descrita en la presente, y cualquiera de sus combinaciones, y al menos un componente adicional seleccionado del grupo que consiste en un tensioactivo, un diluyente sólido y un diluyente líquido, en donde dichas composiciones opcionalmente también comprenden una cantidad biológicamente efectiva de al menos un compuesto o agente adicional biológicamente activo. Las formas de realización de la invención también incluyen métodos para controlar una plaga de invertebrados que comprende poner en contacto la plaga de invertebrados o su medio ambiente con una cantidad biológicamente efectiva de un compuesto de cualquiera de las formas de realización precedentes (por ejemplo, como una composición descrita en la presente).

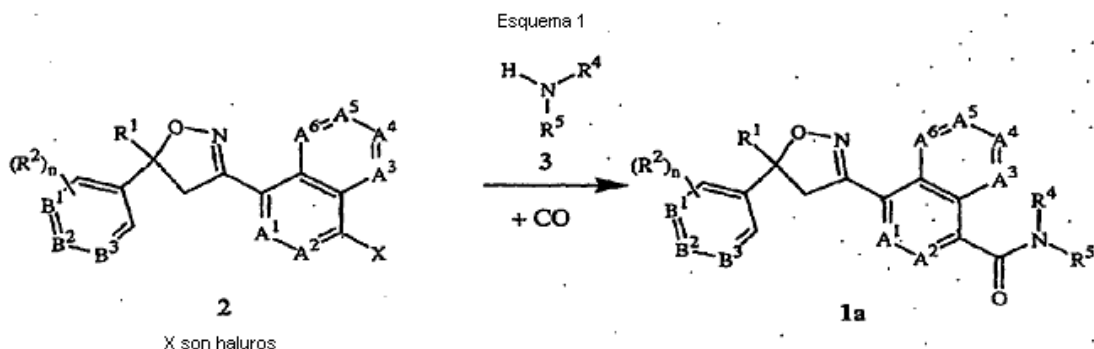
45 Las formas de realización de la invención también incluyen una composición que comprende un compuesto de cualquiera de las formas de realización precedentes, en forma de una formulación líquida para esparcir en suelos. Las formas de realización de la invención también incluyen métodos para controlar una plaga de invertebrados que comprende poner en contacto el suelo con una formulación líquida como un empape de suelo que comprende una cantidad biológicamente efectiva de un compuesto de cualquiera de las formas de realización precedentes.

50 Las formas de realización de la invención también incluyen una composición en spray para controlar una plaga de invertebrados que comprende una cantidad biológicamente efectiva de un compuesto de cualquiera de las formas de realización precedentes y un propelente. Las formas de realización de la invención también incluyen una composición de cebo para controlar una plaga de invertebrados que comprende una cantidad biológicamente efectiva de un compuesto de cualquiera de las formas de realización precedentes, uno o varios materiales comestibles, opcionalmente un atrayente, y opcionalmente un humectante. Las realizaciones de la invención también incluyen un dispositivo para controlar una plaga de invertebrados que comprende dicha composición señuelo y una carcasa adaptada que aloja dicha composición señuelo, en el que la carcasa tiene al menos una

abertura dimensionada para permitir que la plaga de invertebrados pase a través de la abertura de tal modo que la plaga de invertebrados tenga acceso a dicha composición señuelo desde una posición exterior a la carcasa, y en el que la carcasa se adapta además para situarse dentro o cerca de un lugar de potencial o conocida actividad para la plaga de invertebrados.

- 5 Uno o varios de los siguientes métodos y variaciones tal como se describe en los esquemas 1-12 se pueden usar para preparar los compuestos de la fórmula 1. Las definiciones de R^1 , R^2 , R^4 , R^5 , A^1 , A^2 , A^3 , A^4 , A^5 , A^6 , B^1 , B^2 , B^3 , n y W en los compuestos de las fórmulas 1-15 siguientes son tal como se definieron con anterioridad en la Síntesis de la invención, a menos que se indique otra cosa. Los compuestos de las fórmulas 1a y 1b son subgrupos de los compuestos de la fórmula 1, compuestos de las fórmulas 12a-12c son subgrupos de los compuestos de la fórmula 12, y el compuesto de la fórmula 15a es un compuesto de la fórmula 15.

Los compuestos de la fórmula 1a (fórmula 1 en donde W es O) se pueden preparar por medio de aminocarbonilación de bromuros o yoduros de arilo de la fórmula 2, en donde X es Br o I, con compuestos amino apropiadamente sustituidos de la fórmula 3 tal como se indica en el esquema 1.

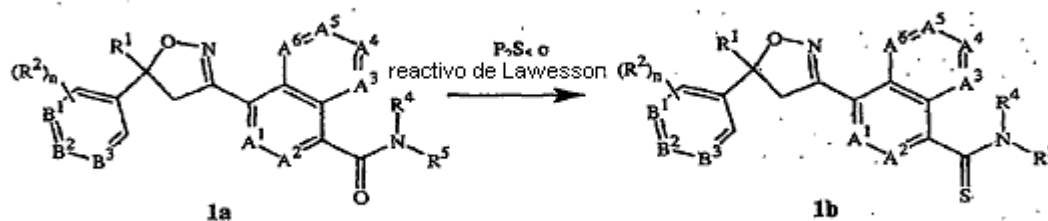


- 15 Esta reacción se lleva a cabo típicamente con un bromuro de arilo de la fórmula 2, en donde X es Br en presencia de un catalizador de paladio bajo una atmósfera de CO. Los catalizadores de paladio usados para el presente método comprenden típicamente paladio en un estado de oxidación formal de 0 (es decir, Pd(0)) o 2 (es decir, Pd(II)). Una amplia variedad de tales compuestos y complejos con contenido de paladio son de utilidad como catalizadores para el presente método. Los ejemplos de compuestos y complejos con contenido de paladio de utilidad como catalizadores en el método del esquema 1 incluyen $\text{PdCl}_2(\text{PPh}_3)_2$ (dicloruro de bis(trifenilfosfina)paladio (II)), $\text{Pd}(\text{PPh}_3)_4$ (tetrakis(trifenilfosfina)paladio(0)), $\text{Pd}(\text{C}_5\text{H}_7\text{O}_2)_2$ (acetilacetato de paladio (II)), $\text{Pd}_2(\text{dba})_3$ (tris(dibencilidenacetona)dipaladio (0)), y [1,1'-bis(difenil-fosfino)ferroceno]dicloropaladio (II). El método del esquema 1 se lleva a cabo en general en una fase líquida y, en consecuencia, es más efectivo el catalizador de paladio que preferentemente tiene una buena solubilidad en fase líquida. Los solventes de utilidad incluyen, por ejemplo, éteres tales como 1,2-dimetoxietano, amidas tales como *N,N*-dimetilacetamida, e hidrocarburos aromáticos no halogenados tales como tolueno.

- El método del esquema 1 se puede llevar a cabo en un amplio rango de temperaturas, que van de aprox. 25 a aprox. 150 °C. Se destacan temperaturas de aprox. 60 y aprox. 110 °C, que típicamente proveen velocidades de reacción rápidas y altos rendimientos de productos. Los métodos y procedimientos generales para la aminocarbonilación con un bromuro de arilo y una amina son bien conocidos en la literatura; ver, por ejemplo, H. Horino et al., *Synthesis* 1989, 715; y J. J. Li, G. W. Gribble, editores, *Palladium in Heterocyclic Chemistry: A Guide for the Synthetic Chemist*, 2000. El método del esquema 1 se ilustra en la Etapa C del Ejemplo 2 y Etapa la E del Ejemplo 4.

- Tal como se indica en el esquema 2, los compuestos de la fórmula 1b (fórmula 1 en la que W es S) se pueden preparar por tratamiento de los correspondientes compuestos de amida de la fórmula 1a con un reactivo de transferencia de tio tales como P_2S_5 (ver, por ejemplo, E. Klingsberg et al., *J. Am. Chem. Soc.* 1951, 72, 4988; E. C. Taylor Jr. et al., *J. Am. Chem. Soc.* 1953, 75, 1904; R. Crossley et al., *J. Chem. Soc. Perkin Trans. 1* 1976, 977) o reactivo de Lawesson (2,5-bis(4-metoxifenil)-1,3-ditio-2,4-difosfetano-2,4-disulfuro; ver, por ejemplo, S. Prabhakar et al. *Synthesis*, 1984, 829).

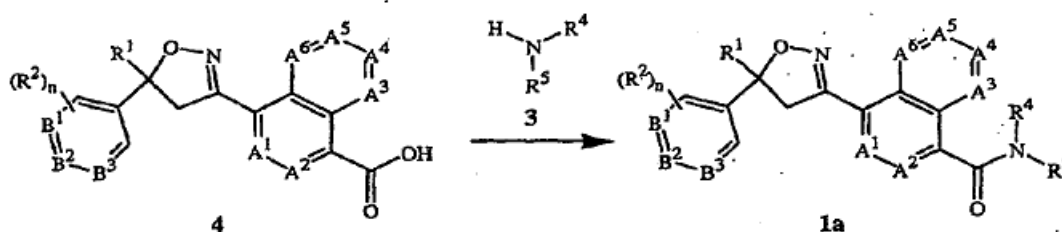
Esquema 2



El método del esquema 2 se puede realizar en un amplio rango de temperaturas, incluyendo de aprox. 50 a aprox. 150 °C. Se destacan temperaturas de aprox. 70 y aprox. 120 °C, que típicamente proveen velocidades de reacción rápidas y altos rendimientos de productos. El método del esquema 2 se ilustra en el ejemplo 3.

- 5 Los compuestos de la fórmula 1a también se pueden preparar acoplando ácidos carboxílicos de la fórmula 4 con compuestos amino apropiadamente sustituidos de la fórmula 3 tal como se indica en el esquema 3.

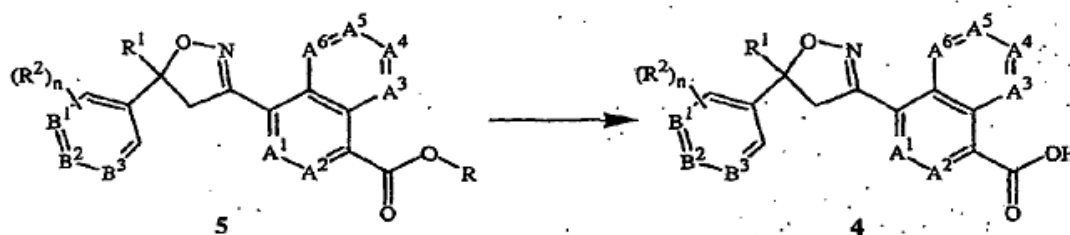
Esquema 3



- Esta reacción se lleva a cabo en general en presencia de un reactivo de acoplamiento deshidratante tales como dicitohexilcarbodiimida, 1-(3-dimetilaminopropil)-3-etilcarbodiimida, anhídrido cíclico de ácido 1-propanfosfónico o carbonildiimidazol en presencia de una base tales como trietilamina, piridina, 4-(dimetilamino)piridina o *N,N*-diisopropiletilamina en un disolvente aprótico anhidro tales como diclorometano o tetrahidrofurano a una temperatura típicamente entre temperatura ambiente y 70 °C. El método del esquema 3 se ilustra en la Etapa E del Ejemplo 1.

Los compuestos de la fórmula 4 se pueden preparar por hidrólisis del éster de la fórmula 5, en donde R es metilo o etilo, tal como se indica en el esquema 4.

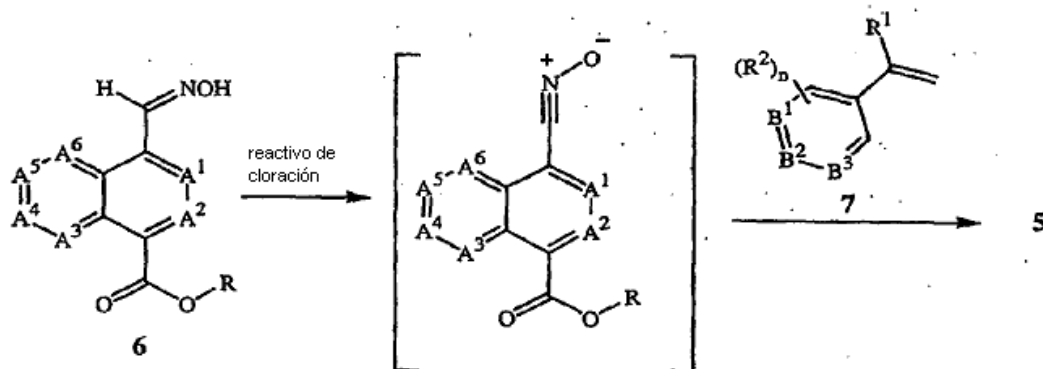
Esquema 4



En este método, el compuesto de éster de la fórmula 5 se convierte en el correspondiente ácido carboxílico de la fórmula 4 por medio de procedimientos generales bien conocidos en la técnica. Por ejemplo, el tratamiento de un éster metílico o etílico de la fórmula 5 con hidróxido de litio acuoso en tetrahidrofurano, seguido de acidificación da como resultado el correspondiente ácido carboxílico de la fórmula 4. El método del esquema 4 se ilustra en la Etapa D del Ejemplo 1.

Los compuestos de la fórmula 5 se pueden preparar por medio de cicloadición 1,3-dipolar de estirenos de la fórmula 7 con óxidos de nitrilo derivados de oximas de la fórmula 6 tal como se indica en el esquema 5.

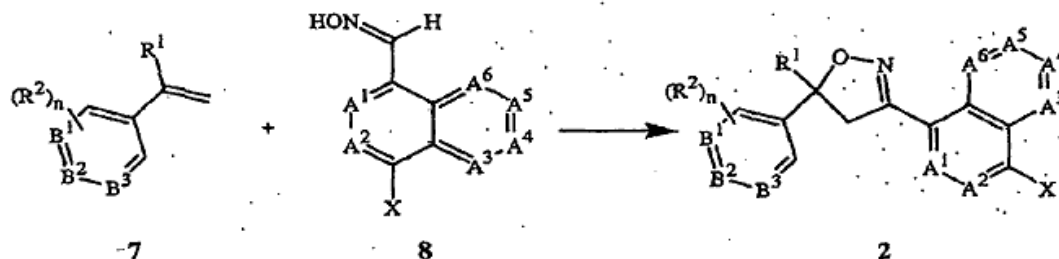
Esquema 5



Esta reacción procede típicamente a través de la intermediación de un cloruro de hidroxamilo generado in situ que se deshidroclora en el óxido de nitrilo que luego se somete a cicloadición 1,3-dipolar con el estireno 7 para obtener los compuestos de la fórmula 5. En un procedimiento típico, se combina un reactivo de cloración tales como hipoclorito de sodio, *N*-clorosuccinimida, o cloramina-T con la oxima en presencia del estireno. Según las condiciones, las bases aminadas tales como piridina o trietilamina pueden ser necesarias para facilitar la reacción de deshidrocloración. La reacción se puede llevar a cabo sin diluir o en una diversidad de disolventes adecuados, que incluyen tetrahidrofurano, éter dietílico, diclorometano y cloroformo con temperaturas óptimas que oscilan desde la temperatura ambiente hasta la temperatura de reflujo del disolvente. Los procedimientos generales para la cicloadición de óxidos de nitrilo con olefinas están bien documentadas en la literatura química; por ejemplo, ver Lee, *Synthesis*, 1982, 6, 508-509; Kanemasa et al., *Tetrahedron*, 2000, 56, 1057-1064; EP 1.538.138-A1, así como las referencias allí citadas. El método del esquema 4 se ilustra en la Etapa C del Ejemplo 1.

Los compuestos de la fórmula 2 se pueden preparar por medio de cicloadición 1,3-dipolar de estirenos de la fórmula 7 con óxidos de nitrilo derivados de oximas de la fórmula 8 tal como se indica en el esquema 6.

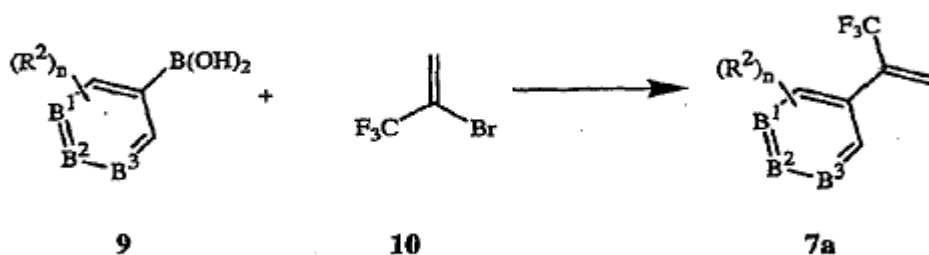
Esquema 6



En el método del esquema 6, los compuestos de la fórmula 2 en donde X es un átomo de halógeno se generan poniendo en contacto el compuesto de la fórmula 8 con un reactivo de cloración seguido de la adición de un compuesto de la fórmula 7. El método del esquema 6 se lleva a cabo análogamente al método del esquema 5 ya descrito. El método del esquema 6 se ilustra en la Etapa B del Ejemplo 2, Etapa D del Ejemplo 4 y Etapa C del Ejemplo 5.

Un grupo de especial utilidad de estireno para la síntesis de compuestos de la fórmula 1 están representados por la fórmula 7a tal como se indica en el esquema 7. Estos intermediarios se pueden preparar por acoplamiento catalizado con paladio de un ácido arilborónico de la fórmula 9 con el 2-bromo-3,3,3-trifluoropropeno asequible en comercios (fórmula 10). Los procedimientos generales para esta reacción están documentados en la literatura química; ver Pan et al., *J. Fluorine Chemistry*, 1999, 95, 167-170. El método del esquema 7 se ilustra en la Etapa B del Ejemplo 1.

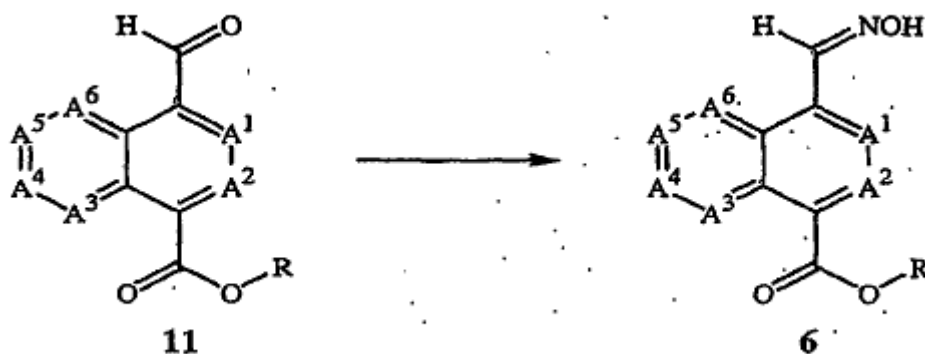
Esquema 7



Las oximas de la fórmula 6 se pueden preparar por reacción de aldehídos 11 con hidroxilamina tal como se indica en el esquema 8. Por ejemplo, ver H. K. Jung et al. Bioorg. Med. Chem. 2004, 12, 3965.

- 5 Los aldehídos de la fórmula 11 se pueden preparar por medio de una variedad de métodos conocidos en la técnica; algunos de los aldehídos son compuestos conocidos o asequibles en comercios. Por ejemplo, la preparación del compuesto de la fórmula 11 en donde A^1 , A^2 , A^3 , A^4 , A^5 y A^6 son CH y R^9 es Me, es revelado por P. Madenson et al. J. Med. Chem. 2002, 45, 5755. El método del esquema 8 se ilustra en la Etapa A del Ejemplo 1.

Esquema 8



- 10 Tal como se muestra en el esquema 9, las oximas de la fórmula 8, en donde X es un átomo de halógeno, se pueden preparar a partir de los correspondientes aldehídos de la fórmula 12 análogo al método del esquema 8. El método del esquema 9 se ilustra en la Etapa A del Ejemplo 2, Etapa C del Ejemplo 4 y Etapa B del Ejemplo 5.

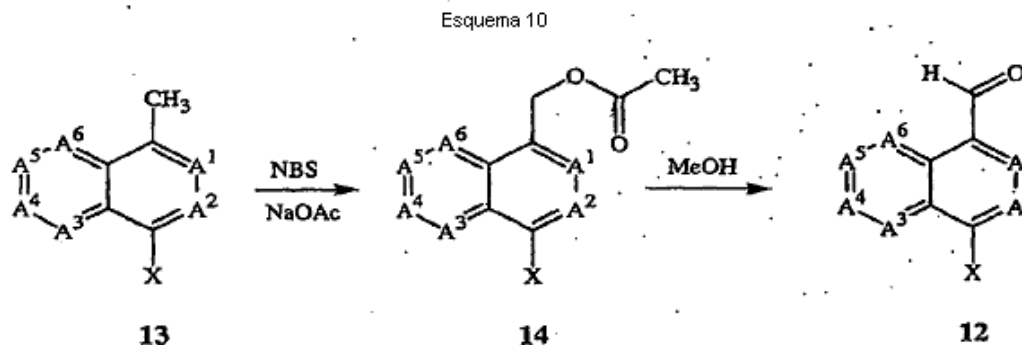
Esquema 9



- 15 Los compuestos de la fórmula 12 son asequibles en comercios o son compuestos conocidos, o se pueden preparar por medio de una variedad de métodos conocidos en la técnica. Por ejemplo, un compuesto de la fórmula 12 se puede preparar por formilación directa de los correspondientes haluros de arilo, ver G. E. Boswell et al. J. Org.

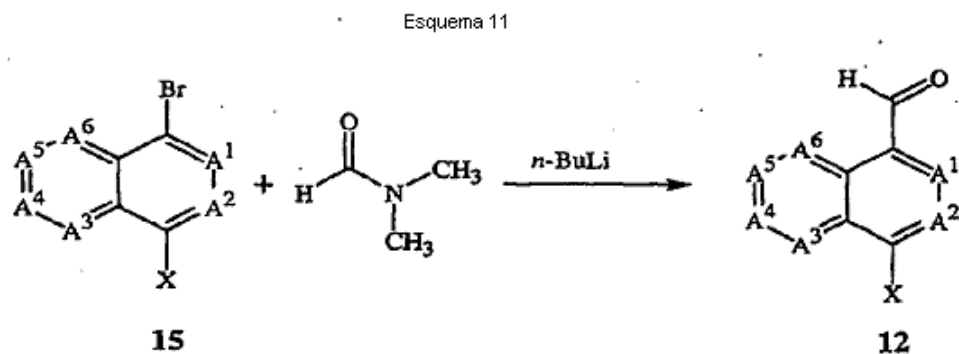
Chem. 1995, 65, 6592; o por reducción de los correspondientes ésteres de arilo, ver las referencias P. R. Bernstein et al. Bioorg. Med. Chem. Lett. 2001, 2769 y L. W. Deady et al. Aust. J. Chem. 1989, 42, 1029.

- 5 Como un ejemplo específico, tal como se indica en el esquema 10, los aldehídos de la fórmula 12 se pueden preparar a partir de los correspondientes compuestos sustituidos con metilo de la fórmula 13 (en donde X es halógeno) por reacción con *N*-bromosuccinimida (NBS) en presencia de 2,2'-azobis(2-metilpropionitrilo) (AIBN) y acetato de sodio para dar acetatos de la fórmula 14, que luego se convierten en los aldehídos de la fórmula 12 por esterificación y oxidación. El método del esquema 10 se ilustra en el Ejemplo 4, Etapas A y B.



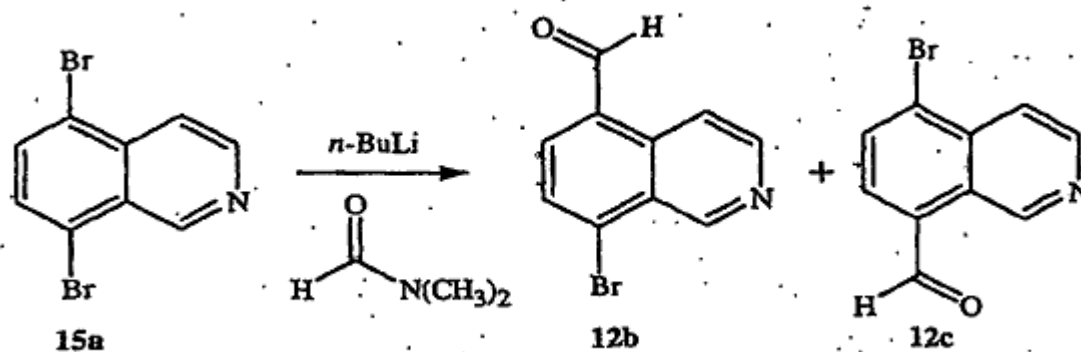
- 10 Los compuestos de la fórmula 13 son asequibles en comercios o son compuestos conocidos o se pueden preparar por medio de una variedad de métodos conocidos en la técnica. Por ejemplo, un compuesto de la fórmula 13, en donde A³ es N, A¹, A², A⁴, A⁵ y A⁶ son CH, se pueden preparar tal como se describe en Molecules, 2004, 9, 178.

- 15 Un método alternativo para preparar aldehídos de la fórmula 12 (en donde X es un átomo de halógeno) se muestra en el esquema 11. El grupo formilo de la fórmula 12 se puede introducir en el sistema de anillos aromáticos de 10 miembros reemplazando el sustituyente de bromo de un compuesto de la fórmula 15. Como referencias de este método general, ver Synthesis, 2006, 293 y Bioorg. Med. Chem. 2004, 12, 715. El método del esquema 11 se ilustra en la Etapa A del Ejemplo 5.



- 20 Tal como se muestra en el esquema 12, los aldehídos de las fórmulas 12b y 12c se pueden preparar a partir de 5,8-dibromoisoquinolina (Fórmula 15a) tratando el compuesto de la fórmula 15a con *n*-BuLi a -78 °C y neutralizándolo con *N,N*-dimetilformamida.

Esquema 12



El compuesto de la fórmula 15a se puede preparar por medio del método descrito en Synthesis, 2002, 83; ; ver, por ejemplo, por el método de G. E. Boswell et al. J. Org. Chem. 1995, 65, 6592. Alternativamente, los arilaldehídos de la fórmula 12 se pueden preparar por medio de una variedad de otros métodos conocidos en la técnica, por ejemplo, por reducción de los correspondientes ésteres de arilo, ver referencias P. R. Bernstein et al. Bioorg. Med. Chem. Lett. 2001, 2769 y L. W. Deady et al. Aust. J. Chem. 1989, 42, 1029.

Se admite que algunos reactivos y condiciones de reacción descritos anteriormente para preparar compuestos de Fórmula 1 pueden no ser compatibles con ciertas funcionalidades presentes en los intermedios. En estos casos, la incorporación de secuencias de protección/desprotección o interconversiones de grupos funcionales en las síntesis ayudará a obtener los productos deseados. El uso y elección de los grupos protectores será evidente para un especialista en la síntesis química (véase, por ejemplo, Greene, T. W.; Wuts, P. G. M. Protective Groups in Organic Synthesis, 2ª ed.; Wiley: New York, 1991). Un experto en la técnica reconocerá que, en algunos casos, después de la introducción de un reactivo dado como se representa en cualquier esquema individual, puede ser necesario realizar etapas sintéticas de rutina adicionales no descritas en detalle para completar la síntesis de los compuestos de la Fórmula 1. Un experto en la técnica reconocerá también que puede ser necesario realizar una combinación de las etapas ilustradas en los esquemas anteriores en un orden distinto al que implica la secuencia particular presentada para preparar los compuestos de la Fórmula 1.

El especialista en la técnica reconocerá también que los compuestos de Fórmula 1 y los intermedios descritos en la presente memoria se pueden someter a diversas reacciones electrófilas, nucleófilas, radicáticas, organometálicas, de oxidación, y de reducción para añadir sustituyentes o modificar los sustituyentes existentes.

Se cree que el especialista en la técnica, usando la descripción anterior, puede utilizar la presente invención sin elaboración adicional en su alcance más completo. Por lo tanto, los siguientes Ejemplos pretenden ser únicamente ilustrativos y no limitantes de la descripción de ningún modo. Los espectros de ^1H RMN se informan en ppm campo abajo de tetrametilsilano; "s" significa singulete, "d" significa doblete, "t" significa triplete, "m" significa multiplete, "dd" significa doblete de dobletes, y "br s" significa singulete amplio.

EJEMPLO 1

Preparación de 4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil] N-(2,2,2-trifluoroetil)-1-naftalencarboxamida

Etapas A: Preparación de 4-[(hidroxiimino)metil]-1-naftalencarboxilato de metilo

A una solución agitada de 4-formil-1-naftalencarboxilato de metilo (2,2 g, 10,3 mmol) en metanol (50 mL) se añadió una solución de hidroxilamina (1,33 mL, 50% en agua). Después de agitar a temperatura ambiente durante 2 h, la mezcla de reacción se concentró a presión reducida para proporcionar el compuesto del título en forma de un sólido amarillo pálido (2,55 g).

^1H RMN (CDCl_3): 8,93 (d, 1H), 8,86 (s, 1H), 8,41 (d, 1H), 8,14 (d, 1H), 7,82 (d, 1H), 7,63 (m, 2H), 4,02 (s, 3H).

Etapas B: Preparación de 1,3-dicloro-5-[1-(trimetilfluorometil)etenil]benceno

A una mezcla de tetrahidrofurano (33 mL), 1,2-dimetoxietano (33 mL), e hidróxido de potasio acuoso 4 N (33 mL) en un tubo sellado de 200 mL de Fisher-Porter se añadió ácido 3,5-diclorofenilborónico (8,72 g, 45,7 mmol) y 2-bromo-3,3,3-trifluoropropeno (10,0 g, 57,2 mmol), seguido de la adición de tetrakis(trifenilfosfina)paladio (0) (264 mg, 0,229 mmol). Luego la mezcla se calentó hasta 75 °C durante 3 h. La mezcla de reacción se dividió entre éter dietílico y agua. El extracto acuoso se lavó con éter dietílico (2 x 20 mL). Los extractos orgánicos se combinaron, se secaron (MgSO_4), y se concentraron a presión reducida. El residuo se purificó por cromatografía en gel de sílice

usando hexanos/acetato de etilo como eluyente para obtener el compuesto del título en forma de un aceite claro (4,421 g).

^1H RMN (CDCl_3): δ 7,41 (s, 2H), 7,33 (s, 1H), 6,04 (d, 1H), 5,82 (d, 1H).

5 Etapa C: Preparación de 4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]-1-naftalencarboxilato de metilo

A una solución agitada de 4-[(hidroxiimino)metil]-1-naftalencarboxilato de metilo (es decir, el producto de la etapa A) (1,0 g, 4,36 mmol) en *N,N*-dimetilformamida (5,0 mL) se añadió *N*-clorosuccinimida (1,16 g, 8,72 mmol). Esta mezcla se agitó durante 1,5 h a temperatura ambiente, y luego se añadió una solución de 1,3-dicloro-5-[1-(trifluorometil)etenil]benceno (es decir, el producto de la etapa B) (3,20 g, 13,1 mmol) y trietilamina (6,1 mL, 43,6 mmol) en *N,N*-dimetilformamida (4,0 mL). Después de agitar durante 2 h más a temperatura ambiente, la mezcla de reacción se diluyó con agua y se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con salmuera, se secó (Na_2SO_4), y se concentró a presión reducida. El residuo se purificó por cromatografía en gel de sílice usando hexanos/acetato de etilo como eluyente para obtener el compuesto del título en forma de un aceite amarillo pálido (700 mg, 34% de rendimiento). ^1H RMN (CDCl_3): 8,88 (d, 1H), 8,80 (d, 1H), 8,10 (d, 1H), 7,68 (m, 2H), 7,55 (m, 3H), 7,46 (dd, 1H), 4,27 (d, 1H), 4,03 (s, 3H), 3,91 (d, 1H).

Etapa D: Preparación de ácido 4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]-1-naftalencarboxílico

A una solución agitada de 4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]-1-naftalencarboxilato de metilo (es decir, el producto de la etapa C) (650 mg, 1,39 mmol) en tetrahidrofurano (10 mL) se añadió una solución de hidróxido de litio monohidratado (350 mg, 8,34 mmol) en agua (10 mL), seguido de metanol (10 mL). La mezcla resultante se agitó durante la noche a temperatura ambiente. La mezcla de reacción se dividió entre agua y éter dietílico. Luego la capa acuosa se acidificó con ácido clorhídrico acuoso 6 N hasta pH 2 y se extrajo con acetato de etilo. Las capas orgánicas combinadas se lavaron con salmuera, se secaron y se concentraron para proporcionar el compuesto del título en forma de un sólido blanco (450 mg). ^1H RMN (CDCl_3): 9,08 (d, 1H), 8,80 (d, 1H), 8,31 (d, 1H), 7,71 (m, 2H), 7,57 (m, 3H), 7,46 (dd, 1H), 4,28 (d, 1H), 3,91 (d, 1H).

25 Etapa E: Preparación de 4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]-*N*-(2,2,2-trifluoroetil)-1-naftalencarboxamida

Una mezcla de ácido 4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]-1-naftalencarboxílico (es decir, el producto de la etapa C) (190 mg, 0,42 mmol), 4-(dimetilamino)piridina (77 mg, 0,63 mmol), anhídrido propilfosfónico (0,38 mL, 0,63 mmol, 50% en acetato de etilo) y 2,2,2-trifluoroetilamina (0,033 mL, 0,42 mL) en diclorometano (5 mL) se agitó a temperatura ambiente durante la noche. La mezcla de reacción se concentró, y el residuo se purificó por cromatografía en columna en gel de sílice usando hexanos/acetato de etilo como eluyente para dar el producto del título, un compuesto de la presente invención, en forma de un sólido blanco (71 mg).

^1H RMN (CDCl_3): 8,78 (d, 1H), 8,18 (d, 1H), 7,63 (m, 2H), 7,56 (m, 2H), 7,52 (d, 1H), 7,46 (m, 1H), 7,44 (d, 1H), 6,41 (t, 1H), 4,23 (d, 1H), 4,20 (m, 2H), 3,87 (d, 1H).

35 EJEMPLO 2

Preparación de 4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]-*N*-(2-piridinilmetil)-1-naftalencarboxamida

Etapa A: Preparación de oxima de 4-bromo-1-naftalencarboxilato

A una solución agitada de 4-bromo-1-naftalencarboxaldehído (3,7 g, 15,7 mmol) en etanol (30 mL) se añadió una solución acuosa de hidroxilamina (1,25 mL, 50% en agua). Después de agitar a temperatura ambiente durante 3 h, la mezcla de reacción se concentró a presión reducida para proporcionar el compuesto del título en forma de un sólido amarillo pálido (3,8 g).

^1H RMN ($\text{DMSO}-d_6$): 11,60 (s, 1H), 8,81 (s, 1H), 8,71 (d, 1H), 8,24 (d, 1H), 7,95 (d, 1H), 7,74 (m, 3H).

Etapa B: Preparación de 3-(4-bromo-1-naftalenil)-5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)isoxazol

45 A una solución agitada de oxima de 4-bromo-1-naftalencarboxilato (es decir, el producto de la etapa A) (2,33 g, 9,3 mmol) en *N,N*-dimetilformamida (6,0 mL) se añadió *N*-clorosuccinimida (1,70 g, 12,7 mmol). La mezcla de reacción se agitó durante 1 h a temperatura ambiente, y se añadió luego una solución de 1,3-dicloro-5-[1-(trifluorometil)etenil]benceno (es decir, el producto de la etapa B del Ejemplo 1) (2,70 g, 11,2 mmol) y trietilamina (4,5 mL, 32,0 mmol) en *N,N*-dimetilformamida (9,0 mL). Después de agitar durante 2 h más a temperatura ambiente, la mezcla de reacción se diluyó con agua y se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con salmuera, se secó (Na_2SO_4), y se concentró a presión reducida. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice usando hexanos/acetato de etilo como eluyente para obtener el compuesto del título en forma de un sólido blanco (2,9 g, 64% de rendimiento).

^1H RMN (CDCl_3): 8,87 (m, 1H), 8,32 (m, 1H), 7,77 (d, 1H), 7,66 (m, 2H), 7,55 (s, 2H), 7,46 (dd, 1H), 7,32 (d, 1H), 4,24 (d, 1H), 3,88 (d, 3H).

Etapla C: Preparación de 4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]-N-(2-piridinilmetil)-1-naftalencarboxamida

- 5 Una mezcla de 3-(4-bromo-1-naftalenil)-5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)isoxazol (es decir, el producto de la etapa B) (1,0 g, 2,04 mmol); [1,1'-bis(difenilfosfino)fenoceno]dicloropalladio (II) ($\text{PdCl}_2(\text{dppf})$) (0,22 g, 0,30 mmol), 2-(aminometil)piridina (0,86 g, 7,96 mmol) y trietilamina (5,6 mL, 40 mmol) en tolueno (15 mL) se purgó con monóxido de carbono durante 15 minutos. Luego el recipiente de reacción se mantuvo con monóxido de carbono usando un balón. La mezcla de reacción se agitó a 70 °C bajo atmósfera de monóxido de carbono durante la noche.
- 10 La mezcla se enfrió hasta temperatura ambiente, se filtró a través de un taco corto de ayuda filtrante de diatomeas Celite® y se enjuagó con una pequeña cantidad de acetato de etilo. El filtrado se concentró, y el residuo se purificó por cromatografía en columna en gel de sílice usando hexanos/acetato de etilo como eluyente para proporcionar el producto del título, un compuesto de la presente invención, en forma de un sólido blanco (0,72 g, 65% de rendimiento).
- 15 ^1H RMN (CDCl_3): 8,81 (d, 1H), 8,55 (d, 1H), 8,38 (d, 1H), 7,80-7,27 (m, 10H), 4,89 (d, 2H), 4,22 (d, 1H), 3,86 (d, 1H).

EJEMPLO 3

Preparación de 4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]-N-(2-piridinilmetil)-1-naftalencarboxamida

- 20 Una mezcla de 4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]-N-(2-piridinilmetil)-1-naftalencarboxamida (es decir, el producto del Ejemplo 2) (40 mg, 0,073 mmol) y 2,5-bis(4-metoxifenil)-1,3-ditiazol-2,4-difosfetan-2,4-disulfuro (reactivo de Lawesson) (18 mg, 0,044 mmol) en tolueno (2 mL) se calentó a reflujo durante 2 h.

- 25 La mezcla de reacción se enfrió hasta temperatura ambiente, y directamente se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice usando hexanos/acetato de etilo como eluyente para proporcionar el producto del título, un compuesto de la presente invención, en forma de un sólido amarillo (29 mg, 71% de rendimiento).

^1H RMN (CDCl_3): 9,41 (br s 1H), 8,91 (dd, 1H), 8,70 (dd, 1H), 8,46 (d, 1H), 8,21 (d, 1H), 7,75 (dt, 1H), 7,64 (d, 1H), 7,57 (s, 2H), 7,47 (dd, 1H), 7,43 (t, 1H), 7,38 (d, 1H), 7,24 (dd, 1H), 5,14 (d, 2H), 4,68 (d, 1H), 4,39 (d, 1H).

EJEMPLO 4

- 30 Preparación de 5-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]-N-(2-piridinilmetil)-8-quinolincarboxamida

Etapla A: Preparación de (8-bromo-5-quinolinil)acetato de metilo

- 35 Una mezcla de 8-bromo-5-metilquinolina (5,4 g, 24,3 mmol), *N*-bromosuccinimida (5,2 g, 29,2 mmol), y 2,2'-azobis(2-metilpropionitrilo) (AIBN) (0,40 g, 24,3 mmol) en tetracloruro de carbono (80 mL) se calentó a reflujo durante 3 h bajo una atmósfera de nitrógeno. La mezcla de reacción se enfrió hasta temperatura ambiente y se filtró, usando hexano para enjuagar. El filtrado se concentró a presión reducida. El residuo se disolvió en *N,N*-dimetilformamida (50 mL), y luego se añadió acetato de sodio (4,0 g, 48,8 mmol). La mezcla resultante se agitó a 100 °C durante 2 h bajo una atmósfera de nitrógeno. La mezcla de reacción se enfrió hasta temperatura ambiente, se diluyó con agua y se extrajo con una mezcla de acetato de etilo y hexano (3:7). La capa orgánica se lavó con salmuera, se secó (Na_2SO_4), y se concentró a presión reducida. El producto crudo se purificó por cromatografía en columna en gel de sílice usando hexanos/acetato de etilo como eluyente para obtener el producto del título en forma de un sólido amarillo pálido (4,8 g).
- 40

Etapla B: Preparación de 8-bromo-5-quinolincarboxaldehído

- 45 Una mezcla de (8-bromo-5-quinolinil)acetato de metilo (es decir, el producto de la etapa A) y metanol (50 mL) se calentó a reflujo durante 1 h. en presencia de cantidad en trazas de carbonato de potasio (10 mg). Luego la mezcla de reacción se enfrió hasta temperatura ambiente y se concentró a presión reducida para proporcionar en correspondiente alcohol en rendimiento cuantitativo en forma de un sólido amarillo pálido.

- 50 A una solución agitada del alcohol crudo (2,0 g, 8,3 mmol) en diclorometano (60 mL) se añadió lentamente 1,1,1-tris(acetoxi)-1,1-dihidro-1,2-benziodoxol-3(1H)-ona (periyodinano de Dess-Martin) (4,0 g, 9,4 mmol) a temperatura ambiente. Después de agitar durante 0,5 h, la mezcla de reacción se diluyó con diclorometano, se lavó con bicarbonato de sodio acuoso saturado y salmuera, se secó (Na_2SO_4), y se concentró a presión reducida. El producto crudo se purificó por cromatografía en columna en gel de sílice usando hexanos/acetato de etilo como eluyente para obtener el producto del título en forma de un sólido blanco (1,8 g).

^1H RMN (CDCl_3): 10,31 (s, 1H), 9,65 (dd, 1H), 9,12 (dd, 1H), 8,26 (d, 1H), 7,88 (d, 1H), 7,66 (dd, 1H).

Etapa C: Preparación de oxima de 8-bromo-5-quinolincarboxaldehído

A una solución agitada de 8-bromo-5-quinolincarboxaldehído (es decir, el producto de la etapa B) (1,7 g, 7,1 mmol) en etanol (30 mL) se añadió una solución acuosa de hidroxilamina (0,7 mL, 50% en agua). Después de agitar a temperatura ambiente durante 2 h, la mezcla de reacción se concentró a presión reducida para proporcionar el compuesto del título en forma de un sólido amarillo pálido (1,8 g).

^1H RMN ($\text{DMSO}-d_6$): 11,61 (s, 1H), 9,16 (dd, 1H), 9,07 (dd, 1H), 8,79 (s, 1H), 8,20 (d, 1H), 7,79 (d, 1H), 7,72 (dd, 1H).

Etapa D: Preparación de 8-bromo-5-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]quinolina

A una solución agitada de oxima de 8-bromo-5-quinolincarboxaldehído (es decir, el producto de la etapa C) (1,7 g, 6,8 mmol) en *N,N*-dimetilformamida (13,0 mL) se añadió *N*-clorosuccinimida (1,24 g, 9,3 mmol). La mezcla de reacción se agitó durante 1 h a temperatura ambiente, y luego se añadió una solución de 1,3-dicloro-5-[1-(trifluorometil)etenil]benceno (es decir, el producto del Ejemplo 1, Etapa B) (1,96 g, 8,1 mmol) y trietilamina (2,86 mL, 20,4 mmol) en *N,N*-dimetilformamida (7,0 mL). Después de agitar durante 12 h más a temperatura ambiente, la mezcla de reacción se diluyó con agua y se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con salmuera, se secó (Na_2SO_4), y se concentró a presión reducida. El residuo se purificó por cromatografía en columna en gel de sílice usando hexanos/acetato de etilo como eluyente para obtener el compuesto del título en forma de un sólido blanco (2,0 g, 61% de rendimiento).

^1H RMN (CDCl_3): 9,39 (dd, 1H), 9,08 (dd, 1H), 8,05 (d, 1H), 7,59 (dd, 1H), 7,55 (s, 2H), 7,44 (t, 1H), 7,40 (d, 1H), 4,27 (d, 1H), 3,92 (d, 1H).

Etapa E: Preparación de 5-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]-*N*-(2-piridinilmetil)-8-quinolincarboxamida

Una mezcla de 8-bromo-5-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]quinolina (es decir, el producto de la etapa D) (500 mg, 1,0 mmol), [1,1'-bis(difenilfosfino)ferroceno]dicloropaladio (II) ($\text{PdCl}_2(\text{dppf})$) (75 mg, 0,10 mmol), 2-(aminometil)piridina (0,43 mL, 4,0 mmol) y trietilamina (2,8 mL, 20 mmol) en tolueno (10 mL) se purgó con monóxido de carbono durante 15 minutos. Luego el recipiente de reacción se mantuvo con monóxido de carbono usando un balón. La mezcla de reacción se agitó a 70 °C bajo atmósfera de monóxido de carbono durante la noche. La mezcla se enfrió hasta temperatura ambiente, se filtró a través de un taco corto de ayuda filtrante de diatomeas Celite® y se enjuagó con una pequeña cantidad de acetato de etilo. El filtrado se concentró, y el residuo se purificó por cromatografía en columna en gel de sílice usando hexanos/acetato de etilo como eluyente para proporcionar el producto del título, un compuesto de la presente invención, en forma de un sólido espumoso marrón (60 mg, 11% de rendimiento).

^1H RMN (CDCl_3): 12,02 (br s 1H), 9,52 (d, 1H), 9,01 (s, 1H), 8,88 (d, 1H), 8,62 (d, 1H), 7,60-7,74 (m, 3H), 7,56 (s, 2H), 7,45 (br s 2H), 7,20 (dd, 1H), 4,96 (d, 2H), 4,32 (d, 1H), 3,98 (d, 1H).

EJEMPLO 5

Preparación de 5-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]-*N*-(2-piridinilmetil)-8-isoquinolincarboxamida

Etapa A: Preparación de 8-bromo-5-isoquinolincarboxaldehído y 5-bromo-8-isoquinolincarboxaldehído

A una mezcla agitada de 5,8-dibromoisoquinolina (4,0 g, 13,9 mmol) en tetrahidrofurano (120 mL) a -78 °C bajo una atmósfera de nitrógeno se añadió gota a gota una solución de *n*-butil-litio (2,3 M en hexano, 7,3 mL, 16,8 mmol). La mezcla de reacción se volvió oscura. Después de agitar durante 15 minutos, la mezcla de reacción se neutralizó por adición de *N,N*-dimetilformamida (4,0 mL). Después de agitar a -78 °C durante una hora más, la mezcla de reacción se neutralizó con agua, se extrajo con mezcla de acetato de etilo/hexano (2:8), se lavó con agua y salmuera, se secó (Na_2SO_4), y se concentró a presión reducida. El residuo se purificó por cromatografía en columna en gel de sílice usando hexanos/acetato de etilo como eluyente para obtener el 8-bromo-5-isoquinolincarboxaldehído (0,10 g), seguido de 5-bromo-8-isoquinolincarboxaldehído (1,0 g) en forma de sólidos blancos.

^1H RMN (CDCl_3) de 8-bromo-5-isoquinolincarboxaldehído: 10,36 (s, 1H), 9,72 (s, 1H), 9,00 (d, 1H), 8,79 (d, 1H), 8,04 (d, 1H), 8,01 (dd, 1H); y

^1H RMN (CDCl_3) de 5-bromo-8-isoquinolincarboxaldehído: 10,57 (s, 1H), 10,41 (s, 1H), 8,81 (d, 1H), 8,18 (d, 1H), 8,11 (d, 1H), 7,94 (d, 1H).

Etapa B: Preparación de oxima de 8-bromo-5-isoquinolincarboxaldehído

A una solución agitada de 8-bromo-5-isoquinolincarboxaldehído (es decir, un producto de la Etapa A) (75 mg, 0,3 mmol) en etanol (7 mL) se añadió una solución acuosa de hidroxilamina (0,5 mL, 50% en agua). Después de agitar a temperatura ambiente durante la noche, la mezcla de reacción se concentró a presión reducida para proporcionar el compuesto del título en forma de un sólido amarillo (70 mg).

^1H RMN ($\text{DMSO}-d_6$): 11,75 (s, 1H), 9,55 (s, 1H), 8,78 (s, 1H), 8,71 (d, 1H), 8,59 (d, 1H), 8,07 (d, 1H), 7,96 (d, 1H).

Etapla C: Preparación de 8-bromo-5-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]isoquinolina

A una solución agitada de oxima de 8-bromo-5-isoquinolincarboxaldehído (es decir, el producto de la etapa B) (70 mg, 0,28 mmol) en *N,N*-dimetilformamida (2,0 mL) se añadió *N*-clorosuccinimida (64 g, 0,48 mmol). La mezcla de reacción se agitó durante 0,5 h a temperatura ambiente, y luego se añadió una solución de 1,3-dicloro-5-[1-(trifluorometil)etenil]benceno (135 mg, 0,56 mmol) (es decir, el producto del Ejemplo 1, Etapa B) y trietilamina (0,12 mL, 0,86 mmol) en *N,N*-dimetilformamida (1,5 mL). Después de agitar durante 12 h más a temperatura ambiente, la mezcla de reacción se diluyó con agua y se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con salmuera, se secó (Na_2SO_4), y se concentró a presión reducida. El residuo se purificó por cromatografía en columna de gel de sílice usando hexanos/acetato de etilo como eluyente para obtener el compuesto del título (20 mg) contaminado con alguna impureza.

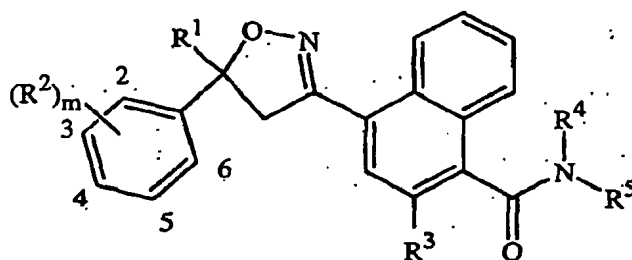
Etapla D: Preparación de 5-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]-*N*-(2-piridinilmetil)-8-isoquinolincarboxamida

Una mezcla de 8-bromo-5-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]isoquinolina (es decir, el producto de la etapa C) (20 mg, 0,04 mmol), [1,1'-bis(difenilfosfino)ferroceno]dicloropaladio (II) ($\text{PdCl}_2(\text{dppf})$) (6 mg, 0,008 mmol), 2-(aminometil)piridina (17 mg, 0,16 mmol) y trietilamina (0,1 mL, 0,7 mmol) en tolueno (2 mL) se purgó con monóxido de carbono durante 15 minutos. Luego el recipiente de reacción se mantuvo con monóxido de carbono usando un balón. La mezcla de reacción se agitó a 70 °C bajo atmósfera de monóxido de carbono durante la noche. La mezcla se enfrió hasta temperatura ambiente, se filtró a través de un taco corto de filtro de diatomeas Celite® y se enjuagó con una pequeña cantidad de acetato de etilo. El filtrado se concentró y el residuo se purificó por cromatografía en columna en gel de sílice usando hexanos/acetato de etilo como eluyente para proporcionar el producto del título, un compuesto de la presente invención, en forma de un sólido blanco pálido (15 mg).

^1H RMN (CDCl_3): 9,77 (s, 1H), 8,80 (d, 1H), 8,70 (d, 1H), 8,52 (s, 1H), 7,81-7,23 (m, 9H), 4,88 (d, 2H), 4,28 (d, 1H), 3,92 (d, 1H).

Mediante los procedimientos descritos en la presente memoria, junto con métodos conocidos en la técnica, se pueden preparar los compuestos siguientes de las Tablas 1 a 9. En las Tablas que se muestran a continuación se usan las siguientes abreviaturas: -CN significa ciano, Ph significa fenilo, Py significa piridinilo, Me significa metilo, Et significa etilo y *i*-Pr significa isopropilo.

Tabla 1



en donde m es 1, 2, 3, 4 ó 5.

R^1	$(\text{R}^2)_m$	R^3	R^4	R^5	R^1	$(\text{R}^2)_m$	R^3	R^4	R^5
CF_3	H	H	H	CH_2CF_3	CF_3	H	Me	H	CH_2CF_3
CF_3	2-Cl	H	H	CH_2CF_3	CF_3	2-Cl	Me	H	CH_2CF_3
CF_3	3-Cl	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl	Me	H	CH_2CF_3
CF_3	4-Cl	H	H	CH_2CF_3	CF_3	4-Cl	Me	H	CH_2CF_3
CF_3	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH_2CF_3	CF_3	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2CF_3
CF_3	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH_2CF_3	CF_3	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH_2CF_3

R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵	R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵
CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	2-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-F	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	2-F, 4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-F, 4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-F, 4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F, 4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-F, 5-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F, 5-F	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	4-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃ H		H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl, 4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃ CF ₃		3-Cl, 4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Br, 5-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br, 5-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Br, 4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br, 4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-I	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-I	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	4-I	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-I	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-CN	H	H	CH ₂ CF ₃ CF ₃		3-CN	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	4-CN	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-CN	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Me	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Me	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	4-Me	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Me	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-OMe	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-OMe	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	4-OMe	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-OMe	Me	H	CH ₂ CF ₃

R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵	R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵
CF ₃	3-OCF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-OCF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	4-OCF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-OCF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃	H	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	H	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-Cl	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Cl	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-Cl, 4-Cl	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-F	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-F	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-F, 4-F	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-F, 4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F, 4-F	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F, 4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F, 5-F	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F, 5-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CF ₃	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-CF ₃	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H		H CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Br	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br, 5-Br	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br, 5-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br, 4-Br	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br, 4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Br	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-I	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-I	H	H	CH ₂ -2-Py

R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵	R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵
CF ₃	4-I	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-I	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CN	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CN	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-CN	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-CN	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Me	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Me	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Me	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Me	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OMe	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-OMe	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-OMe	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-OMe	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OCF ₃	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-OCF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-OCF ₃	Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-OCF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	H	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	H	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	2-Cl	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-Cl	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	4-Cl	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	2-Cl, 4-Cl		Cl H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-Cl, 4-Cl	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-F	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	2-F	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-F	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	4-F	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-F, 4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	2-F, 4-F	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F, 4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-F, 4-F	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F, 5-F	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-F, 5-F	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-CF ₃	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	4-CF ₃	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	Cl	H	CH ₂ -2-Py

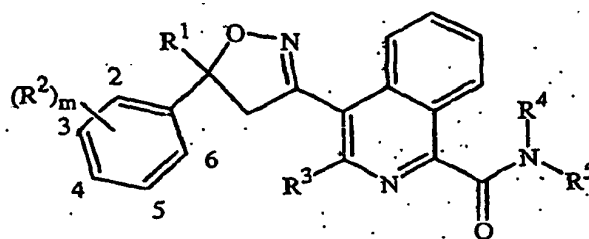
R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵	R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵
CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-Cl, 4-Br	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br, 5-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-Br, 5-Br	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br, 4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-Br, 4-Br	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-Br	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	4-Br	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-I	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-I	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-I	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	4-I	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CN	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-CN	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-CN	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	4-CN	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Me	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-Me	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Me	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	4-Me	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OMe	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-OMe	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-OMe	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	4-OMe	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OCF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-OCF ₃	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-OCF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	4-OCF ₃	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	H	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	H	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	2-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	2-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	3-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	2-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	2-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	3-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py

R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵	R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵
CF ₂ CF ₃	2-F, 4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	2-F, 4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-F, 4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	3-F, 4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-F, 5-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	3-F, 5-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	3-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	4-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	4-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-Cl, 4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-Br, 5-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	3-Br, 5-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-Br, 4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	3-Br, 4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	3-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-I	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	3-I	Me H		CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	4-I	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	4-I	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-CN	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	3-CN	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	4-CN	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	4-CN	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-Me	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	3-Me	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	4-Me	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	4-Me	Me	H	-CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-OMe	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	3-OMe	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	4-OMe	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	4-OMe	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-OCF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	3-OCF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	4-OCF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	4-OCF ₃	He	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	H	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	H	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py

R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵	R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵
CF(CF ₃) ₂	4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-Cl	Me	He	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-F, 4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-F, 4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-F, 4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-F, 4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-F, 5-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-F, 5-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Br, 5-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Br, 5-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Br, 4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Br, 4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-I	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-I	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-I	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-I	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-CN	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-CN	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-CN	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-CN	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Me	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Me	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-Me	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-Me	Me	H	CH ₂ -2-Py

R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵	R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵
CF(CF ₃) ₂	3-OMe	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-OMe	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-OMe	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-OMe	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-OCF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-OCF ₃	Me	H	-CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-OCF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-OCF ₃	Me H	H	CH ₂ -2-Py

Tabla 2



en donde m es 1, 2, 3, 4 ó 5.

R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵	R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵
CF ₃	H	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	H	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-F, 4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-F, 4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F, 4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F, 4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F, 5-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F, 5-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py

R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵	R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵
CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br, 5-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br, 5-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br, 4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br, 4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-I	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-I	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-I	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-I	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CN	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CN	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-CN	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-CN	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Me	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Me	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Me	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Me	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OMe	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-OMe	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-OMe	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-OMe	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OCF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-OCF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-OCF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-OCF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	H	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	H	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py

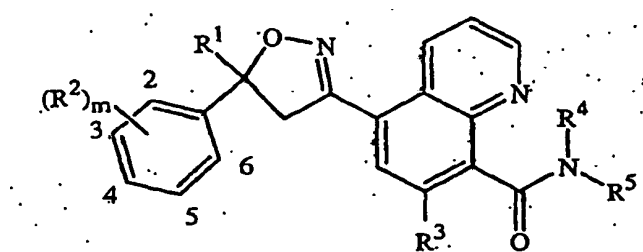
R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵	R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵
CF(CF ₃) ₂	2-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-F, 4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-F, 4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-F, 4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-F, 4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-F, 5-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-F, 5-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Br, 5-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Br, 5-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Br, 4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Br, 4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-I	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-I	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-I	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-I	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-CN	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-CN	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-CN	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-CN	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Me	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Me	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-Me	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-Me	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-OMe	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-OMe	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-OMe	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-OMe	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-OCF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-OCF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py

R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵	R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵
CF(CF ₃) ₂	4-OCF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-OCF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	H	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	H	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-F, 4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-F, 4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F, 4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F, 4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F, 5-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F, 5-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CP ₃		Me H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br, 5-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br, 5-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br, 4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br, 4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py

R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵	R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵
CF ₃	3-I	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-I	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-I	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-I	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CN	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CN	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-CN	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-CN	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Me	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Me	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OMe	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-OMe	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-OMe	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-OMe	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OCF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-OCF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-OCF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-OCF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	H	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	H	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	Me H		CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-Cl	Me H		CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-Cl	Me	H-	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-F, 4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-F, 4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-F, 4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-F, 4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-F, 5-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-F, 5-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py

R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵	R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Br, 5-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Br, 5-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Br, 4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Br, 4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-I	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-I	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-I	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-I	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-CN	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-CN	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-CN	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-CN	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Me	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-Me	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-OMe	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-OMe	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-OMe	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-OMe	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-OCF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-OCF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-OCF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-OCF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py

Tabla 3



en donde m es 1, 2, 3, 4 ó 5.

R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵	R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵
CF ₃	H	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	H	H	H	CH ₂ -2-Py

R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵	R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵
CF ₃	2-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-F	H	H	CH ₂ CF ₃		CF ₃ 4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-F, 4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-F, 4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F, 4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F, 4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F, 5-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F, 5-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br, 5-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br, 5-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br, 4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br, 4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-I	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-I	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-I	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-I	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CN	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CN	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-CN	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-CN	H	H	CH ₂ -2-Py

R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵	R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵
CF ₃	3-Me	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Me	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Me	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Me	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OMe	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-OMe	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-OMe	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-OMe	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OCF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-OCF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-OCF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-OCF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	H	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	H	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-F, 4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-F, 4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-F, 4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-F, 4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-F, 5-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-F, 5-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3 Br, 5-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Br, 5-Br	H	H	CH ₂ -2-Py

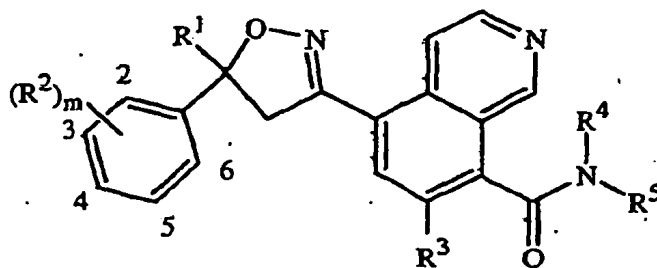
R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵	R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵
CF(CF ₃) ₂	3-Br, 4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Br, 4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-I	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-I	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-I	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-I	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-CN	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-CN	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-CN	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-CN	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Me	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Me	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-Me	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-Me	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-OMe	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-OMe	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-OMe	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-OMe	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-OCF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-OCF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-OCF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-OCF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	H	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	H	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CH ₃	4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	-CF ₃	3-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-F, 4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-F, 4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F, 4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F, 4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F, 5-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F, 5-F	Me	H	CH ₂ -2-Py

R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵	R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵
CF ₃	3-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br, 5-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br, 5-Br	Me H		CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br, 4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br, 4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-I	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-I	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-I	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-I	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CN	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CN	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-CN	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-CN	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Me	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Me	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OMe	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-OMe	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-OMe	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-OMe	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OCF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-OCF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-OCF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-OCF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	H	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	H	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-Cl, 4-Cl		Me, H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	Me H		CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py

R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵	R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-F, 4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-F, 4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-F, 4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-F, 4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-F, 5-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-F, 5-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Br, 5-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Br, 5-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Br, 4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Br, 4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-I	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-I	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-I	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-I	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-CN	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-CN	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-CN	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-CN	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Me	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-Me	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-OMe	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-OMe	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-OMe	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-OMe	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-OCF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-OCF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py

R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵	R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵
CF(CF ₃) ₂	4-OCF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-OCF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py

Tabla 4



en donde m es 1, 2, 3, 4 ó 5.

5

R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵	R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵
CF ₃	H	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	H	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CH ₃	4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-F, 4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-F, 4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F, 4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F, 4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F, 5-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F, 5-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CF ₃	H	H	-CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py

R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵	R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵
CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br, 5-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br, 5-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br, 4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br, 4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-I	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-I	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-I	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-I	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CN	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CN	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-CN	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-CN	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Me	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Me	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Me	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Me	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OMe	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-OMe	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-OMe	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-OMe	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OCF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-OCF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-OCF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-OCF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	H	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	H	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-F	H	H	CH ₂ -2-Py

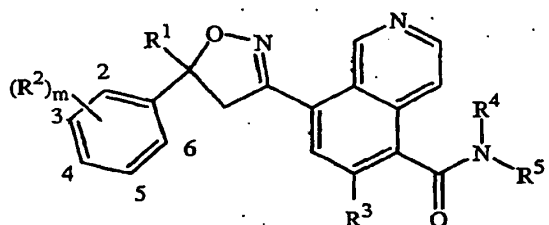
R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵	R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵
CF(CF ₃) ₂	4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-F, 4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-F, 4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-F, 4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-F, 4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-F, 5-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-F, 5-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Br, 5-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Br, 5-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Br, 4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Br, 4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-I	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-I	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-I	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-I	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-CN	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-CN	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-CN	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-CN	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Me	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Me	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-Me	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-Me	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-OMe	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-OMe	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-OMe	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-OMe	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-OCF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-OCF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-OCF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-OCF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	H	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	H	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py

R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵	R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵
CF ₃	3-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CH ₃	3-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-F, 4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-F, 4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F, 4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F, 4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F, 5-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F, 5-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H	-CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br, 5-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br, 5-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br, 4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br, 4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-I	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-I	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-I	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-I	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CN	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CN	Me		H CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-CN	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-CN	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Me	Me	H	CH ₂ -2-Py

R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵	R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵
CF ₃	4-Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Me Me		H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OMe	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-OMe	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-OMe	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-OMe	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OCF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-OCF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-OCF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-OCF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	H	Me H		CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	H	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-F, 4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-F, 4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-F, 4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-F, 4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-F, 5-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-F, 5-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Br, 5-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Br, 5-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Br, 4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Br, 4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py

R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵	R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵
CF(CF ₃) ₂	3-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-I	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-I	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-I	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-I	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-CN	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-CN	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-CN	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-CN	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Me	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-Me	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-OMe	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-OMe	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-OMe	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-OMe	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-OCF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-OCF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-OCF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-OCF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py

Tabla 5



en donde m es 1, 2, 3, 4 ó 5.

R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵	R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵
CF ₃	H	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	H	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CH ₃	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py

R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵	R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵
CF ₃	2-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CH ₃	4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-F, 4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-F, 4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F, 4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F, 4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F, 5-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F, 5-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br, 5-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br, 5-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br, 4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br, 4-Br H		H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-I	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-I	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-I	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-I	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CN	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CN	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-CN	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-CN	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Me	H	H	CH ₂ CF ₃	CH ₃	3-Me	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Me	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Me	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OMe	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-OMe	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-OMe	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-OMe	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OCF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-OCF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-OCF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-OCF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py

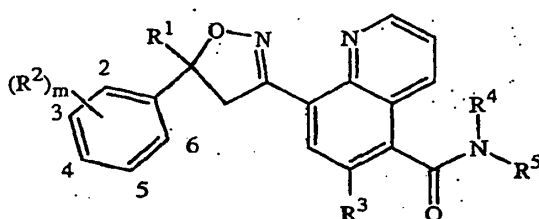
R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵	R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵
CF(CF ₃) ₂	H	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	H	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-F, 4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-F, 4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-F, 4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-F, 4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-F, 5-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-F, 5-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Br, 5-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Br, 5-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Br, 4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CCF ₃) ₂	3-Br, 4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-I	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-I	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-I	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-I	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-CN	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-CN	H	H	CH ₂ -2-Py

R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵	R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵
CF(CF ₃) ₂	4-CN	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-CN	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Me	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Me	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-Me	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-Me	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-OMe	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-OMe	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-OMe	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-OMe	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-OCF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-OCF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-OCF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-OCF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	H	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	H	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF	3-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-F, 4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-F, 4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F, 4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F, 4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F, 5-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F, 5-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py

R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵	R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵
CF ₃	3-Br, 5-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br, 5-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br, 4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br, 4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-I	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-I	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-I	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-I	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CN	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CN	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-CN	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-CN	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Me	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Me	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OMe	Me H		CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-OMe	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-OMe	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-OMe	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OCF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-OCF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-OCF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	H	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	H	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-F, 4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-F, 4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-F, 4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-F, 4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py

R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵	R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵
CF(CF ₃) ₂	3-F, 5-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-F, 5-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Br, 5-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Br, 5-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Br, 4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Br, 4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-I	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-I	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-I	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-I	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-CN	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-CN	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-CN	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-CN	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Me	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-Me	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-OMe	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-OMe	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-OMe	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-OMe	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-OCF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-OCF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-OCF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-OCF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py

Tabla 6



en donde m es 1, 2, 3, 4 ó 5.

R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵	R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵
CF ₃	H	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	H	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-F, 4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-F, 4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F, 4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F, 4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F, 5-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F, 5-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br, 5-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br, 5-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br, 4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br, 4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-I	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-I	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-I	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-I	H	H	CH ₂ -2-Py

R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵	R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵
CF ₃	3-CN	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CN	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-CN	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-CN	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Me	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Me	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Me	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Me	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OMe	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-OMe	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-OMe	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-OMe	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OCF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-OCF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-OCF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-OCF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	H	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	H	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-Cl	H	H	-CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-F, 4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-F, 4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-F, 4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-F, 4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-F, 5-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-F, 5-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py

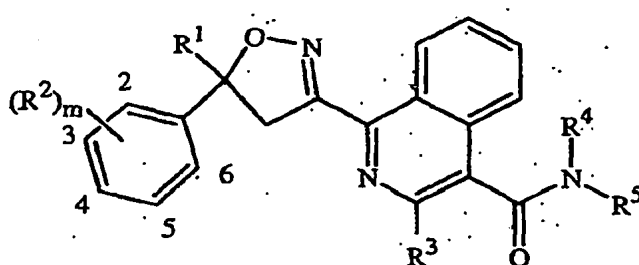
R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵	R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂ 3-Cl,	4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Br, 5-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Br, 5-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Br, 4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Br, 4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-I	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-I	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-I	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-I	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-CN	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-CN	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-CN	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-CN	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Me	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Me	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-Me	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-Me	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-OMe	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-OMe	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-OMe	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-OMe	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-OCF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-OCF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-OCF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-OCF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	H	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	H	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-F, 4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-F, 4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py

R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵	R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵
CF ₃	3-F, 4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F, 4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F, 5-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F, 5-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br, 3-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br, 5-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br, 4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br, 4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-I	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-I	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-I	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-I	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CN	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CN	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-CN	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-CN	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Me	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Me	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OMe	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-OMe	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-OMe	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-OMe	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OCF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-OCF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-OCF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	H	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	H	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py

R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵	R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵
CF(CF ₃) ₂	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-F, 4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-F, 4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-F, 4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-F, 4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-F, 5-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-F, 5-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl 4-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Br, 5-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Br, 5-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Br, 4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Br, 4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-I	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-I	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-I	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-I	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-CN	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-CN	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-CN	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-CN	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Me	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-Me	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-OMe	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-OMe	Me	H	CH ₂ -2-Py

R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵	R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵
CF(CF ₃) ₂	4-OMe	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-OMe	Me	H	-CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-OCF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-OCF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-OCF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-OCF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py

Tabla 7



en donde m es 1, 2, 3, 4 ó 5.

R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵	R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵
CF ₃	H	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	H	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-F, 4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-F, 4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F, 4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F, 4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F, 5-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F, 5-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py

R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵	R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵
CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br, 5-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br, 5-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br, 4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br, 4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-I	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-I	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-I	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-I	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CN	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CN	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-CN	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-CN	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Me	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Me	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Me	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Me	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OMe	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-OMe	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-OMe	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-OMe	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OCF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-OCF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-OCF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-OCF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	H	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	H	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-F	H	H	CH ₂ -2-Py

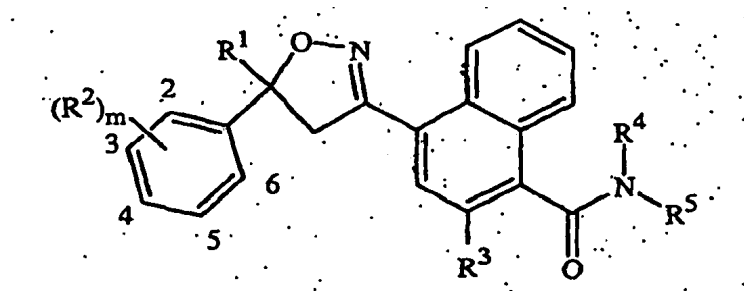
R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵	R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵
CF(CF ₃) ₂	3-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-F, 4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-F, 4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-F, 4-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-F, 4-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-F, 5-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-F, 5-F	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CP(CF ₃) ₂	4-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-CF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Br, 5-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Br, 5-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Br, 4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Br, 4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-Br	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-I	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-I	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-I	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-I	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-CN	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-CN	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-CN	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-CN	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Me	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Me	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-Me	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-Me	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-OMe	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-OMe	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-OMe	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-OMe	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-OCF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-OCF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-OCF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-OCF ₃	H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	H	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	H	Me	H	CH ₂ -2-Py

R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵	R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵
CF ₃	2-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	2-F, 4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-F, 4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F, 4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F, 4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-F, 5-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F, 5-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	F ₃	4-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CF ₃ 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br, 5-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br, 5-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br, 4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br, 4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-I	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-I	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-I	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-I	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-CN	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CN	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-CN	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-CN	Me	H	CH ₂ -2-Py

R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵	R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵
CF ₃	3-Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Me	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-Me	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OMe	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-OMe	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-OMe	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-OMe	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OCF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-OCF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	4-OCF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃	4-OCF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	H	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	H	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	2-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	2-F, 4-F	Me	H	CH ₂ CP ₃	CF(CF ₃) ₂	2-F, 4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-F, 4-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-F, 4-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-F, 5-F	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-F 5-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-CF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Br, 5-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Br, 5-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py

R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵	R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵
CF(CF ₃) ₂	3-Br, 4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Br, 4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Br		Me H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-Br	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-I	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-I	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-I	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-I	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-CN	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-CN	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-CN	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-CN	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Me	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-Me	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-Me	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-OMe	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-OMe	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-OMe	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-OMe	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-OCF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-OCF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	4-OCF ₃	Me	H	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	4-OCF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py

Tabla 8:



en donde m es 1, 2, 3, 4 ó 5.

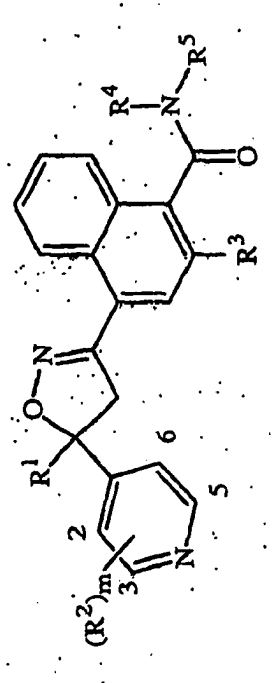
R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵	R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	H	H	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	H
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	H	Me	CF ₃	3-Cl 5-Cl	H	H	Me
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	H	Et	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	Et
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	<i>i</i> -Pr
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ Ph	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ Ph

R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵	R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ CO ₂ Me	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ CO ₂ Me
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ CN	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ CN
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -2-tiazolilo	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -2-tiazolilo
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -4-tiazolilo	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -4-tiazolilo
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -5-tiazolilo	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -5-tiazolilo
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -3-Py	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -3-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -4-Py	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -4-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	Me	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	Me	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	CO ₂ Me	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	CO ₂ Me	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	C(O)Me	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	C(O)Me	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	Me	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	Me	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	CO ₂ Me	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	CO ₂ Me	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	H	C(O)Me	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	C(O)Me	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	H	H	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	H
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	H	Me	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	Me
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	H	Et	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	Et
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	H	<i>i</i> -Pr	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	<i>i</i> -Pr
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ Ph	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ Ph
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ CO ₂ Me	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ CO ₂ Me
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ CN	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ CN
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -2-tiazolilo	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -2-tiazolilo
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -4-tiazolilo	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -4-tiazolilo
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -5-tiazolilo	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -5-tiazolilo
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -3-Py	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -3-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	H	CH ₂ -4-Py	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -4-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	Me	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	Me	CH ₂ CF ₃

R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵	R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	CO ₂ Me	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	CO ₂ Me	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	C(O)Me	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	C(O)Me	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	Me	CH ₂ -2-Py	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	Me	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	CO ₂ Me	CH ₂ -2-Py	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	CO ₂ Me	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	H	C(O)Me	CH ₂ -2-Py	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	C(O)Me	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	Me	H	H	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	H
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	Me	H	Me	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	Me
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	Me	H	Et	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	Et
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	<i>i</i> -Pr
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ Ph	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ Ph
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ CO ₂ Me	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ CO ₂ Me
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ CN	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ CN
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-tiazolilo	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ -2-tiazolilo
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -4-tiazolilo	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ -4-tiazolilo
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -5-tiazolilo	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ -5-tiazolilo
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -3-Py	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ -3-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -4-Py	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ -4-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	Me	Me	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	Me	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	Me	CO ₂ Me	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	CO ₂ Me	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	Me	C(O)Me	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	Me C(O)	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	Me	Me	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	Me	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	Me	CO ₂ Me	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	CO ₂ Me	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl, 4-Cl	Me	C(O)Me	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	C(O)Me	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	Me	H	H	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	H
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	Me
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	Me	H	Et	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	Et

R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵	R ¹	(R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	Me	H	<i>i</i> -Pr	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	<i>i</i> -Pr
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ Ph	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ Ph
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ CO ₂ Me	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ CO ₂ Me
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ CN	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ CN
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -2-tiazolilo	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ -2-tiazolilo
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -4-tiazolilo	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ -4-tiazolilo
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -5-tiazolilo	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ -5-tiazolilo
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -3-Py	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ -3-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	Me	H	CH ₂ -4-Py	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ -4-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	Me	Me	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	Me	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	Me	CO ₂ Me	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	CO ₂ Me	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	Me	C(O)Me	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	C(O) ₂ Me	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	Me	Me	CH ₂ -2-Py	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	CO ₂ Me	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	Me	CO ₂ Me	CH ₂ -2-Py	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	CO ₂ Me	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 4-Cl	Me	C(O)Me	CH ₂ -2-Py	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	Me	C(O)Me	CH ₂ -2-Py

Tabla 9



en donde m es 1, 2, 3 ó 4.

R ¹	R	(R ²) _m	R	4	5	1	R	(R ²) _m	R	3	4	5
CF ₃		3-Cl		H	H	CF ₃		3-Cl, 5-Cl		H	H	H
CF ₃		3-Cl		H	Me	CF ₃		3-Cl, 5-Cl		H	H	Me
CF ₃		3-Cl		H	Et	CF ₃		3-Cl, 5-Cl		H	H	Et
CF ₃		3-Cl		H	<i>i</i> -Pr	CF ₃		3-Cl, 5-Cl		H	H	<i>i</i> -Pr
CF ₃		3-Cl		H	CH ₂ Ph	CF ₃		3-Cl, 5-Cl		H	H	CH ₂ Ph
CF ₃		3-Cl		H	CH ₂ CO ₂ Me	CF ₃		3-Cl, 5-Cl		H	H	CH ₂ CO ₂ Me
CF ₃		3-Cl		H	CH ₂ CN	CF ₃		3-Cl, 5-Cl		H	H	CH ₂ CN
CF ₃		3-Cl		H	CH ₂ -2-tiazolilo	CF ₃		3-Cl, 5-Cl		H	H	CH ₂ -2-tiazolilo

R ¹	R (R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵	1	R (R ²) _m	R ³	4	5
CF ₃	3-Cl	H	H	CH ₂ -4-tiazolilo	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -tiazolilo
CF ₃	3-Cl	H	H	CH ₂ -5-tiazolilo	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -5-tiazolilo
CF ₃	3-Cl	H	H	CH ₂ -3-Py	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -3-Py
CF ₃	3-Cl	H	H	CH ₂ -4-Py	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -4-Py
CF ₃	3-Cl	H	Me	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	Me	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl	H	CO ₂ Me	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	CO ₂ Me	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl	H	C(O)Me	CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	C(O)Me	CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl	H	Me	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	Me	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl	H	CO ₂ Me	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	CO ₂ Me	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl	H	C(O)Me	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	C(O)Me	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	H	H	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	H
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	H	Me	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	Me
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	H	Et	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	Et
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	H	<i>i</i> -Pr	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	<i>i</i> -Pr
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	H	CH ₂ Ph	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ Ph
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	H	CH ₂ CO ₂ Me	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ CO ₂ Me

R ¹	R (R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵	1	R (R ²) _m	R ³	4	5
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	H	CH ₂ CN	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ CN
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	H	CH ₂ -2-tiazolilo	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -2-tiazolilo
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	H	CH ₂ -4-tiazolilo	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -4-tiazolilo
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	H	CH ₂ -5-tiazolilo	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -5-tiazolilo
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	H	CH ₂ -3-Py	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -3-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	H	CH ₂ -4-Py	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ -4-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	Me	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl H		Me	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	CO ₂ Me	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	CO ₂ Me	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	C(O)Me	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	C(O)Me	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	Me	CH ₂ -2-Py	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	Me	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	CO ₂ Me	CH ₂ -2-Py	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	CO ₂ Me	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂	3-Cl	H	C(O)Me	CH ₂ -2-Py	CF(CF ₃) ₂	3-Cl, 5-Cl	H	C(O)Me	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-Cl	Me	H	H	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	H
CF ₃	3-Cl	Me	H	Me	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	Me
CF ₃	3-Cl	Me	H	Et	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	Et
CF ₃	3-Cl	Me	H	<i>i</i> -Pr	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	<i>i</i> -Pr

R ¹	R	(R ²) _m	R	⁴	⁵	¹	R	(R ²) _m	R	³	⁴	⁵
CF ₃		3-Cl	Me	H	CH ₂ Ph	CF ₃		3-Cl, 5-Cl	Me		H	CH ₂ Ph
CF ₃		3-Cl	Me	H	CH ₂ CO ₂ Me	CF ₃		3-Cl, 5-Cl	Me		H	CH ₂ CO ₂ Me
CF ₃		3-Cl	Me	H	CH ₂ CN	CF ₃		3-Cl, 5-Cl	Me		H	CH ₂ CN
CF ₃		3-Cl	Me	H	CH ₂ -2-tiazolilo	CF ₃		3-Cl, 5-Cl	Me		H	CH ₂ -2-tiazolilo
CF ₃		3-Cl	Me	H	CH ₂ -4-tiazolilo	CF ₃		3-Cl, 5-Cl	Me		H	CH ₂ -4-tiazolilo
CF ₃		3-Cl	Me	H	CH ₂ -5-tiazolilo	CF ₃		3-Cl, 5-Cl	Me		H	CH ₂ -5-tiazolilo
CF ₃		3-Cl	Me	H	CH ₂ -3-Py	CF ₃		3-Cl, 5-Cl	Me		H	CH ₂ -3-Py
CF ₃		3-Cl	Me	H	CH ₂ -4-Py	CF ₃		3-Cl, 5-Cl	Me		H	CH ₂ -4-Py
CF ₃		3-Cl	Me	Me	CH ₂ CF ₃	CF ₃		3-Cl, 5-Cl	Me		Me	CH ₂ CF ₃
CF ₃		3-Cl	Me	CO ₂ Me	CH ₂ CF ₃	CF ₃		3-Cl, 5-Cl	Me		CO ₂ Me	CH ₂ CF ₃
CF ₃		3-Cl		Me C(O)Me	CH ₂ CF ₃	CF ₃		3-Cl, 5-Cl	Me		C(O)Me	CH ₂ CF ₃
CF ₃		3-Cl	Me	Me	CH ₂ -2-Py	CF ₃		3-Cl, 5-Cl	Me		Me	CH ₂ -2-Py
CF ₃		3-Cl	Me	CO ₂ Me	CH ₂ -2-Py	CF ₃		3-Cl, 5-Cl	Me		CO ₂ Me	CH ₂ -2-Py
CF ₃		3-Cl	Me	C(O)Me	CH ₂ -2-Py	CF ₃		3-Cl, 5-Cl	Me		C(O)Me	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂		3-Cl	Me	H	H	CF(CF ₃) ₂		3-Cl, 5-Cl	Me		H	H
CF(CF ₃) ₂		3-Cl	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂		3-Cl, 5-Cl	Me		H	Me

R ¹	R	(R ²) _m	R	⁴	⁵	¹	R	(R ²) _m	R	³	⁴	⁵
CF(CF ₃) ₂		3-Cl		H	Et	CF(CF ₃) ₂		3-Cl, 5-Cl		Me	H	Et
CF(CF ₃) ₂		3-Cl			H <i>i</i> -Pr	CF(CF ₃) ₂		3-Cl, 5-Cl		Me	H	<i>i</i> -Pr
CF(CF ₃) ₂		3-Cl		H	CH ₂ Ph	CF(CF ₃) ₂		3-Cl, 5-Cl		Me	H	CH ₂ Ph
CF(CF ₃) ₂		3-Cl		H	CH ₂ CO ₂ Me	CF(CF ₃) ₂		3-Cl, 5-Cl		Me	H	CH ₂ CO ₂ Me
CF(CF ₃) ₂		3-Cl		H	CH ₂ CN	CF(CF ₃) ₂		3-Cl, 5-Cl		Me	H	CH ₂ CN
F(CF ₃) ₂		3-Cl		H	CH ₂ -2-tiazolilo	CF(CF ₃) ₂		3-Cl, 5-Cl		Me	H	CH ₂ -2-tiazolilo
CF(CF ₃) ₂		3-Cl		H	CH ₂ -4-tiazolilo	CF(CF ₃) ₂		3-Cl, 5-Cl		Me	H	CH ₂ -4-tiazolilo
CF(CF ₃) ₂		3-Cl		H	CH ₂ -5-tiazolilo	CF(CF ₃) ₂		3-Cl, 5-Cl		Me	H	CH ₂ -5-tiazolilo
CF(CF ₃) ₂		3-Cl		H	CH ₂ -3-Py	CF(CF ₃) ₂		3-Cl, 5-Cl		Me	H	CH ₂ -3-Py
CF(CF ₃) ₂		3-Cl		H	CH ₂ -4-Py	CF(CF ₃) ₂		3-Cl, 5-Cl		Me	H	CH ₂ -4-Py
CF(CF ₃) ₂		3-Cl		Me	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂		3-Cl, 5-Cl		Me	Me	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂		3-Cl		CO ₂ Me	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂		3-Cl, 5-Cl			Me CO ₂ Me	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂		3-Cl		C(O)Me	CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂		3-Cl, 5-Cl		Me	C(O)Me	CH ₂ CF ₃
CF(CF ₃) ₂		3-Cl		Me	CH ₂ -2-Py	CF(CF ₃) ₂		3-Cl, 5-Cl		Me	Me	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂		3-Cl		CO ₂ Me	CH ₂ -2-Py	CF(CF ₃) ₂		3-Cl, 5-Cl		Me	CO ₂ Me	CH ₂ -2-Py-
CF(CF ₃) ₂		3-Cl		C(O)Me	CH ₂ -2-Py	CF(CF ₃) ₂		3-Cl, 5-Cl		Me	C(O)Me	CH ₂ -2-Py

R ¹	R (R ²) _m	R ³	H	R	H	1	R (R ²) _m	R ³	H	4	5
CF ₃	H	H	H		CH ₂ CF ₃	CF ₃	H	Me	H		CH ₂ CF ₃
CF ₃	2-Cl	H	H		CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-Cl	Me	H		CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl	H	H		CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl	Me	H		CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl, 5-Cl	H	H		CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H		CH ₂ CF ₃
CF ₃	2-F	H	H		CH ₂ CF ₃	CF ₃	2-F	Me	H		CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-F	H	H		CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F	Me	H		CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-F, 5-F	H	H		CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-F, 5-F	Me	H		CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-CF ₃	H	H		CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CF ₃	Me	H		CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H		CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H		CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	H	H		CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H		CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Br, 5-Br	H	H		CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br, 5-Br	Me	H		CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Br	H	H		CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-Br	Me	H		CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-I	H	H		CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-I	Me	H		CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-CN	H	H		CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-CN	Me	H		CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-Me	H	H		CH ₂ CF ₃		3-Me	Me	H		CH ₂ CF ₃
CF ₃	3-OMe	H	H		CH ₂ CF ₃	CF ₃	3-OMe	Me	H		CH ₂ CF ₃

R ¹	R	(R ²) _m	R	R ³	R ⁴	R ⁵	1	R	(R ²) _m	R	R ³	R ⁴	5
CF ₃		3-OCF ₃		H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃		3-OCF ₃		Me	H	CH ₂ CF ₃
CF ₃		H		Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃		H		H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃		2-Cl		Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃		2-Cl		H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃		3-Cl		Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃		3-Cl		H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃		3-Cl, 5-Cl		Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃		3-Cl, 5-Cl		H	H	CH ₂ -2-Py
CH ₃		2-F		Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃		2-F		H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃		3-F		Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃		3-F		H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃		3-F, 5-F		Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃		3-F, 5-F		H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃		3-CF ₃		Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃		3-CF ₃		H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃		3-CF ₃ , 5-CF ₃		Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃		3-CF ₃ , 5-CF ₃		H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃		3-Cl, 5-CF ₃		Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃		3-Cl, 5-CF ₃		H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃		3-Br, 5-Br		Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃		3-Br, 5-Br		H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃		3-Br		Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃		3-bur		H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃		3-I		Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃		3-I		H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃		3-CN		Cl	H	CH ₂ CF ₃	CH ₃		3-CN		H	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃		3-M		Cl	H	CH ₂ CF ₃	CF ₃		3-Me		H	H	CH ₂ -2-Py

R ¹	R	(R ²) _m	R	⁴	R	⁵	¹	R	(R ²) _m	R	³	⁴	⁵
CF ₃		3-OMe	Cl	H		CH ₂ CF ₃	CF ₃		3-OMe	H		H	CH ₂ -2-Py
CF ₃		3-CF ₃	Cl	H		CH ₂ CF ₃	CF ₃		3-OCF ₃	H		H	CH ₂ -2-Py
CF ₃		H	Me	H		CH ₂ -2-Py	CF ₃		. H	Cl		H	CH ₂ -2-Py
CF ₃		2-Cl	Me	H		CH ₂ -2-Py	CF ₃		2-Cl	Cl		H	CH ₂ -2-Py
CF ₃		3-Cl	Me	He		CH ₂ -2-Py	CF ₃		3-Cl	Cl		H	CH ₂ -2-Py
CF ₃		3-Cl, 5-Cl	Me	H		CH ₂ -2-Py	CF ₃		3-Cl, 5-Cl	Cl		H	CH ₂ -2-Py
CF ₃		2-F	Me	H		CH ₂ -2-Py	CF ₃		2-F	Cl		H	CH ₂ -2-Py
CF ₃		3-F	Me	H		CH ₂ -2-Py	CF ₃		3-F	Cl		H	CH ₂ -2-Py
CF ₃		3-F, 5-F	Me	H		CH ₂ -2-Py	CF ₃		3-F, 5-F	Cl		H	CH ₂ -2-Py
CF ₃		3-CF ₃	Me	H		CH ₂ -2-Py	CF ₃		3-CF ₃	Cl		H	CH ₂ -2-Py
CF ₃		3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H		CH ₂ -2-Py	CF ₃		3-CF ₃ , 5-CF ₃	Cl		H	CH ₂ -2-Py
CF ₃		3-Cl, 5-CF ₃	Me	H		CH ₂ -2-Py	CF ₃		3-Cl, 5-CF ₃	Cl		H	CH ₂ -2-Py
CF ₃		3-Br, 5-Br	Me	H		CH ₂ -2-Py	CF ₃		3-Br, 5-Br	Cl		H	CH ₂ -2-Py
CF ₃		3-Br	Me	H		CH ₂ -2-Py	CF ₃		3-Br	Cl		H	CH ₂ -2-Py
CF ₃		3-I	Me	H		CH ₂ -2-Py	CF ₃		3-I	Cl		H	CH ₂ -2-Py
CF ₃		3-CN	Me	H		CH ₂ -2-Py	CF ₃		3-CN	Cl		H	CH ₂ -2-Py

R ¹	R (R ²) _m	R ³	R ⁴	R ⁵	¹	R (R ²) _m	R ³	⁴	⁵
CF ₃	3-Me	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-Me	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-some	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-OMe	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₃	3-OCF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py	CF ₃	3-OCF ₃	Cl	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	H	H	H	CH ₂ -CF ₃	CF ₂ CF ₃	H	Me	H	
CF ₂ CF ₃	2-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	2-Cl	Me	H	CH ₂ -3-Py
CF ₂ CF ₃	3-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	3-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	-3-Cl, 5-Cl	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	3-Cl, 5-Cl	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	2-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	2-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	3-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-F, 5-F	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	3-F, 5-F	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	3-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	3-CF ₃ , 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	3-Cl, 5-CF ₃	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-Br, 5-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	3-Br, 5-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	3-Br	Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃	3-I	H	H	CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃	3-I	Me	H	CH ₂ -2-Py

R ¹	R	(R ²) _m	R	⁴	R	⁵	¹	R	(R ²) _m	R	³	⁴	⁵
CF ₂ CF ₃		3-CN		H		CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃		3-CN		Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃		3-Me		H		CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃		3-Me		Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃		3-OMe		H		CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃		3-OMe		Me	H	CH ₂ -2-Py
CF ₂ CF ₃		3-OCF ₃		H		CH ₂ CF ₃	CF ₂ CF ₃		3-OCF ₃		Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂		H		H		CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂		H		Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂		2-Cl		H		CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂		2-Cl		Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂		3-Cl		H		CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂		3-Cl		Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂		3-Cl, 5-Cl		H		CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂		3-Cl, 5-Cl		Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂		2-F		H		CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂		2-F		Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂		3-F		H		CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂		3-F		Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂		3-F, 5-F		H		CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂		3-F, 5-F		Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂		3-CF ₃		H		CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂		3-CF ₃		Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂		3-CF ₃ , 5-CF ₃		H		CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂		3-CF ₃ , 5-CF ₃		Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂		3-Cl, 5-CF ₃		H		CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂		3-Cl, 5-CF ₃		Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂		3-Br, 5-Br		H		CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂		3-Br, 5-Br		Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂		3-Br		H		CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂		3-Br		Me	H	CH ₂ -2-Py

R ¹	R	R (R ²) _m	R	⁴	R	⁵	¹	R	R ³	⁴	R	R ³	⁴	⁵
CF(CF ₃) ₂		3-I		H		CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂		Me	H		Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂		3-CN		H		CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂		Me	H		Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂		3-Me		H		CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂		Me	H		Me	H	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂		3-OMe		H		CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂		Me	He		Me	He	CH ₂ -2-Py
CF(CF ₃) ₂		3-OCF ₃		H		CH ₂ CF ₃	CF(CF ₃) ₂		Me	H		Me	H	CH ₂ -2-Py

Formulación/Utilidad

Los compuestos de esta invención se usarán generalmente como una formulación o composición con un vehículo agrícolamente adecuado que comprende al menos uno de un diluyente líquido, un diluyente sólido o un tensioactivo. Los ingredientes de la formulación o composición se seleccionan para que sean coherentes con las propiedades físicas del ingrediente activo, modo de aplicación y factores medioambientales tales como tipo de tierra, humedad y temperatura. Las formulaciones útiles incluyen líquidos tales como soluciones (incluyendo concentrados emulsionables), suspensiones, emulsiones (incluyendo microemulsiones y/o suspoemulsiones) y similares, que opcionalmente pueden estar espesadas en geles. Las formulaciones útiles incluyen además sólidos tales como polvos, gránulos, peletes, comprimidos, películas (incluyendo tratamiento de semillas, y similares que pueden ser dispersables en agua ("humectables") o solubles en agua. El ingrediente activo puede estar (micro)encapsulado y formando una suspensión o formulación sólida; como alternativa, la formulación entera del ingrediente activo puede estar encapsulada (o "recubierta"). La encapsulación puede controlar o retrasar la liberación del ingrediente activo. Las formulaciones pulverizables pueden extenderse en medios adecuados y usarse en volúmenes de pulverización de aproximadamente uno a varios cientos de litros por hectárea. Las composiciones de alta concentración se usan principalmente como intermedios para la formulación adicional.

Las formulaciones contendrán típicamente cantidades eficaces de ingrediente activo, diluyente y tensioactivo, dentro de los siguientes intervalos aproximados que constituyen hasta 100 por ciento en peso.

	Porcentaje en Peso		
	Ingrediente activo	Diluyente	Tensoactivo
Gránulos, Comprimidos y Polvos Dispersables en Agua o Solubles en Agua.	0,001-90	0-99,999	0-15
Suspensiones, Emulsiones, Soluciones (incluyendo Concentrados Emulsionables)	1-50	40-99	0-50
Polvos de Espolvoreo	1-25	70-99	0-5
Gránulos y Aglomerados	0,001-99	5-99,999	0-15
Composiciones a Alta Concentración	90-99	0-10	0-2

Se describen típicos diluyentes sólidos en Watkins, *et al.*, Handbook de Insecticide Dust Diluents y Carriers, 2ª Ed., Dorland Books, Caldwell, Nueva Jersey. Los diluyentes líquidos típicos se describen en Marsden, Solvents Guide, 2ª Ed., Interscience, Nueva York, 1950. Los manuales McCutcheon's Detergents y Emulsifiers Annual, Allured Publ. Corp., Ridgewood, Nueva Jersey, así como Sisely y Wood, Enciclopedia de Surface Active Agents, Chemical Publ. Co., Inc., Nueva York, 1964, mencionan tensioactivos y usos recomendados. Todas las formulaciones pueden contener cantidades menores de aditivos para reducir la espuma, el apelmazamiento, la corrosión, el crecimiento microbiológico, y similares, o espesantes para aumentar la viscosidad.

Los tensioactivos incluyen, por ejemplo, alcoholes polietoxilados, alquilfenoles polietoxilados, ésteres de ácido graso de sorbitan polietoxilados, sulfosuccinatos de dialquilo, sulfatos de alquilo, sulfonatos de alquilbenceno, organosiliconas, *N,N*-dialquilauratos, sulfonatos de lignina, condensados de naftaleno sulfonato formaldehído, policarboxilatos, ésteres de glicerol, copolímeros de bloque de polioxietileno/polioxipropileno, y alquilpoliglicósidos donde el número de unidades de glucosa, denominado grado de polimerización (D.P.), puede estar en el intervalo de 1 a 3 y las unidades de alquilo pueden estar en el intervalo de C₆-C₁₄ (véase Pure y Applied Chemistry 72, 1255-1264). Los diluyentes sólidos incluyen, por ejemplo, arcillas tales como bentonita, montmorillonita, atapulgita y caolín, almidón, azúcar, sílice, talco, tierras diatomeas, urea, carbonato de calcio, carbonato y bicarbonato de sodio, y sulfato de sodio. Los diluyentes líquidos incluyen, por ejemplo, agua, *N,N*-dimetilformamida, dimetilsulfóxido, *N*-alquilpirrolidona, etilenglicoles, polipropilenglicol, propilencarbonato, ésteres dibásicos; parafinas, alquilbencenos, alquilnaftalenos, glicerina, triacetina, aceites de oliva, ricino, semillas de lino, tuna, sésamo, maíz, maní, semillas de

algodón, soja, colza y coco, ésteres de ácidos grasos, cetonas tales como ciclohexanona, 2-heptanona, isoforona y 4-hidroxi-4-metil-2-pentanona; acetatos tales como acetato de hexilo, acetato de heptilo y acetato de octilo, y alcoholes tales como metanol, ciclohexanol, decanol, bencilo y alcohol tetrahidrofurfurílico.

Las formulaciones útiles de esta invención también pueden contener materiales conocidos como adyuvantes de formulación incluyendo antiespumantes, formadores de película y tintes y son muy conocidos por los expertos en la técnica. Los antiespumantes pueden incluir líquidos dispersables en agua que comprenden poliorganosiloxanos tales como Rhodorsil® 416. Los formadores de película pueden incluir acetatos de polivinilo, copolímeros de acetato de polivinilo, copolímero de polivinilpirrolidona-acetato de vinilo, alcoholes de polivinilo, copolímeros de alcohol de polivinilo y ceras. Los tintes pueden incluir composiciones colorantes líquidos dispersables en agua tales como colorante rojo Pro-lzed®. Cualquier experto en la técnica apreciará que esto es una lista no exhaustiva de adyuvantes de formulación. Los ejemplos de adyuvantes de formulación adecuados incluyen los mencionados en este documento y los mencionados en McCutcheon's 2001, Volumen 2: Functional Materials, publicado por MC Publishing Company y la publicación PCT WO 03/024222.

Las disoluciones, que incluyen los concentrados emulsionables, se pueden preparar por simple mezcla de los ingredientes. Los polvos finos y polvos normales pueden prepararse por mezclado y, habitualmente, por molido en un molinillo de martillos o molinillo de energía de fluidos. Las suspensiones se preparan habitualmente por molido húmedo; véase, por ejemplo, el documento U.S. 3,060,084. Los gránulos y aglomerados pueden prepararse por pulverización del material activo sobre vehículos granulares preformados o por técnicas de aglomeración. Véase Browning, "Agglomeration", Chemical Engineering, 4 de diciembre de 1967, pp. 147-48, Perry's Chemical Engineer's Handbook, 4ª Ed., McGraw-Hill, New York, 1963, páginas 8-57 y siguientes, y el documento WO 91/13546. Los aglomerados pueden prepararse como se describe en el documento U.S. 4,172,714. Los gránulos dispersables en agua y solubles en agua pueden prepararse como se muestra en los documentos U.S. 4,144,050, U.S. 3,920,442 y DE 3,246,493. Los comprimidos pueden prepararse como se muestra en los documentos U.S. 5,180,587, U.S. 5,232,701 y U.S. 5,208,030. Las películas pueden prepararse como se muestra en los documentos GB 2,095,558 y U.S. 3,299,566.

Para información adicional respecto a la técnica de la formulación, véanse T. S. Woods, "The Formulator's Toolbox - Product Forms for Modern Agriculture" en Pesticide Chemistry y Bioscience, The Food-Environment Challenge, T. Brooks y T. R. Roberts, Eds., Proceedings de the 9th International Congress on Pesticide Chemistry, The Royal Society of Chemistry, Cambridge, 1999, pp. 120-133. Véanse también los documentos U.S. 3,235,361, de la Col. 6, línea 16 a la Col. 7, línea 19 y los Ejemplos 10-41; el documento U.S. 3,309,192, Col. 5, línea 43 a Col. 7, línea 62 y los Ejemplos 8, 12, 15, 39, 41, 52, 53, 58, 132, 138-140, 162-164, 166, 167 y 169-182; el documento U.S. 2,891,855, Col. 3, línea 66 a Col. 5, línea 17 y los Ejemplos 1-4; Klingman, Weed Control as a Science, John Wiley y Sons, Inc., New York, 1961, pp. 81-96; Hance et ál., Weed Control Handbook, 8ª Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1989; y Developments in formulation technology, PJB Publications, Richmond, Reino Unido, 2000.

En los siguientes Ejemplos, todos los porcentajes están en peso y todas las formulaciones se preparan por las rutas convencionales. Los números de compuesto se refieren a los compuestos en las Tablas de índice A-C. Se cree que el especialista en la técnica, usando la descripción anterior, puede utilizar la presente invención sin elaboración adicional en su alcance más completo. Los Ejemplos siguientes se interpretan, por tanto, como meramente ilustrativos, y no limitantes de la descripción bajo ninguna forma en absoluto. Los porcentajes están en peso excepto cuando se indique otra cosa.

Ejemplo A		
Polvo Humectable		
Compuesto 1		65,0%
Dodecilfenol polietilenglicol éter		2,0%
Ligninsulfonato de sodio		4,0%
Silicoaluminato de sodio		6,0%
Montmorillonita (calcinada)		23,0%
Ejemplo B		
Gránulo		

Ejemplo B		
Gránulo		
Compuesto 2		10,0%
Gránulos de atapulgita (bajo contenido en materia volátil, 0,71/0,30 mm; Tamices U.S.S. N° 25-50)		90,0%
Ejemplo C		
Aglomerado Extruido		
Compuesto 8		25,0%
Sulfato de sodio anhidro		10,0%
Ligninsulfonato de calcio en bruto		5,0%
Alquilnaftalenosulfonato de sodio		1,0%
Bentonita de calcio/magnesio		59,0%
Ejemplo D		
Concentrado Emulsionable		
Compuesto 20		20,0%
Mezcla de sulfonatos de aceites solubles y éteres polioxietilénicos		10,0%
Isoforona		70,0%
Ejemplo E		
Microemulsión		
Compuesto 21		5,0%
Copolímero de polivinilpirrolidona-acetato de vinilo		30,0%
Alquilpoliglicósido		30,0%
Monooleato de glicerilo		15,0%
Agua		20,0%
Ejemplo F		
Tratamiento de semilla		
Compuesto 101		20,00%

Ejemplo F		
Tratamiento de semilla		
Copolímero de polivinilpirrolidona-acetato de vinilo		5,00%
Cera ácida montana		5,00%
Ligninsulfonato de calcio		1,00%
Copolímeros de bloques de polioxietileno/polioxipropileno		1,00%
Alcohol estearílico (POE 20)		2,00%
Poliorganosilano		0,20%
Tinte de colorante rojo		0,05%
Agua		65,75%
Ejemplo G		
Barra de fertilizante		
Compuesto 201		2,50%
Copolímero de pirrolidona-estireno		4,80%
16-Etoxilado de tristirilfenilo		2,30%
Talco		0,80%
Almidón de maíz		5,00%
Fertilizante de liberación lenta Nitrophoska® Permanent 15-9-15 BASF		36,00%
(BASF)		
Caolín		38,00%
Agua		10.,60%

Los compuestos de esta invención exhiben una actividad contra un amplio espectro de plagas de invertebrados. Estas plagas incluyen invertebrados que habitan en una variedad de ambientes tales como, por ejemplo, follaje de plantas, raíces, suelo, cultivos cosechados u otros alimentos, estructuras de formación o integumentos animales. Estas plagas incluyen, por ejemplo, invertebrados que se alimentan del follaje (incluyendo hojas, ramas, flores y frutas), semillas, lana, fibras textiles o sangre o tejidos animales, y causando lesión o daño, por ejemplo, a cultivos agronómicos en crecimiento o agronómicos, forestas, cultivos de invernadero, ornamentales, cultivos de almácigo, alimentos almacenados o productos fibrosos, o casas u otras estructuras o sus contenidos o que son dañinos para la salud animal o la salud pública. Los expertos en la técnica apreciarán que no todos los compuestos son igualmente efectivos contra todos los estadios de crecimiento de todas las plagas.

Estos presentes compuestos y composiciones son así de utilidad agronómica para proteger los cultivos de campo de plagas de invertebrados fitófagas, y también no agronómica para proteger otros cultivos hortícolas y plantas de plagas de invertebrados fitófagas. Esta utilidad incluye cultivos de protección y otras plantas (es decir, tanto agronómicas como no agronómicas) que contienen material genético introducido por ingeniería genética (es decir,

transgénicos) o modificados por mutagénesis para proporcionar rasgos ventajosos. Los ejemplos de estos rasgos incluyen tolerancia a herbicidas, resistencia a plagas fitófagas (por ejemplo, insectos, ácaros, áfidos, arañas, nematodos, caracoles, hongos fitopatógenos, bacterias y virus), mejor crecimiento de plantas, mayor tolerancia a las condiciones de crecimiento adversas tales como altas o bajas temperaturas, baja o alta humedad del suelo, y alta salinidad, mayor florecencia o fructificación, mayores rendimientos de cultivo, maduración más rápida, mayor calidad y/o valor nutricional del producto cultivado, o mejor almacenamiento o propiedades de proceso mejoradas de los productos recolectados. Las plantas transgénicas se pueden modificar para expresar múltiples rasgos. Los ejemplos de plantas que contienen rasgos provistos por ingeniería genética o mutagénesis incluyen variedades de maíz, algodón, soja y papa que expresan una toxina insecticida de *Bacillus thuringiensis* tales como YIELD GARD®, KNOCKOLTT®, STARLINK®, BOLLGARD®, NuCOTN® y NEMIEAF®, y variedades tolerantes a herbicidas de algodón, soja y semillas de colza tales como ROUNDUP READY®, LIBERTY LINK®, IMI®, STS® y CLEARFIELD®, así como cultivos que expresan la *N*-acetiltransferasa (GAT) para proporcionar resistencia a herbicida glifosato, o cultivos que contienen el gen HRA que provee resistencia a herbicidas que inhiben la acetolactato sintasa (ALS). Los presentes compuestos y composiciones pueden interactuar sinérgicamente con rasgos introducidos por ingeniería genética o modificados por mutagénesis, permitiendo así la expresión fenotípica o la efectividad de los rasgos o aumento de la efectividad del control de la plaga de invertebrados de los presentes compuestos y composiciones. En particular, los presentes compuestos y composiciones pueden interactuar sinérgicamente con la expresión fenotípica de proteínas u otros productos naturales tóxicos para las plagas de invertebrados para proporcionar un control más que aditivo de estas plagas.

Las aplicaciones no agronómicas se refieren al control de plagas de invertebrados en otras áreas distintas a los campos de plantas de cultivo. Los usos no agronómicos de los presentes compuestos y composiciones incluyen el control de plagas de invertebrados en granos, frijoles y otros alimentos almacenados, y en textiles tales como vestimenta y alfombras. Las aplicaciones no agronómicas también incluyen el control de plagas de invertebrados en plantas ornamentales, bosques, en astilleros, a lo largo de las cunetas y pasos de ferrocarriles, y en áreas con césped tales como explanadas de césped, campos de golf y pastos. Las aplicaciones no agronómicas también incluyen el control de plagas de invertebrados en casas y otros edificios que pueden estar ocupados por seres humanos y/o animales de compañía, granja, explotación, zoo u otros animales. Los usos no agronómicos de los presentes compuestos y composiciones también incluyen el control de plagas tales como termitas que pueden dañar la lana u otros materiales estructurales utilizados en edificios.

Los usos no agronómicos de los presentes compuestos y composiciones también incluyen la protección de la salud humana y animal por control de plagas de invertebrados que son parásitos o que transmiten enfermedades infecciosas. El control de parásitos animales incluye el control de parásitos externos que son parásitos para la superficie del cuerpo del animal huésped (por ejemplo, hombros, axilas, abdomen, parte interna de los muslos) y parásitos internos que son parásitos para el interior del cuerpo del animal huésped (por ejemplo, estómago, intestino, pulmón, venas, debajo de la piel, tejido linfático). El parásito externo o enfermedad que transmite plagas incluyen, por ejemplo, niguas, garrapatas, piojos, mosquitos, moscas, ácaros y pulgas. Los parásitos internos incluyen gusanos, anquilostomas y helmintos. Los compuestos y composiciones de la presente invención son apropiados para un control sistémico y/o no sistémico de infestación o infección de parásitos sobre animales. Los compuestos y composiciones de la presente invención son particularmente apropiados para combatir parásitos externos o una enfermedad que transmite plagas. Los compuestos y composiciones de la presente invención son apropiados para combatir parásitos que infestan animales de trabajo agrícola tales como vacas, cabras, ovejas, caballos, cerdo, burros, camellos, búfalos, conejos, gallinas, pavos, patos, gansos y abejas; mascotas y animales domésticos tales como perros, gatos, pájaros y peces de acuario; así como los llamados animales experimentales tales como hámsteres, conejillo de Indias, ratas y ratones. Al combatir estos parásitos, se reducen las natalidades y el rendimiento (en términos de carne, leche, lana, pieles, huevos, miel, etc.), de modo que la aplicación de una composición que comprende un compuesto de la presente invención permite un manejo de animales más económico y más simple.

Los ejemplos de plagas de invertebrados agronómicas y no agronómicas incluyen huevos, larvas y adultos del orden Lepidoptera, tales como orugas, gusanos cortadores, medidores, y heliotinas en la familia Noctuidae (por ejemplo *Sesamia inferens* Walker, *Sesamia nonagrioides* Lefebvre, *Spodoptera eridania* Cramer, *Spodoptera fugiperda* J. E. Smith, *Spodoptera exigua* Hübner, *Spodoptera littoralis* Boisduval, *Spodoptera ornithogalli* Guenée, *Agrotis ipsilon* Hufnagel, (*Anticarsia gemmatilis* Hübner, *Lithophane antennata* Walker, *Barathra brassicae* Linnaeus, *Pseudoplusia includens* Walker, *Trichoplusia ni* Hilbner, *Heliothis virescens* Fabricius); perforadores, barrenadores, gusanos del césped, gusanos de coníferas, gusanos de coles y polillas de la familia Piralidae (por ejemplo, perforador del maíz europeo (*Ostrinia nubilalis* Hübner), gusano de la naranja navel (*Amyelois transitella* Walker), oruga de la raíz del maíz (*Crambus caliginosellus* Clemens), gusano peludo del césped (Pyralidae: *Crambinae*) tales como *Herpetogramma licarsisalis* Walker, *Chilo infuscatellus* Snellen, *Neoleucinodes elegantalis* Guenée, *Cnaphalocerus medinalis*, *Desmia funeralis* Hübner, *Diaphania nitidalis* Stoll, *Hellula hydrillis* Guenée, *Scirpophaga incertulas* Walker, *Scirpophaga infuscatellus* Snellen, *Scirpophaga innotata* Walker, *Scirpophaga nivella* Fabricius, (*Chilo polychrysus* Meyrick, *Crociodolomia binotalis* English); enrolladores, gusanos de la yema, gusanos de la semilla y gusanos de la fruta en la familia de Tortricidae (por ejemplo, *Cydia pomonella* Linnaeus, *Endopiza viteana* Clemens, *Grapholita molesta* Busck, *Cryptophlebia leucotreta* Meyrick, *Ecdyolopha aurantiana* Lima, *Argyrotaenia velutinana* Walker, *Choristoneura rosaceana* Harris, *Epiphyas postvittana* Walker, *Eupoecilia ambiguella* Hübner, *Pandemis*

5 *pyrusana* Kearfott, *Platynota stultana* Walsingham, *Pandemis cerasana* Hübner, *Pandemis heparana* Denis & Schiffermüller); y muchos otros lepidópteros económicamente importantes (por ejemplo, *Plutella xylostella* Linnaeus, *Pectinophora gossypiella* Saunders, *Lymantria dispar* Linnaeus, *Carpocapsa niponensis* Walsingham, *Anarsia lineatella* Zeller, *Phthorimaea operculella* Zeller, *Lithocolletis blancardella* Fabricius, Asiatic apple leafminer *Lithocolletis ringoniella* Matsumura, *Lerodea eufala* Edwards, *Leucoptera scitella* Zeller); huevos, ninfas y adultos del orden Blattodea incluyendo cucarachas de las familias Blattellidae y Blattidae (por ejemplo, *Blatta orientalis* Linnaeus, *Blattella asahinai* Mizukubo, *Blattella germanica* Linnaeus, *Supella longipalpa* Fabricius, *Periplaneta americana* Linnaeus, *Periplaneta brunnea* Burmeister, *Leucophaea maderae* Fabricius, *Periplaneta fuliginosa* Service, *Periplaneta australasiae* Fabr., *Nauphoeta cinerea* Olivier y *Symploce pallens* Stephens); larvas de
 10 alimentación foliar y adultos del orden Coleoptera incluyendo gorgojos de las familias Anthribidae, Bruchidae, y Curculionidae (por ejemplo, picudo del algodón (Anthonomus grandis Boheman), gorgojo acuático del arroz (Lissorhoptrus oryzophilus Kuschel), gorgojo del trigo (Sitophilus granarius Linnaeus), gorgojo del arroz (Sitophilus oryzae Linnaeus), delumbis de Listronotus (Listronotus maculicollis Dietz), escarabajo del pasto (Sphenophorus parvulus Gyllenhal), curculiónidos (Sphenophorus venatus vestitus), Sphenophorus cicatristriatus Fahraeus);
 15 pulgillas, escarabajos del pepino, gusanos que se alimentan de raíces, escarabajos que se alimentan de hojas, escarabajos de la patata y minadores de la familia Chrysomelidae (por ejemplo, escarabajo de la patata de Colorado (Leptinotarsa decemlineata Say), gusano de la raíz del maíz occidental (Diabrotica virgifera virgifera LeConte)); frailecillos y otros escarabajos de la familia Scarabaeidae (por ejemplo, Popillia japonica Newman, Anomala orientalis Waterhouse, Exomala orientalis (Waterhouse) Baraud, Cyclocephala borealis Arrow, Cyclocephala immaculata Olivier o C. lurida Bland y Aphodius spp., Ataenius spretulus Haldeman, Cotinis nitida Linnaeus, Maladera castanea Arrow, Phyllophaga spp. y Rhizotrogus majalis Razoumowsky?); escarabajos de las alfombras de la familia
 20 Dermestidae; gusanos alambre de la familia Elateridae; escarabajos de la corteza de la familia Scolytidae y escarabajos de la harina de la familia Tenebrionidae. Además, las plagas agronómicas y no agronómicas incluyen: huevos, adultos y larvas del orden Dermaptera incluyendo tijeretas de la familia de Forficulidae (por ejemplo, Forficula auricularia Linnaeus, Chelisoches morio Fabricius); adultos y ninfas de los órdenes Hemiptera y Homoptera tales como chinches de plantas de la familia Miridae, cicadas de la familia Cicadidae, saltahojas (por ejemplo, Empoasca spp.) de la familia Cicadellidae, chicharritas de las familias Fulgoridae y Delphacidae, membrácidos de la familia Membracidae, psílidos de la familia Psyllidae, moscas blancas de la familia Aleyrodidae, áfidos de la familia
 25 Aphididae, filoxeras de la familia Phylloxeridae, piojos harinosos de la familia Pseudococcidae, cochinillas de las familias Coccidae, Diaspididae y Margarodidae, insectos de encaje de la familia Tingidae, chinches hediondas de la familia Pentatomidae, chinche de los pastos (por ejemplo, chinche de la semilla (Blissus leucopterus hirtus Montandon) y chinchilla de los pastos (Blissus insularis Barber)) y otros chinches de la familia Lygaeidae, chinches de la baba de la familia chinches de la calabaza Cercopidae de la familia Coreidae, y chinches rojas y chinches tintoreos de la familia Pyrrhocoridae. También están incluidos huevos, larvas, ninfas y adultos del orden Acari (ácaros) tales como ácaros araña y ácaros rojos en la familia Tetranychidae (por ejemplo, Panonychus ulmi Koch; Tetranychus urticae Koch, Tetranychus mcDanieli McGregor); falsa arañuela roja en la familia Tenuipalpidae (por ejemplo, ácaro rojo plano (Brevipalpus lewisi McGregor)); ácaros tostadores y ácaros de la yema en la familia Eriofyidae y otras arañas de alimentación foliar y ácaros importantes en la salud humana y animal, es decir, ácaros del polvo en la familia Epidermoptidae, ácaros del folículo en la familia Demodicidae, ácaros de la harina en la familia
 30 Glycyfagidae, garrapatas en el orden Ixodidae (por ejemplo, garrapata del venado (Ixodes scapularis Say), garrapatas de la oveja (Ixodes holocyclus Neumann), garrapatas americana del perro (Dermacentor variabilis Say), garrapata estrella solitaria (Amblyomma americanum Linnaeus)) y sarnas y ácaros de la sarna en las familias Psoroptidae, Pyemotidae, y Sarcoptidae; adultos y gusanillos del orden Orthoptera incluyendo saltamontes, langostas y grillos (por ejemplo, saltamontes migratorios (por ejemplo, Melanoplus sanguinipes Fabricius, M. differentialis Thomas), langostas (por ejemplo, Schistocerca americana Drury), langosta del desierto (Schistocerca gregaria Forskal), langosta migratoria (Locusta migratoria Linnaeus), saltamontes elegante (Zonocerus spp.), acheta doméstica (Acheta domesticus Linnaeus), grillos cebollinos (por ejemplo, grillo topo del sur (Scapteriscus vicinus Scudder) y grillos cebolleros (Scapteriscus borellii Giglio-Tos)); adultos e inmaduros del orden Diptera incluyendo minadores de la hoja, mosquitos, moscas de la fruta (Tephritidae), moscas fritas (por ejemplo, Oscinella frit Linnaeus), gusanos del suelo, moscas domésticas (por ejemplo, Musca domestica Linnaeus), mosca menor (por ejemplo, Fannia canicularis Linnaeus, F. femoralis Stein), moscas de los establos (por ejemplo, Stomoxys calcitrans Linnaeus), moscas de la cara, moscas de los cuernos, moscas de la muerte (por ejemplo, Chrysomya spp., Phormia spp.) y otras plagas de muscoides, moscas del caballo (por ejemplo, Tabanus spp.), moscas del cuajo equino (por ejemplo, Gastrophilus spp., Oestrus spp.), moscas del ganado (por ejemplo, Hypoderma spp.), moscas del ciervo (por ejemplo, Chrysops spp.), moscas de la oveja (por ejemplo, Melophagus ovinus Linnaeus) y otras especies del suborden Brachycera, mosquitos (por ejemplo, Aedes spp., Anopheles spp., Culex spp.), moscas negras (por ejemplo, Prosimulium spp., Simulium spp.), purrujas, moscas de la arena, moscas del sustrato y otras especies del suborden Nematocera; huevos, adultos e inmaduros en el orden Thysanoptera incluyendo Thrips tabaci Lindeman, Frankliniella spp., y otros tisanópteros de alimentación foliar; plagas de insectos del orden Hymenoptera incluyendo hormigas de la familia Formicidae incluyendo Camponotus floridanus Buckley, Camponotus ferrugineus Fabricius, Camponotus pennsylvanicus De Geer, Technomyrmex albipes fr. Smith), Pheidole sp., Tapinoma melanocephalum Fabricius; Monomorium Pharaonis Linnaeus, Wasmannia auropunctata Roger, Solenopsis geminata Fabricius, Solenopsis invicta Buren, Iridomyrmex humilis Mayr, Paratrechina longicornis Latreille, Tetramorium caespitum Linnaeus, Lasius alienus Förster y Tapinoma sessile Say. Otros Hymenoptera incluyen abejas (incluso abejas carpinteras), avispones, chaquetas amarillas, avispas y moscas de sierra (Neodiprion spp.; Cefus spp.); plagas de insectos del orden Isoptera incluyendo termitas en las familias Termitidae (ex. Macrotermes sp.), Kalotermitidae (ex.
 65

Cryptotermes sp.), y Rhinotermitidae (ex. Reticulitermes sp., Coptotermes sp.) la termita subterránea oriental (*Reticulitermes flavipes* Kollar), la termita subterránea occidental (*Reticulitermes hesperus* Banks), termitas de formosa subterráneas (*Coptotermes formosanus* Shiraki), la termita de algodón de las indias occidentales (*Incisitermes immigrans* Snyder), termita pulverizadora tropical de cabeza arrugada (*Cryptotermes brevis* Walker), termita de madera seca del sureste (*Incisitermes snyderi* Light), termitas subterráneas (*Reticulitermes virginicus* Banks), termita de madera seca Incisitermes (*Incisitermes minor* Hagen), termitas arbóreas tales como *Nasutitermes* sp. y otras termitas de interés económico; plagas de insectos del orden Thysanura tales como pececillo de plata (*Lepisma saccharina* Linnaeus) e insecto de fuego (*Thermobia domestica* Packard); plagas de insectos del orden Mallophaga y que incluyen el piojo de la cabeza (*Pediculus humanus capitis* De Geer), piojo del cuerpo (*Pediculus humanus humanus* Linnaeus), piojo del cuerpo de la gallina (*Menacanthus stramineus* Nitzsch), piojo del perro (*Trichodectes canis* De Geer), piojo de la gallina (*Goniocotes gallinae* De Geer), piojo del cuerpo de la oveja (*Bovicola ovis* Schrank), piojo de nariz corta del ganado (*Haematopinus eurysternus* Nitzsch), piojo de nariz larga del ganado (*Linognathus vituli* Linnaeus) y otros piojos succionadores y mordedores parásitos que atacan a hombres y animales; plagas de insectos del orden Siphonaptera incluyendo *Xenopsilla cheopis* Rotschild, *Ctenocephalides felis* Bouche, *Ctenocephalides canis* Curtis, *Ceratophyllus gallinae* Schrank, *Echidnophaga gallinacea* Westwood, *Pulex irritans* Linnaeus y otras pulgas que afectan a mamíferos y a aves. Otras plagas de artrópodos contempladas incluyen: arañas del orden Araneae tales como la araña solitaria marrón (*Loxosceles reclusa* Gertsch & Mulaik) y la viuda negra (*Latrodectus mactans* Fabricius), y centípedos del orden Scutigera tales como ciempiés casero (*Scutigera coleoptrata* Linnaeus). Los compuestos de la presente invención también tienen actividad sobre miembros de las clases Nematoda; Cestoda, Trematoda, y Acanthocephala incluyendo miembros económicamente importantes de los órdenes Strongylida, Ascaridida, Oxyurida, Rhabditida, Spirurida y Enoplida tales como pero sin limitación plagas agrícolas importantes desde el punto de vista económico (es decir nematodos de los nudos radicales del género *Meloidogyne*, nematodos de lesiones del género *Pratylenchus*, nematodos de las raíces cortas del género *Trichodorus*, etc.) y plagas importantes para la salud animal y humana (es decir todos los trematodos importantes desde el punto de vista económico, tenias y gusanos redondos tales como *Strongylus vulgaris* en caballos, *Toxocara canis* en perros, *Haemonchus contortus* en ovejas, *Dirofilaria immitis* Leidy en perros, *Anoplocephala perfoliata* en caballos, *Fasciola hepatica* Linnaeus en rumiantes, etc.).

Los compuestos de la invención muestran una actividad particularmente alta contra plagas del orden Lepidoptera (por ejemplo, *Alabama argillacea* Hübner (gusano de la hoja del maíz), *Archips argyrospila* Walker (enrollador de las hojas de los frutales), *A. rosana* Linnaeus (enrollador de las hojas europeo) y otras especies del género *Archips*, *Chilo suppressalis* Walker (perforador del tallo del arroz), *Cnaphalocrosis medinalis* Guenee (enrollador de las hojas del arroz), *Crambus caliginosellus* Clemens (oruga de la raíz del maíz), *Crambus teterrellus* Zincken (oruga del césped), *Cydia pomonella* Linnaeus (polilla de la manzana), *Earias insulana* Boisduval (oruga espinosa del algodón), *Earias vittella* Fabricius (gusano moteado), *Helicoverpa armigera* Hübner (oruga americana), *Helicoverpa zea* Boddie (gusano del maíz), *Heliothis virescens* Fabricius (gusano del tabaco), *Herpetogramma licarsisalis* Walker (gusano del césped), *Lobesia botrana* Denis & Schiffermüller (polilla de los racimos de uvas), *Pectinophora gossypiella* Saunders (gusano rosa), *Phyllocnistis citrella* Stainton (minador de las hojas de los cítricos), *Pieris brassicae* Linnaeus (mariposa de la col), *Pieris rapae* Linnaeus (blanquita de la col), *Plutella xylostella* Linnaeus (polilla de dorso de diamante), *Spodoptera exigua* Hübner (oruga militar de la remolacha), *Spodoptera litura* Fabricius (gusano gris del tabaco, oruga del racimo), *Spodoptera frugiperda* J. E. Smith (oruga militar tardía), *Trichoplusia ni* Hübner (gusano medidor de la col) y *Tuta absoluta* Meyrick (minador de las hojas del tomate)).

Los compuestos de la invención también tienen una actividad significativa desde el punto de vista comercial sobre miembros del orden Homoptera incluyendo: *Acyrtosiphon pisum* Harris (pulgón del guisante), *Aphis craccivora* Koch (pulgón negro de la alfalfa), *Aphis fabae* Scopoli (pulgón negro de las leguminosas), *Aphis gossypii* Glover (pulgón del algodón, pulgón del melón), *Aphis pomi* De Geer (pulgón de la manzana), *Aphis spiraeicola* Patch (pulgón verde del naranjo), *Aulacortum solani* Kaltenbach (pulgón de la dedalera), *Chaetosiphon fragaefolii* Cockerell (pulgón de la fresa), *Diuraphis noxia* Kurdjumov/Mordvilko (pulgón ruso del trigo), *Dysaphis plantaginea* Paaserini (pulgón rosado del manzano), *Eriosoma lanigerum* Hausmann (pulgón lanígero), *Hyalopterus pruni* Geoffroy (pulgón harinoso del ciruelo), *Lipaphis erysimi* Kaltenbach (pulgón del nabo), *Metopolofium dirrhodum* Walquer (pulgón de los cereales), *Macrosiphum euforbiae* Thomas (pulgón de la patata), *Myzus persicae* Sulzer (pulgón de la patata y el melocotonero, pulgón verde del melocotonero), *Nasonovia ribisnigri* Mosley (pulgón de la lechuga), *Pemfigus* spp. (pulgones de las raíces y pulgones de las agallas), *Rhopalosiphum maidis* Fitch (pulgón de la hoja del maíz), *Rhopalosiphum padi* Linnaeus (pulgón de la avena), *Schizaphis graminum* Rondani (pulgón verde de los cereales), *Sitobion avenae* Fabricius (pulgón inglés del grano), *Therioaphis maculata* Buckton (pulgón moteado de la alfalfa), *Toxoptera aurantii* Boyer de Fonscolombe (pulgón negro de los cítricos) y *Toxoptera citricida* Kirkaldy (pulgón pardo de los cítricos); *Adelges* spp. (adélidos); *Phloxera devastatrix* Pergande (filoxera de los pecanos); *Bemisia tabaci* Gennadius (mosca blanca del tabaco, mosca blanca de la remolacha), *Bemisia argentifolii* Bellows & Perring (mosca blanca de la hoja plateada), *Dialeurodes citri* Ashmead (mosca blanca de los cítricos) y *Trialeurodes vaporariorum* Westwood (mosca blanca de los invernaderos); *Empoasca fabae* Harris (saltahojas de la patata), *Laodelphax striatellus* Fallen (saltahojas pardo pequeño), *Macrolestes quadrilineatus* Forbes (saltahojas del aster), *Nephotettix cincticeps* Uhler (saltahojas verde), *Nephotettix nigropictus* Stål (saltahojas del arroz), *Nilaparvata lugens* Stål (saltahojas pardo), *Peregrinus maidis* Ashmead (saltahojas del maíz), *Sogatella furcifera* Horvath (saltahojas de dorso blanco), *Sogatodes orizicola* Muir (chicharritas del arroz), *Typhlocyba pomaria* McAtee (saltahojas del manzano blanco), *Erythroneoura* spp. (saltahojas de la vid); *Magiceda septendecim* Linnaeus (cigarra periódica); *Icerya purchasi*

Maskell (cochinilla algodonosa), *Quadraspidiotus perniciosus* Comstock (piojo de San José); *Planococcus citri* Risso (gorgojo algodonoso de los cítricos); *Pseudococcus* spp. (otro grupo de gorgojos); *Cacopsilla piricola* Foerster (psila del peral), *Trioza diospyri* Ashmead (psila del caqui).

Los compuestos de esta invención también tienen actividad sobre miembros del orden Hemiptera incluso: *Acrosternum hilare* Say, *Anasa tristis* De Geer., *Blissus leucopterus leucopterus* Say ; *Cimex lectularius* Linnaeus, *Corythuca gossypii* Fabricius, *Cyrtopeltis modesta* Distant, *Dysdercus suturellus* Herrich-Schliffer, *Euchistus servus* Say, *Euchistus variolarius* Palisot de Beauvois, *Graptosthetus* spp., *Leptoglossus corculus* Say, *Lygus lineolaris* Palisot de Beauvois, *Nezara viridula* Linnaeus, *Oebalus pugnax* Fabricius, *Oncopeltus fasciatus* Dallas, *Pseudatomoscelis seriatus* Reuter. Otros órdenes de insectos controlados por los compuestos de la invención incluyen Thysanoptera (por ejemplo, *Frankliniella occidentalis* Pergande (trip occidental de las flores), *Scirtotrips citri* Moulton (trip de los cítricos), *Sericotrips variabilis* Beach (trip de la soja) y *Thrips tabaci* Lindeman (trip de la cebolla); y el orden Coleoptera (por ejemplo, *Leptinotarsa decemlineata* Say (escarabajo de la patata de colorado), *Epilachna varivestis* Mulsant (escarabajo del frijol) y gusanos alambre del género *Agriotes*, *Atous* o *Limonium*).

Nótese que algunos sistemas contemporáneos de clasificación ubican a los Homoptera como un suborden dentro del orden Hemiptera.

Nótese el uso de compuestos de esta invención para el control de *Bemisia argentifolii*. Nótese el uso de compuestos de esta invención para el control de *Frankliniella occidentalis*. Nótese el uso de compuestos de esta invención para controlar *Empoasca fabae*. Nótese el uso de compuestos de esta invención para controlar *Peregrinus maidis*. Nótese el uso de compuestos de esta invención para controlar *Aphis gossypii*. Nótese el uso de compuestos de esta invención para controlar *Myzus persicae*. Nótese el uso de compuestos de esta invención para controlar *Plutella xylostella*. Nótese el uso de compuestos de esta invención para controlar *Spodoptera frugiperda*.

Los compuestos usados de acuerdo con esta invención también pueden mezclarse con uno o más compuestos o agentes biológicamente activos incluyendo insecticidas, fungicidas, nematicidas, bactericidas, acaricidas, reguladores del crecimiento tales como estimuladores del enraizamiento, quimioesterilizantes, semioquímicos, repelentes, atrayentes, feromonas, estimuladores de la alimentación, otros compuestos biológicamente activos o bacterias entomopatógenas, virus u hongos para formar un pesticida de múltiples componentes que proporcione un espectro incluso más amplio de utilidad agrícola. Así, la presente invención se refiere también a una composición que comprende una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto de Fórmula 1, un N-óxido del mismo, o una sal agronómica o no agronómica adecuada del mismo, y una cantidad eficaz de al menos un compuesto o agente biológicamente activo adicional, y puede comprender además al menos uno de un tensoactivo, un diluyente sólido o un diluyente líquido. Los otros compuestos o agentes biológicamente activos también pueden formularse separadamente en composiciones que comprenden al menos uno de un tensoactivo y un diluyente sólido o líquido. Para mezclas de la presente invención, se pueden formular los otros compuestos o agentes biológicamente activos junto con los presentes compuestos, incluyendo los compuestos de la fórmula 1, para formar una premezcla o los otros compuestos o agentes biológicamente activos se pueden formular por separado de los presentes compuestos, incluyendo los compuestos de la fórmula 1, y las dos formulaciones combinadas antes de la aplicación (por ejemplo, en un tanque de pulverización) o, alternativamente, aplicados de forma sucesiva.

Otros compuestos o agentes biológicamente activos en las composiciones de la presente invención se pueden seleccionar de agentes de control de plagas de invertebrados que tienen un modo diferente de acción o una clase química diferente de moduladores del canal de sodio, inhibidores de colinesterasa, neonicotinoides, lactonas macrocíclicas insecticidas, bloqueadores del canal de cloruro regulado por GABA (ácido γ -aminobutírico), inhibidores de la síntesis de quitina, mímicos de la hormona juvenil, ligandos del receptor de octopamina, agonistas de ecdisona, ligandos del receptor de rianodina, análogos de nereistoxina, inhibidores del transporte de electrones mitocondriales, inhibidores de la biosíntesis de lípidos, insecticidas ed ciclodienos, inhibidores de la muda y agentes biológicos que incluyen nucleopolihedrovirus (NPV), un miembro de *Bacillus thuringiensis*, una delta-endotoxina encapsulada de *Bacillus thuringiensis* y un insecticida viral natural o genéticamente modificado. Nótese una composición de la presente invención, en donde al menos un compuesto o agente adicional biológicamente activo está seleccionado de insecticidas del grupo que consiste en moduladores del canal de sodio, inhibidores de colinesterasa, neonicotinoides, lactonas macrocíclicas insecticidas, bloqueadores del canal de cloruro regulado por GABA, inhibidores de la síntesis de quitina, mímicos de la hormona juvenil, ligandos del receptor de octopamina, agonistas de ecdisona, ligandos del receptor de rianodina, análogos de nereistoxina, inhibidores del transporte de electrones mitocondriales, inhibidores de la biosíntesis de lípidos, insecticidas de ciclodienos, inhibidores de la muda, nucleopolihedrovirus, un miembro de *Bacillus thuringiensis*, una delta-endotoxina encapsulada de *Bacillus thuringiensis* y un insecticida viral natural o genéticamente modificado.

Nótese en particular los compuestos o agentes biológicamente activos adicionales seleccionados de insecticidas del grupo que consiste en moduladores del canal de sodio, inhibidores de colinesterasa, neonicotinoides, lactonas macrocíclicas insecticidas, bloqueadores del canal de cloruro regulado por GABA, inhibidores de la síntesis de quitina, mímicos de la hormona juvenil, ligandos del receptor de octopamina, agonistas de ecdisona, ligandos del receptor de rianodina, análogos de nereistoxina, inhibidores del transporte de electrones mitocondriales, inhibidores de la biosíntesis de lípidos, insecticida de ciclodieno, nucleopolihedrovirus; un miembro de *Bacillus thuringiensis*, una delta-endotoxina encapsulada de *Bacillus thuringiensis*; y un insecticida viral natural o genéticamente modificado.

También nótese compuestos o agentes biológicamente activos adicionales seleccionados de insecticidas del grupo que consiste en piretroides, carbamatos, neonicotinoides, bloqueadores neuronales del canal de sodio, lactonas macrocíclicas insecticidas, antagonistas de ácido γ -aminobutírico, ureas insecticidas y mimicos de la hormona juvenil, un miembro de *Bacillus thuringiensis*, una delta-endotoxina de *Bacillus thuringiensis*, y un insecticida viral natural o genéticamente modificado.

Ejemplos de tales compuestos o agentes biológicamente activos con los que se pueden formular los compuestos de esta invención son: insecticidas tales como abamectina, acefato, acetamiprida, amidoflomet (S-1955), avermectina, azadiractina, azinfos-metilo, bifentrina, binfenazato, buprofezina, carbofurano, clorfenapir, clorfluazuron, clorpirifós, metilclorpirifós, cromafenoza, clotianidina, ciflutrina, beta-ciflutrina, cihalotrina, lambda-cihalotrina, cipermetrina, ciromazina, deltametrina, diafenthiurón, diazinón, diflubenzurón, dimetoato, diofenolano, emamectina, endosulfano, esfenvalerato, etiprol, fenotiocarb, fenoxicarb, fenpropatrina, fenproximato, fenvalerato, fipronil, flonicamida, flucitrinato, flufenimer, tau-fluvalinato, flufenoxurón, fonofos, halofenozida, hexaflumurón, imidacloprida, indoxacarb, isofenfos, lufenurón, malation, metaldehído, metamidofos, metidatió, metomilo, metopreno, metoxicloro, monocrotofos, metoxifenozida, nitiazina, novalurón, noviflumurón, oxamilo, paration, metilparation, permetrina, forato, fosadona, fosmet, fosfamidón, pirimicarb, profenofos, pimetrozina, piridililo, piriproxifén, rotenona, spinosad, spiromesifen, sulprofos, tebufenozida, teflubenzurón, teflutrina, terbufos, tetraclorvinfos, tiacloprida, tiametoxam, tiodicarb, tiosultap de sodio, tralometrina, triclofon y triflururón; proflutrina, protrifenbute, pimetrozina, pirafuprol, piretrina, piridililo, pirifluquinazona, piriprol, piriproxifeno, rotenona, rianodina, espinetoram, espinosad, espiroclorfen, espiromesifeno (BSN 2060), espirotetramato, sulprofos, tebufenozida, teflubenzurona, teflutrina, terbufos, tetraclorvinfos, tiacloprida, tiametoxam, tiodicarb, tiosultap-sodio, tolfenpirad, tralometrina, triazamato, triclofona y trifluinurona; fungicidas tales como acibenzolar, aldimorf, amisulbrom, azaconazol, azoxistrobina, benalaxilo, benomilo, bentiavalicarb, bentiavalicarb-isopropilo, binomial; bifenilo, bitertanol, blastidina-S, mezcla de Bordeaux (sulfato de cobre tribásico), boscalida/nicobifen, bromconazol, bupirimate, butiobate, carboxina, carpropamida, captafol, captano, carbendazim, cloroneb, clortalonilo, clozolinato, clotrimazol, oxiclورو de cobre, sales de cobre tales como sulfato de cobre e hidróxido de cobre, ciazofamida, ciflunamida, cimoxanilo, ciproconazol, ciprodinilo, diclofluanida, diclocimet, diclomezina, diclorano, dietofencarb, difenoconazol, dimetomorf, dimoxistrobina, diniconazol, diniconazol-M, dinocap, discostrobina, ditianona, dodemorf, dodina, econazol, etaconazol, ediferfos, epoxiconazol, etaboxam, etirimol, etridiazol, famoxadona, fenamidona, fenarimol, fenbuconazol, fencaramida, fenfuram, fenhexamida, fenoxanilo, fenpiclonilo, fenpropidina, fenpropimorf, acetato de fentina, hidróxido de fentina, ferbam, ferfurazoato, ferimzona, fluazinam, fludioxonilo, flumetover, fluopicolida, fluoxastrobina, fluquinconazol, fluquinconazol, flusilazol, flusulfamida, flutolanilo, flutriafol, folpet, fosetil-aluminio, fuberidazol, furalaxilo, furametapir, hexaconazol, himexazol, guazatina, imazalilo, imibenconazol, iminoctadina, iodicarb, ipconazol, iprobenfos, iprodiona, iprovalicarb, isoconazol, isoprotiolano, kasugamicina, kresoxim-metilo, mancozeb, mandipropamida, maneb, mapanipirina, mefenoxam, mepronilo, metalaxilo, metconazol, metasulfocarb, metiram, metominostrobina/fenominostrobina, mepanipirim, metrafenona, miconazol, miclobutanilo, neo-asozina (metanarsonato férrico), nuarimol, octilina, ofurace, orisastrobina, oxadixilo, ácido oxolínico, oxpoconazol, oxicarboxina, paclobutrazol, penconazol, penciclorona, pentiopirad, perfurazoato, ácido fosfónico, ftalida, picobenzamida, picoxistrobina, polioxina, probenazol, procloraz, procimidona, propamocarb, hidrocloreuro de propamocarb, propiconazol, propineb, proquinazida, protioconazol, piraclostrobina, priazofos, pirifenox, pirimetanilo, pirifenox, pirilnitrina, piroquinona, quinconazol, quinoxifeno, quintozone, siltiofam, simeconazol, espiroxamina, estreptomycin, azufre, tebuconazol, tetraceno, tefloftalam, tecnaceno, tetraconazol, tiabendazol, tifulazamida, tiofanato, tiofanato-metilo, tiram, tiadinilo, tolclorfen-metilo, tolfenurona, triadimefona, triadimenol, triarimol, triazóxido, tridemorf, trimorfamida, tricloclazol, trifloxistrobina, triforina, triticonazol, uniconazol, validamicina, vinclozolina, zineb, ziram, y zoxamida; nematocidas tales como aldicarb, imiciafos, oxamilo y fenamifos; bactericidas tales como estreptomycin; acaricidas tales como amitraz, quinometionato, clorobencilato, cihexatina, dicofol, dienoclor, etoxazol, fenazaquina, óxido de fenbutatina, fenpropatrina, fenpiroximato, hexitiazox; propargita, piridabeno y tebufenpirad; y agentes biológicos incluyendo bacterias entomopatógenas, tales como *Bacillus thuringiensis* subesp. *aizawai*, *Bacillus thuringiensis* subesp. *kurstaki*, y las delta-endotoxinas encapsuladas de *Bacillus thuringiensis* (p. ej., Cellcap, MPV, MPVII); hongos entomopatógenos, tales como el hongo verde de la muscardina; y virus entomopatógenos incluyendo baculovirus, nucleopolihedrovirus (NPV) tales como *Helicoverpa zea* nucleopolihedrovirus (HzNPV), *Anagrapha falcifera* nucleopolihedrovirus (AfNPV); y virus de granulosis (GV) tales como virus de granulosis *Cydia pomonella* (CpGV).

Los compuestos de esta invención y sus composiciones se pueden aplicar a plantas genéticamente transformadas para expresar proteínas tóxicas para plagas de invertebrados (tales como delta-endotoxinas de *Bacillus thuringiensis*). El efecto de los compuestos de control de plagas de invertebrados de esta invención aplicados de forma exógena puede ser sinérgico con las proteínas toxinas expresadas.

Referencias generales para protectores agrícolas (es decir, insecticidas, fungicidas, nematocidas, acaricidas, herbicidas y agentes biológicos) incluyen The Pesticide Manual, 13ª Edición, C. D. S. Tomlin, Ed., British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, Reino Unido, 2003 y The BioPesticide Manual, 2ª Edición, L. G. Copping, Ed., British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, Reino Unido, 2001.

Es de destacar una composición de la presente invención en la que el componente, es decir, el al menos un agente biológicamente activo comprende un agente biológicamente activo seleccionado del grupo que consiste en abamectina, acefato, acetamiprid, acetoprol, aldicarb, amidoflomet, amitraz, avermectina, azadiractina, azinfos-

metilo, bifentrín, bifenazato, bistriflurón, buprofezin, carbofurano, cartap, quinometionat, clorfenapir, clorfluazurón, clorpirifos, clorpirifos-metilo, clorobencilato, cromafenozida, clotianidina, ciflometofen, ciflutrina, beta-ciflutrina, cihalotrina, gamma-cihalotrina, lambda-cihalotrina, cihexatin, cipermetrina, ciromazina, deltametrina, diafenthiurón, diazinón, dicofol, dieldrin, dienoclor, diflubenzurón, dimeflutrina, dimetoato, dinotefurano, diofenolano, emamectina, endosulfán, esfenvalerato, etiprol, etoxazol, fenamifos, fenazaquin, fenbutatin óxido, fenotiocarb, fenoxicarb, fenpropatrina, fenpiroximato, fenvalerato, fipronil, flonicamid, flucitrinato, tau-fluvalinato, flufenimer, flufenoxurón, fonofos, halofenozida, hexaflumurón, hexitiazox, hidrametilnón, imiciafos, imidacloprid, indoxacarb, isofenfos, lufenurón, malation, metaflumizona, metaldehído, metamidofos, metidation, metomilo, metopreno, metoxiclor, metoxifeno, metoflutrina, monocrotofos, nitenpiram, nitiazina, novalurón, noviflumurón, oxamilo, paratión, paratión-metilo, permectrina, forato, fosalón, fosmet, fosfamidón, pirimicarb, profenofos, proflutrina, propargita, protrifenbute, pimetozina, pirafluprol, piretrina, piridabén, piridailo, pirifluquinazón, piriprol, piriproxifeno, rotenona, rianodina, espinetoram, espinosad, espiridiclofen, espiromesifeno, espirotetramat, sulprofos, tebufenozida, tebufenpirad, teflubenzurón, teflutrina, terbufos, tetraclorvinfos, tiacloprid, tiametoxam, tiodicarb, tiosultap-sodio, tolfenpirad, tralometrina, triazamato, tricloflorón, triflumurón, *Bacillus thuringiensis* subesp. *aizawai*, *Bacillus thuringiensis* subesp. *kurstaki*, nucleopolihedrovirus, una delta-endotoxina encapsulada de *Bacillus thuringiensis*, baculovirus, bacterias entomopatógenas, virus entomopatógenos y hongos entomopatógenos.

También se puede destacar una composición en la que el al menos otro agente biológicamente activo se selecciona de abamectina, acetamiprid, amitraz, avermectina, azadiractina, bifentrín, buprofezin, cartap, clorfenapir, clorpirifos, clotianidina, ciflutrina, beta-ciflutrina, cihalotrina, lambda-cihalotrina, cipermetrina, ciromazina, deltametrina, dieldrin, dinotefurano, diofenolano, emamectina, endosulfán, esfenvalerato, etiprol, fenotiocarb, fenoxicarb, fenvalerato, fipronil, flonicamid, flufenoxurón, hexaflumurón, hidrametilnón, imidacloprid, indoxacarb, lufenurón, metaflumizona, metomilo, metopreno, metoxifeno, nitenpiram, nitiazina, novalurón, oxamilo, pimetozina, piretrina, piridabén, piridailo, piriproxifeno, rianodina, espinetoram, espinosad, espiridiclofen, espiromesifeno, tebufenozida, tiacloprid, tiametoxam, tiodicarb, tiosultap-sodio, tralometrina, triazamato, triflumurón, *Bacillus thuringiensis* subesp. *aizawai*, *Bacillus thuringiensis* subesp. *kurstaki*, nucleopolihedrovirus, y una delta-endotoxina encapsulada de *Bacillus thuringiensis*.

Para formas de realización en las que se usan uno o varios de estos pares de mezcla, la relación en peso de estos diversos pares de mezcla (en total) al compuesto de la fórmula 1 está típicamente entre aproximadamente 1:3000 y aproximadamente 3000:1. Son de importancia relaciones en peso entre aproximadamente 1:300 y aproximadamente 300:1 (por ejemplo relaciones entre aproximadamente 1:30 y aproximadamente 30:1). Un experto en la técnica puede determinar con facilidad a través de simple experimentación las cantidades biológicamente efectivas de ingredientes activos necesarios para el espectro deseado de actividad biológica. Será evidente que el incluir estos componentes adicionales puede expandir el espectro de plagas de invertebrados controladas más allá del espectro controlado por el compuesto de la fórmula 1 solo.

En ciertas instancias, las combinaciones de un compuesto de esta invención con otros compuestos biológicamente activos (en particular, control de plagas de invertebrados) o agentes (es decir, ingredientes activos) pueden dar como resultado un efecto más que aditivo (es decir, sinérgico). Siempre es deseable poder reducir la cantidad de agentes químicos liberados en el medio ambiente al tiempo que se asegure un control de las plagas eficaz. Cuando la sinergia de ingredientes activos de control de plagas de invertebrados se produce con tasas de aplicación que dan niveles agrónomicamente satisfactorios de control de plagas de invertebrados, tales combinaciones pueden ser ventajosas para reducir el costo de producción de cultivos y reducir la carga ambiental.

Se ha de notar una combinación de un compuesto de la fórmula 1 con al menos otro ingrediente activo de control de plagas de invertebrados. Se ha de notar en particular tal combinación en la que el otro ingrediente activo de control de plagas de invertebrados tiene un sitio diferente de acción del compuesto de la fórmula 1. En ciertos casos, serán particularmente ventajosas para el control de la resistencia combinaciones con otros ingredientes activos para el control de plagas de invertebrados que tengan un espectro de control similar pero diferente modo de acción. De esta forma, las composiciones de la presente invención pueden comprender además una cantidad biológicamente eficaz de al menos un compuesto o agente de control de plagas adicional que tiene un espectro de control similar pero un modo de actuación diferente. Poner en contacto una planta modificada genéticamente para expresar un compuesto de protección de plantas (por ejemplo, proteína) o el locus de la planta con una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto de la invención puede proporcionar también un espectro más amplio de protección de plantas y ser ventajoso para el manejo de la resistencia.

La Tabla A enumera las combinaciones específicas del compuesto de Fórmula 1 con otro agente de control de plagas de invertebrados ilustrativo de la mezclas, composiciones y métodos de la presente invención. La segunda columna de la Tabla A enumera el agente de control de plagas de invertebrados específico (por ejemplo, "Acetamiprid" en la primera línea). La segunda columna de la Tabla A enumera el modo de acción (de ser conocido) o clase química de los agentes de control de plagas de invertebrados. La tercera columna de la Tabla A enumera formas de realización de rangos de relaciones en peso en los que el agente de control de plagas de invertebrados se pueden aplicar respecto a un compuesto de la fórmula 1, uno de sus *N*-óxidos, o sus sales, (por ejemplo, "50:1 a 1:50" de abamectina respecto de un compuesto de la fórmula 1 en peso).

- 5 Así, por ejemplo, la primera línea de la Tabla A revela específicamente la combinación de un compuesto de la fórmula 1 con abamectina se puede aplicar en una relación en peso entre 0:1 a 1:50. Las demás líneas de la Tabla A se han de construir de modo similar. También se ha de notar que la Tabla A enumera combinaciones específicas de un compuesto de la fórmula 1 con otros agentes de control de plagas de invertebrados ilustrativos de las mezclas, composiciones y métodos de la presente invención e incluye formas de realización adicionales de rangos de relaciones en peso para tasas de aplicación.

Tabla A

Agente de control de plagas de invertebrados	Modo de acción o clase química	Relación en peso típica
Abamectina	lactonas macrocíclicas	50:1 a 1:50.
acetamiprid	neonicotinoides	entre 150:1 y 1:200
Amitraz	ligandos de receptores de octopamina	entre 200:1 y 1:100
Avermectina	lactonas macrocíclicas	entre 50:1 y 1:50
Azadiractina	agonistas de ecdisona	entre 100:1 y 1:120
Beta-ciflutrina	moduladores del canal de sodio	entre 150:1 y 1:200
Bifentrina	moduladores del canal de sodio	entre 100:1 y 1:10
Buprofezina	inhibidores de la síntesis de quitina	entre 500:1 y 1:50
Cartap	análogos de nereistoxina	entre 100:1 y 1:200
Clorantraniliprol	ligandos del receptor de rianodina	entre 100:1 y 1:120
Clorfenapir	inhibidores del transporte de electrones mitocondriales	entre 300:1 y 1:200
Clorpirifos	inhibidores de la colinesterasa	entre 500:1 y 1:200
clotianidina	neonicotinoides	entre 100:1 y 1:400
Ciflutrina	moduladores del canal de sodio	entre 150:1 y 1:200
Cihalotrina	moduladores del canal de sodio	entre 150:1 y 1:200
Cipermetrina	moduladores del canal de sodio	entre 150:1 y 1:200
Ciromazina	inhibidores de la síntesis de quitina	entre 400:1 y 1:50
Deltametrina	moduladores del canal de sodio	entre 50:1 y 1:400
Dieldrina	insecticidas de ciclodieno	entre 200:1 y 1:100
dinotefurano	neonicotinoides	entre 150:1 y 1:200
Diofenolano	inhibidor de moho	entre 150:1 y 1:200
Emamectina	lactonas macrocíclicas	entre 50:1 y 1:10

Agente de control de plagas de invertebrados	Modo de acción o clase química	Relación en peso típica
Endosulfano	insecticidas de ciclodieno	entre 200:1 y 1:100
Esfenvalerato	moduladores del canal de sodio	entre 100:1 y 1:400
Etiprol	bloqueadores del canal de cloruro regulado por GABA	200:1 a 1:100
Fenotiocarb		entre 150:1 y 1:200
Fenoxicarb	mímicos de la hormona juvenil	entre 500:1 y 1:100
Fenvalerato	moduladores del canal de sodio	entre 150:1 y 1:200
Fipronilo	bloqueadores del canal de cloruro regulado por GABA	entre 150:1 y 1:100
Flonicamida		entre 200:1 y 1:100
Flubendiamida	ligandos del receptor de rianodina	entre 100:1 y 1:120
Flufenoxurona	inhibidores de la síntesis de quitina	entre 200:1 y 1:100
Hexaflumurona	inhibidores de la síntesis de quitina	entre 300:1 y 1:50
Hidrametilnona	inhibidores del transporte de electrones mitocondriales	entre 150:1 y 1:250
Imidacloprid	neonicotinoides	entre 1000:1 y 1:1000
Indoxacarb	moduladores del canal de sodio	entre 200:1 y 1:50
Lambda-cihalotrina	moduladores del canal de sodio	entre 50:1 y 1:250
Lufenurona	inhibidores de la síntesis de quitina	entre 500:1 y 1:250
Metaflumizona		entre 200:1 y 1:200
Metomilo	inhibidores de la colinesterasa	entre 500:1 y 1:100
Metoprene	mímicos de la hormona juvenil	entre 500:1 y 1:100
Metoxifenoazida	agonistas de ecdisona	entre 50:1 y 1:50
nitenpiram	neonicotinoides	entre 150:1 y 1:200
nitiazina	neonicotinoides	entre 150:1 y 1:200
Novalurona	inhibidores de la síntesis de quitina	entre 500:1 y 1:150
Oxamilo	inhibidores de la colinesterasa	entre 200:1 y 1:200

Agente de control de plagas de invertebrados	Modo de acción o clase química	Relación en peso
Pimetrozina		entre 200:1 y 1:100
Piretrina	moduladores del canal de sodio	entre 100:1 y 1:10
Piridabeno	inhibidores del transporte de electrones mitocondriales	entre 200:1 y 1:100
Piridailo		entre 200:1 y 1:100
Piriproxifeno	mímicos de la hormona juvenil	entre 500:1 y 1:100
Rianodina	ligandos del receptor de rianodina	entre 100:1 y 1:120
Espinetoram	lactonas macrocíclicas	entre 150:1 y 1:100
Espinosad	lactonas macrocíclicas	entre 500:1 y 1:10
Espirodiclofeno	inhibidores de la biosíntesis de lípidos	entre 200:1 y 1:200
Espiromesifeno	inhibidores de la biosíntesis de lípidos	entre 200:1 y 1:200
Tebufenozida	agonistas de ecdisona	entre 500:1 y 1:250
Tiacloprida	neonicotinoides	entre 100:1 y 1:200
tiametoxam	neonicotinoides	entre 1250:1 y 1:1000
Tiodicarb	inhibidores de la colinesterasa	entre 500:1 y 1:400
Tiosultap-sodio		entre 150:1 y 1:100
Tralometrina	moduladores del canal de sodio	entre 150:1 y 1:200
Triazamato	inhibidores de la colinesterasa	entre 250:1 y 1:100
Triflumurona	inhibidores de la síntesis de quitina	entre 200:1 y 1:100
<i>Bacillus thuringiensis</i>	agentes biológicos	entre 50:1 y 1:10
Delta-endotoxina de <i>Bacillus thuringiensis</i>	agentes biológicos	entre 50:1 y 1:10
NPV (por ejemplo, Gemstar)	agentes biológicos	entre 50:1 y 1:10

Una forma de realización de agentes de control de plagas de invertebrados (por ejemplo, insecticidas y acaricidas) para mezclar con compuestos de esta invención incluyen moduladores del canal de sodio tales como bifentrina, cipermetrina, cihalotrina, lambda-cihalotrina, ciflutrina, beta-ciflutrina, deltametrina, dimeflutrina, esfenvalerato, fenvalerato, indoxacarb, metoflutrina, proflutrina, piretrina y tralometrina; agentes inhibidores de la colinesterasa tales como clorpirifos, metomilo, oxamilo, tiodicarb y triazamato; neonicotinoides tales como acetamiprid, clotianidina, dinotefurano, imidacloprid, nitenpiram, nitiazina, tiacloprid y tiametoxam; lactonas macrocíclicas insecticidas tales como espinetoram, espinosad, abamectina, avermectina y emamectina; agentes bloqueantes del canal del cloruro regulados por el GABA (ácido γ -aminobutírico) tales como endosulfán, etiprol y fipronil; agentes inhibidores de la

5 síntesis de la quitina tales como buprofezin, ciromazina, flufenoxurón, hexaflumurón, lufenurón, novalurón, noviflumurón y triflumurón; agentes miméticos de las hormonas juveniles tales como diofenolán, fenoxicarb, metopreno y piriproxifén; ligandos de los receptores de la octopamina tales como amitraz; agentes agonistas de ecdisona tales como azadiractina, metoxifenoazida y tebufenoazida; ligandos del receptor de rianodina tales como rianodina, diamidas antranílicas tales como clorantraniliprol (ver la patente U.S. 6.747.047, publicaciones PCT WO 2003/015518 y WO 2004/067528) y flubendiamida (ver la patente U.S. 6.603.044); análogos de la nereistoxina tales como cartap; agentes inhibidores del transporte de electrones en las mitocondrias tales como clorfenapir, hidrametilnón y piridabén; agentes inhibidores de la biosíntesis tales como espiroclorfenol y espiromesifeno; insecticidas ciclodienicos tales como dieldrín; ciflometofén; fenotiocarb; flonicamid; metaflumizona; pirafluprol; piridallilo; piriprol; pimetrozina; espirotetramat; y tiosultap-sodio. Una forma de realización de agentes biológicos para 10 mezclar con compuestos de esta invención incluyen nucleopolihedrovirus tales como HzNPV y AfNPV; *Bacillus thuringiensis* y delta-endotoxinas encapsuladas de *Bacillus thuringiensis* tales como Cellcap, MPV y MPVII; así como insecticidas víricos naturales y genéticamente modificados incluyendo miembros de la familia de los Baculoviridae así como hongos entomófagos. Se ha de notar la composición de la presente invención en donde al menos un 15 compuesto o agente adicional biológicamente activo está seleccionado de agentes de control de plagas de invertebrados enumerados en la anterior Tabla A. También se ha de notar la composición de la presente invención en donde al menos un compuesto o agente adicional biológicamente activo está seleccionado del grupo que consiste en cipermetrina, cihalotrina, ciflutrina, beta-ciflutrina, esfenvalerato, fenvalerato, tralometrina, fenotiocarb, metomilo, oxamilo, tiodicarb, acetamiprida, clotianidina, imidacloprid, tiametoxam, tiacloprid, indoxacarb; espinosad, abamectina, avermectina, eniamectina, endosulfano, etiprol, fipronilo, flufenoxurona, triflumurona, diofenolano, piriproxifeno, pimetrozina, amitraz, *Bacillus thuringiensis* *aisawai*, *Bacillus thuringiensis* *kurstaki*, delta endotoxina de *Bacillus thuringiensis* y hongos entomófagos. 20

La relaciones en peso de estos diversos modelos de mezcla respecto al compuesto de Fórmula 1, un N-óxido o sus sales de esta invención están típicamente entre 1000:1 y 1:1000, siendo con una realización entre 500:1 y 1:500, 25 siendo con otra realización entre 250:1 y 1:200 y siendo con otra realización entre 100:1 y 1:50.

Se enumeran más abajo en la Tabla B formas de realización de composiciones específicas que comprenden un compuesto de la fórmula 1 (los números de compuestos se refieren a compuestos en las tablas de índice A-C) y un agente adicional de control de plagas de invertebrados.

Tabla B

Mezcla Nro.	Comp. Nro.	y	Agente de control de plagas de invertebrados	Mezcla Nro.	Comp. Nro.	y	Agente de control de plagas de invertebrados
A-1	1	y	Abamectina	B-1	2	y	Abamectina
A-2	1	y	acetamiprid	B-2	2	y	acetamiprid
A-3	1	y	Amitraz	B-3	2	y	Amitraz
A-4	1	y	Avermectina	B-4	2	y	Avermectina
A-5	1	y	Azadiractina	B-5	2	y	Azadiractina
A-6	1	y	Beta-ciflutrina	B-6	2	y	Beta-ciflutrina
A-7	1	y	Bifentrina	B-7	2	y	Bifentrina
Mezcla Nro.	Comp. Nro.	y	Agente de control de plagas de invertebrados	Mezcla Nro.	Comp. Nro.	y NO.	Agente de control de plagas de invertebrados
A-8	1	y	Buprofezina	B-8	2	y	Buprofezina
A-9	1	y	Cartap	B-9	2	y	Cartap
A-10	1	y	Clorantraniliprol	B-10	2		y Clorantraniliprol
A-11	1	y	Clorfenapir	B-11	2	y	Clorfenapir

Mezcla Nro.	Comp. Nro.	y	Agente de control de plagas de invertebrados	Mezcla Nro.	Comp.	y NO.	Agente de control de plagas de invertebrados
A-12	1	y	Clorpirifos	B-12	2	y	Clorpirifos
A-13	1	y	clotianidin	B-13	2	y	clotianidin
A-14	1	y	Ciflutrina	B-14 2		y	Ciflutrina
A-15	1	y	Cihalotrina	B-15	2	y	Cihalotrina
A-16	1	y	Cipermetrina	B-16	2	y	Cipermetrina
A-17	1	y	Ciromazina	B-17	2	y	Ciromazina
A-18	1	y	Deltametrina	B-18	2	y	Deltametrina
A-19	1	y	Dieldrina	B-19	2	y	Dieldrina
A-20	1	y	dinotefurano	B-20	2	y	dinotefurano
A-21	1	y	Diofenolano	B-21	2	y	Diofenolano
A-22	1	y	Emamectina	B-22	2	y	Emamectina
A-23	1	y	Endosulfano	B-23	2	y	Endosulfano
A-24 1		y	Esfenvalerato	B-24	2	y	Esfenvalerato
A-25	1	y	Etiprol	B-25	2	y	Etiprol
A-26	1	y	Fenotiocarb	B-26	2	y	Fenotiocarb
A-27	1	y	Fenoxicarb	B-27	2	y	Fenoxicarb
A-28	1	y	Fenvalerato	B-28	2	y	Fenvalerato
A-29	1	y	Fipronilo	B-29	2	y	Fipronilo
A-30	1	y	Flonicamida	B-30	2	y	Flonicamida
A-31	1	y	Flubendiamida	B-31	2	y	Flubendiamida
A-32	1	y	Flufenoxurona	B-32	2	y	Flufenoxurona
A-33	1	y	Hexaflumurona	B-33	2	y	Hexaflumurona
A-34	1	y	Hidrametilnona	B-34	2	y	Hidrametilnona
A-35	1	y	Imidacloprid	B-35	2	y	Imidacloprid
A-36	1	y	Indoxacarb	B-36	2	y	Indoxacarb
A-37	1	y	Lambda-cihalotrina	B-37	2	y	Lambda-cihalotrina

Mezcla Nro.	Comp. Nro.	y	Agente de control de plagas de invertebrados	Mezcla Nro.	Comp.	y NO.	Agente de control de plagas de invertebrados
A-38	1	y	Lufenurona	B-38	2	y	Lufenurona
A-39	1	y	Metaflumizona	B-39	2	y	Metaflumizona
A-40	1	y	Metomilo	B-40	2	y	Metomilo
A-41	1	y	Metoprene	B-41	2	y	Metoprene
A-42	1	y	Metoxifenozida	B-42	2	y	Metoxifenozida
A-43	1	y	nitenpiram	B-43	2	y	nitenpiram
A-44	1	y	nitiazina	B-44	2	y	nitiazina
Mezcla Nro.	Comp. Nro.	y	Agente de control de plagas de invertebrados	Mezcla Nro.	Comp.	y Nro.	Agente de control de plagas de invertebrados
A-45	1	y	Novalurona	B-45	2	y	Novalurona
A-46	1	y	Oxamilo	B-46	2	y	Oxamilo
A-47	1	y	Pimetrozina	B-47	2	y	Pimetrozina
A-48	1	y	Piretrina	B-48	2	y	Piretrina
A-49	1	y	Piridabeno	B-49	2	y	Piridabeno
A-50 1		y	Piridalilo	B-50	2	y	Piridalilo
A-51	1	y	Piriproxifeno	B-51	2	y	Piriproxifeno
A-52	1	y	Rianodina	B-52	2	y	Rianodina
A-53	1	y	Espinetoram	B-53	2	y	Espinetoram
A-54	1	y	Espinosad	B-54	2	y	Espinosad
A-55	1	y	Espirodiclofeno	B-55	2	y	Espirodiclofeno
A-56	1	y	Espiromesifeno	B-56	2	y	Espiromesifeno
A-57	1	y	Tebufenozida	B-57	2	y	Tebufenozida
A-58	1	y	Tiacloprida	B-58	2	y	Tiacloprida
A-59	1	y	tiametoxam	B-59	2	y	tiametoxam
A-60	1	y	Tiodicarb	B-60	2	y	Tiodicarb
A-61	1	y	Tiosultap-sodio	B-61	2	y	Tiosultap-sodio

Mezcla Nro.	Comp. Nro.	y	Agente de control de plagas de invertebrados	Mezcla Nro.	Comp.	y Nro.	Agente de control de plagas de invertebrados
A-62	1	y	Tralometrina	B-62	2	y	Tralometrina
A-63	1	y	Triazamato	B-63	2	y	Triazamato
A-64	1	y	Triflumurona	B-64	2	y	Triflumurona
A-65	1	y	<i>Bacillus thuringiensis</i>	B-65	2	y	<i>Bacillus thuringiensis</i>
A-66	1	y	Delta-endotoxina de <i>Bacillus thuringiensis</i>	B-66	2	y	Delta-endotoxina de <i>Bacillus thuringiensis</i>
A-67	1	y	NPV (por ejemplo, Gemstar)	B-67	2	y	NPV (por ejemplo, Gemstar)
C-1	101	y	Abamectina	D-1	104	y	Abamectina
C-2	101	y	acetamiprid	D-2	104	y	acetamiprid
C-3	101	y	Amitraz	D-3	104	y	Amitraz
C-4	101	y	Avermectina	D-4	104	y	Avermectina
C-5	101	y	Azadiractina	D-5	104	y	Azadiractina
C-6	101	y	Beta-ciflutrina	D-6	104	y	Beta-ciflutrina
C-7	101	y	Bifentrina	D-7	104	y	Bifentrina
C-8	101	y	Buprofezina	D-8	104	y	Buprofezina
C-9	101	y	Cartap	D-9	104	y	Cartap
C-10	101	y	Clorantraniliprol	D-10	104	y	Clorantraniliprol
C-11	101	y	Clorfenapir	D-11	104	y	Clorfenapir
C-12	101	y	Clorpirifos	D-12	104	y	Clorpirifos
C-13	101	y	clotianidin	D-13	104	y	clotianidin
C-14	101	y	Ciflutrina	D-14	104	y	Ciflutrina
C-15	101	y	Cihalotrina	D-15	104	y	Cihalotrina
C-16	101	y	Cipermetrina	D-16	104	y	Cipermetrina
C-17	101	y	Ciromazina	D-17	104	y	Ciromazina
C-18	101	y	Deltametrina	D-18	104	y	Deltametrina
C-19	101	y	Dieldrina	D-19	104	y	Dieldrina

Mezcla Nro.	Comp. Nro.	y	Agente de control de plagas de invertebrados	Mezcla Nro.	Comp. y Nro.	Agente de control de plagas de invertebrados
C-20	101	y	dinotefurano	D-20	104 y	dinotefurano
C-21	101	y	Diofenolano	D-21	104 y	Diofenolano
C-22	101	y	Emamectina	D-22	104 y	Emamectina
C-23	101	y	Endosulfano	D-23	104 y	Endosulfano
C-24	101	y	Esfenvalerato	D-24	104 y	Esfenvalerato
C-25	101	y	Etiprol	D-25	104 y	Etiprol
C-26	101	y	Fenotiocarb	D-26	104 y	Fenotiocarb
C-27	101	y	Fenoxicarb	D-27	104 y	Fenoxicarb
C-28	101	y	Fenvalerato	D-28	104 y	Fenvalerato
C-29	101	y	Fipronilo	D-29	104 y	Fipronilo
C-30	101	y	Flonicamida	D-30	104 y	Flonicamida
C-31	101	y	Flubendiamida	D-31	104 y	Flubendiamida
C-32	101	y	Flufenoxurona	D-32	104 y	Flufenoxurona
C-33	101	y	Hexaflumurona	D-33	104 y	Hexaflumurona
C-34	101	y	Hidrametilnona	D-34	104 y	Hidrametilnona
C-35	101	y	Imidacloprid	D-35	104 y	Imidacloprid
C-36	101	y	Indoxacarb	D-36	104 y	Indoxacarb
C-37	101	y	Lambda-cihalotrina	D-37	104 y	Lambda-cihalotrina
C-38	101	y	Lufenurona	D-38	104 y	Lufenurona
C-39	101	y	Metaflumizona	D-39	104 y	Metaflumizona
C-40	101	y	Metomilo	D-40	104 y	Metomilo
C-41	101	y	Metoprene	D-41	104 y	Metoprene
C-42	101	y	Metoxifenoazida	D-42	104 y	Metoxifenoazida
C-43	101	y	nitenpiram	D-43	104 y	nitenpiram
C-44	101	y	nitiazina	D-44	104 y	nitiazina
C-45	101	y	Novalurona	D-45	104 y	Novalurona

Mezcla Nro.	Comp. Nro.	y	Agente de control de plagas de invertebrados	Mezcla Nro.	Comp.	y Nro.	Agente de control de plagas de invertebrados
C-46	101	y	Oxamilo	D-46	104	y	Oxamilo
C-47	101	y	Pimetrozina	D-47	104	y	Pimetrozina
C-48	101	y	Piretrina	D-48	104	y	Piretrina
C-49	101	y	Piridabeno	D-49	104	y	Piridabeno
C-50	101	y	Piridalilo	D-50	104	y	Piridalilo
C-51	101	y	Piriproxifeno	D-51	104	y	Piriproxifeno
C-52	101	y	Rianodina	D-52	104	y	Rianodina
C-53	101	y	Espinetoram	D-53	104	y	Espinetoram
C-54	101	y	Espinosad	D-54	104	y	Espinosad
C-55	101	y	Espirodictofeno	D-55	104	y	Espirodictofeno
C-56	101	y	Espiromesifeno	D-56	104	y	Espiromesifeno
C-57	101	y	Tebufenozida	D-57		y	Tebufenozida
C-58	101	y	Tiacloprida	D-58	104	y	Tiacloprida
C-59	101	y	tiametoxam	D-59	104	y	tiametoxam
C-60	101	y	Tiodicarb	D-60	104	y	Tiodicarb
C-61	101	y	Tiosultap-sodio	D-61	104	y	Tiosultap-sodio
C-62	101	y	Tralometrina	D-62	104	y	Tralometrina
C-63	101	y	Triazamato	D-63	104	y	Triazamato
C-64	101	y	Triflumurona	D-64	104	y	Triflumurona
C-65	101	y	<i>Bacillus thuringiensis</i>	D-65	104	y	<i>Bacillus thuringiensis</i>
C-66	101	y	Delta-endotoxina de <i>Bacillus thuringiensis</i>	D-66	104	y	Delta-endotoxina de <i>Bacillus thuringiensis</i>
C-67	101	y	NPV (por ejemplo, Gemstar)	D-67	104	y	NPV (por ejemplo, Gemstar)
E-1	8	y	Abamectina	F-1	10	y	Abamectina
E-2	8	y	acetamiprid	F-2	10	y	acetamiprid
E-3	8	y	Amitraz	F-3	10	y	Amitraz

Mezcla Nro.	Comp. Nro.	y	Agente de control de plagas de invertebrados	Mezcla Nro.	Comp. y Nro.	Agente de control de plagas de invertebrados
E-4	8	y	Avermectina	F-4	10 y	Avermectina
E-5	8	y	Azadiractina	F-5	10 y	Azadiractina
E-6	8	y	Beta-ciflutrina	F-6	10 y	Beta-ciflutrina
E-7	8	y	Bifentrina	F-7	10 y	Bifentrina
E-8	8	y	Buprofezina	F-8	10 y	Buprofezina
E-9	8	y	Cartap	F-9	10 y	Cartap
E-10	8	y	Clorantianiliprol	F-10	10 y	Clorantianiliprol
E-11	8	y	Clorfenapir	F-11	10 y	Clorfenapir
E-12	8	y	Clorpirifos	F-12	10 y	Clorpirifos
E-13	8	y	clotianidin	F-13 10	y	clotianidin
E-14	8	y	Ciflutrina	F-14	10 y	Ciflutrina
E-15	8	y	Cihalotrina	F-15	10 y	Cihalotrina
E-16	8	y	Cipermetrina	F-16	10 y	Cipermetrina
E-17	8	y	Ciromazina	F-17	10 y	Ciromazina
E-18	8	y	Deltametrina	F-18	10 y	Deltametrina
E-19	8	y	Dieldrina	F-19	10 y	Dieldrina
E-20	8	y	dinotefurano	F-20	10 y	dinotefurano
E-21	8	y	Diofenolano	F-21	10 y	Diofenolano
E-22	8	y	Emamectina	F-22	10 y	Emamectina,
E-23	8	y	Endosulfano	F-23	10 y	Endosulfano
E-24	8	y	Esfenvalerato	F-24	10 y	Esfenvalerato
E-25	8	y	Etiprol	F-25	10 y	Etiprol
E-26	8	y	Fenotiocarb	F-26	10 y	Fenotiocarb
E-27	8	y	Fenoxicarb	F-27	10 y	Fenoxicarb,
E-28	8	y	Fenvalerato	F-28	10 y	Fenvalerato
E-29	8	y	Fipronilo	F-29	10 y	Fipronilo

E-30	8	y	Flonicamida	F-30	10	y	Flonicamida
E-31	8	y	Flubendiamida	F-31	10	y	Flubendiamida
E-32	8	y	Flufenoxurona	F-32	10	y	Flufenoxurona
E-33	8	y	Hexaflumurona	F-33	10	y	Hexaflumurona
E-34	8	y	Hidrametilnona	F-34	10	y	Hidrametilnona
E-35	8	y	Imidacloprid	F-35	10	y	Imidacloprid
E-36	8	y	Indoxacarb	F-36	10	y	Indoxacarb
E-37	8	y	Lambda-cihalotrina	F-37	10	y	Lambda-cihalotrina
E-38	8	y	Lufenurona	F-38	10	y	Lufenurona
E-39	8	y	Metaflumizona	F-39	10	y	Metaflumizona
E-40	8	y	Metomilo	F-40	10	y	Metomilo
E-41	8	y	Metoprene	F-41	10	y	Metoprene
E-42	8	y	Metoxifenoazida	F-42	10	y	Metoxifenoazida
E-43	8	y	nitenpiram	F-43	10	y	nitenpiram
E-44	8	y	nitiazina	F-44	10	y	nitiazina
E-45	8	y	Novalurona	F-45	10	y'	Novalurona
E-46	8	y	Oxamilo	F-46	10	y	Oxamilo
E-47	8	y	Pimetrozina	F-47	10	y	Pimetrozina
E-48	8	y	Piretrina	F-48	10	y	Piretrina
E-49	8	y	Piridabeno	F-49	10	y	Piridabeno
E-50	8	y	Piridalilo	F-50	10	y	Piridalilo
E-51	8	y	Piriproxifeno	F-51	10	y	Piriproxifeno
E-52	8	y	Rianodina	F-52	10	y	Rianodina
E-53	8	y	Espinetoram	F-53	10	y	Espinetoram
E-54	8	y	Espinosad	F-54	10	y	Espinosad
E-55	8	y	Espirodiclofeno	F-55	10	y	Espirodiclofeno
E-56	8	y	Espiromesifeno	F-56	10	y	Espiromesifeno

Mezcla Nro.	Comp. Nro.		Agente de control de plagas invertebrados	Mezcla Nro.	NO.	Comp. y	Agente de control de plagas invertebrados
E-57			Tebufenozida	F-57	10	y	Tebufenozida
E-58			Tiacloprida	F-58	10	y	Tiacloprida
E-59			tiametoxam	F-59	10	y	tiametoxam
E-60			Tiodicarb	F-60	10	y	Tiodicarb
E-61			Tiosultap-sodio	F-61	10	y	Tiosultap-sodio
E-62			Tralometrina	F-62	10	y	Tralometrina
E-63			Triazamato	F-63	10	y	Triazamato
E-64			Triflumurona	F-64	10	y	Triflumurona
E-65			<i>Bacillus thuringiensis</i>	F-65	10	y	<i>Bacillus thuringiensis.</i>
E-66			Delta-endotoxina de <i>Bacillus thuringiensis</i>	F-66	10	y	Delta-endotoxina de <i>Bacillus thuringiensis</i>
E-67			NPV (por ejemplo, Gemstar)	F-67	10	y	NPV (por ejemplo, Gemstar)
G-1	1		Abamectina	H-1	51	y	Abamectina
G-2	1		acetamiprid	H-2	51	y	acetamiprid
G-3	1		Amitraz	H-3	51	y	Amitraz
G-4	1		Avermectina	H-4	51	y	Avermectina
G-5	1		Azadiractina	H-5	51	y	Azadiractina
G-6	1		Beta-ciflutrina	H-6	51	y	Beta-ciflutrina
G-7	1		Bifentrina	H-7	51	y	Bifentrina
C-8	1		Buprofezina	H-8	51	y	Buprofezina
G-9	1		Cartap	H-9	51	y	Cartap
G-10	1		Clorantraniliprol	H-10	51	y	Clorantraniliprol
G-11	1		Clorfenapir	H-11	51	y	Clorfenapir
G-12	1		Clorpirifos	H-12	51	y	Clorpirifos
G-13	1		clotianidin	H-13	51	y	clotianidin

Mezcla Nro.	Comp. Nro.		Agente de control de plagas invertebrados	Mezcla Nro.	NO.	Comp. y	Agente de control de plagas invertebrados
G-14	1		Ciflutrina	H-14	51	y	Ciflutrina
G-15	1		Cihalotrina	H-15	51	y	Cihalotrina
G-16	1		Cipermetrina	H-16	51	y	Cipermetrina
G-17	1		Ciromazina	H-17	51	y	Ciromazina
G-18	1		Deltametrina	H-18	51	y	Deltametrina
G-19	1		Dieldrina	H-19	51	y	Dieldrina
G-20	1		dinotefurano	H-20	51	y	dinotefurano
G-21	1		Diofenolano	H-21	51	y	Diofenolano
G-22	1		Emamectina	H-22	51	y	Emamectina
G-23	1		Endosulfano	H-23	51	y	Endosulfano
C-24	1		Esfenvalerato	H-24	51	y	Esfenvalerato
G-25	1		Etiprol	D-25	51	y	Etiprol

G-26	41	y	Fenotiocarb	H-26	51	y	Fenotiocarb
C-27	41	y	Fenoxicarb	D-27	51	y	Fenoxicarb
G-28	41	y	Fenvalerato	H-28	51	y	Fenvalerato
G-29	41	y	Fipronilo	H-29	51	y	Fipronilo
G-30	41	y	Flonicamida	H-30	51	y	Flonicamida
G-31	41	y	Flubendiamida	H-31	51	y	Flubendiamida
G-32	41	y	Flufenoxurona	H-32	51	y	Flufenoxurona
G-33	41	y	Hexaflumurona	H-33	51	y	Hexaflumurona
G-34	41	y	Hidrametilnona	H-34	51	y	Hidrametilnona
G-35	41	y	Imidacloprid	H-35	51	y	Imidacloprid
G-36	41	y	Indoxacarb	H-36	51	y	Indoxacarb
G-37	41	y	Lambda-cihalotrina	H-37	51	y	Lambda-cihalotrina
G-38	41	y	Lufenurona	H-38	51	y	Lufenurona

G-39	41	y	Metaflumizona	H-39	51	y	Metaflumizona
G-40	41	y	Metomilo	H-40	51	y	Metomilo
G-41	41	y	Metoprene	H-41	51	y	Metoprene
G-42	41	y	Metoxifenoazida	H-42	51	y	Metoxifenoazida
G-43	41	y	nitenpiram	H-43	51	y	nitenpiram
G-44	41	y	nitiazina	H-44	51	y	nitiazina
G-45	41	y	Novalurona	H-45	51	y	Novalurona
G-46	41	y	Oxamilo	H-46	51	y	Oxamilo
G-47	41	y	Pimetrozina	H-47	51	y	Pimetrozina
G-48	41	y	Piretrina	H-48	51	y	Piretrina
G-49	41	y	Piridabeno	H-49	51	y	Piridabeno
G-50	41	y	Piridailo	H-50	51	y	Piridailo
G-51	41	y	Piriproxifeno	H-51	51	y	Piriproxifeno
G-52	41	y	Rianodina	H-52	51	y	Rianodina
G-53	41	y	Espinetoram	H-53	51	y	Espinetoram
G-54	41	y	Espinosad	H-54	51	y	Espinosad
G-55	41	y	Espirodiclofeno	H-55	51	y	Espirodiclofeno
G-56	41	y	Espiromesifeno	H-56	51	y	Espiromesifeno
G-57	41	y	Tebufenozida	H-57	51	y	Tebufenozida
G-58	41	y	Tiacloprida	H-58	51	y	Tiacloprida
G-59	41	y	tiametoxam	H-59	51	y	tiametoxam
G-60	41	y	Tiodicarb	H-60	51	y	Tiodicarb
G-61	41	y	Tiosultap-sodio	H-61	51	y	Tiosultap-sodio
G-62	41	y	Tralometrino	H-62	51	y	Tralometrino
Mezcla Nro.	Comp.	y Nro.	Agente de control de plagas de invertebrados	Mezcla Nro.	Comp. Nro.	y	Agente de control de plagas de invertebrados
G-63	41	y	Triazamato	H-63	51	y	Triazamato
G-64	41	y	Triflurmeto	H-64	51	y	Triflurmeto

Mezcla Nro.	Comp.	y Nro.	Agente de control de plagas de invertebrados	Mezcla Nro.	Comp. Nro.	y	Agente de control de plagas de invertebrados
G-65	41	y	<i>Bacillus thuringiensis</i>	H-65	51	y	<i>Bacillus thuringiensis</i>
G-66	41	y	Delta-endotoxina de <i>Bacillus thuringiensis</i>	H-66	51	y	Delta-endotoxina de <i>Bacillus thuringiensis</i>
G-67	41	y	NPV (por ejemplo, Gemstar)	H-67	51	y	NPV (por ejemplo, Gemstar)

Las mezclas específicas enumeradas en la Tabla B combinan típicamente un compuesto de la fórmula 1 con el otro agente de plaga de invertebrado en las proporciones especificadas en la Tabla A.

5 Las plagas de invertebrados se controlan en aplicaciones agronómicas y no agronómicas por medio de la aplicación de uno o más de los compuestos usados de acuerdo con esta invención, en una cantidad eficaz, al medio de las plagas incluyendo el locus agronómico y/o no agronómico de infestación, al área a proteger o directamente sobre la plaga a controlar.

10 Así, la presente invención comprende además un método para el control de una plaga de invertebrados en aplicaciones agronómicas y no agronómicas, que comprende poner en contacto la plaga de invertebrados o su entorno con una cantidad biológicamente eficaz de uno o más de los compuestos de la invención, o con una composición que comprende al menos uno de tales compuestos y una cantidad eficaz de al menos un compuesto o agente adicional biológicamente activo. Los ejemplos de composiciones adecuadas que comprenden un compuesto de la invención y una cantidad eficaz de al menos un compuesto o agente biológicamente activo adicional incluyen composiciones granulares en las que el compuesto biológicamente activo adicional está presente en el mismo gránulo que el compuesto de la invención, o en gránulos distintos de los del compuesto activo de esta invención.

15 Para lograr un contacto con un compuesto o composición de la invención para proteger un cultivo de campo de plagas de invertebrados, el compuesto o composición se aplica típicamente a la semilla del cultivo antes de plantar, al follaje (por ejemplo, hojas, tallos, flores, frutos) de plantas de cultivo o al suelo u otro medio de crecimiento antes o después de plantar el cultivo.

20 Una realización de un método de contacto es por pulverización. Como alternativa, una composición granular que comprende un compuesto de la invención puede aplicarse al follaje de las plantas o al sustrato. Los compuestos de esta invención se suministran también de forma eficaz a través de la captación de la planta, poniendo en contacto la planta con una composición que comprende un compuesto de esta invención aplicado como un rociado de una formulación líquida en el terreno, de una formulación granular en el terreno, un tratamiento en una caja de vivero o una inmersión de los trasplantes. Tiene interés una composición de la presente invención en forma de una formulación líquida de empapado del suelo. También se ha de notar un método para controlar una plaga de invertebrados que comprende poner en contacto la plaga de invertebrados o su medio ambiente con una cantidad biológicamente efectiva de un compuesto de la presente invención o con una composición que comprende una cantidad biológicamente efectiva de un compuesto de la presente invención. También se ha de notar en este método que el medio ambiente es el suelo y la composición se aplica al suelo como una formulación de empape del suelo. También se han de notar que los compuestos de esta invención también son efectivos por aplicación localizada al locus de infestación. Otros métodos de contacto incluyen la aplicación de un compuesto o una composición de la invención mediante pulverizaciones directas y residuales, pulverizaciones aéreas, geles, recubrimientos de semillas, microencapsulaciones, captaciones sistémicas, cebos, marcadores, píldoras gruesas, nebulizadores térmicos, fumigadores, aerosoles, pulverizaciones y muchos otros. Una realización de un método de contacto es un granulado fertilizante dimensionalmente estable, barra o comprimido que comprende una mezcla o composición de la invención. Los compuestos de esta invención también se pueden impregnar en materiales para fabricar dispositivos de control de invertebrados (por ejemplo redes antiinsectos).

40 Los compuestos de esta invención también son de utilidad en tratamiento de semillas para proteger a las semillas de plagas de invertebrados. En el contexto de la presente descripción y reivindicaciones, el tratamiento de una semilla implica poner en contacto la semilla con una cantidad biológicamente efectiva de un compuesto de esta invención, que se formula típicamente como una composición de la invención. Este tratamiento de semilla protege a la semilla de plagas invertebradas de suelos y generalmente también puede proteger raíces y otras partes de la planta en contacto con el suelo de la plántula que se desarrolla de la semilla en germinación. El tratamiento de semilla también puede proporcionar protección al follaje por translocación del compuesto de esta invención o un segundo ingrediente activo dentro de la planta en desarrollo. Pueden aplicarse tratamientos de semillas a todo tipos de semillas, incluyendo aquellas a partir de las que plantas genéticamente transformadas que expresan características especializadas germinarán. Los ejemplos representativos incluyen aquellas proteínas de expresión tóxicas para las

plagas de invertebrados, tales como toxina de *Bacillus thuringiensis* o aquellas que expresan resistencia a herbicidas tales como glifosato acetiltransferasa, que provee resistencia a glifosato.

Un método de tratamiento de semillas es por pulverización o espolvoreo de la semilla con un compuesto de la invención (es decir, como la composición formulada) antes de sembrar las semillas. Las composiciones formuladas para el tratamiento de semillas comprenden en general un formador de película o un agente adhesivo. En consecuencia, una composición de revestimiento de semilla de la presente invención comprende típicamente una cantidad biológicamente efectiva de un compuesto de la fórmula 1, un *N*-óxido o una de sus sales, y un formador de película o un agente adhesivo. La semilla se puede recubrir por pulverización de un concentrado en suspensión fluido directamente en un lecho de volteo de semillas y luego secado de las semillas. Alternativamente, se pueden pulverizar otros tipos de formulación tales como polvos humectados, soluciones, suspoemulsiones, concentrados emulsionables y emulsiones en agua sobre la semilla. Este proceso es de utilidad en particular para aplicar revestimientos de película sobre semillas. Hay a disposición diversas máquinas y procesos de revestimiento para el experto en la técnica. Los procesos apropiados incluyen aquellos enumerados en P. Kusters et al., *Seed Treatment: Progress and Prospects*, 1994 BCPC Mongraph No. 57; y referencias citadas en este documento.

La semilla tratada comprende típicamente un compuesto de la presente invención en una cantidad de aprox. 0,1 g a 1 kg por 100 kg de semilla (es decir, de aprox. 0,0001 a 1% en peso de la semilla antes del tratamiento). Una suspensión fluida formulada para el tratamiento de semillas comprende típicamente de aprox. 0,5 a aprox. 70% de ingrediente activo, de aprox. 0,5 a aprox. 30% de un adhesivo formador de película, de aprox. 0,5 a aprox. 20% de un agente dispersante, de 0 a aprox. 5% de un espesante, de 0 a aprox. 5% de un pigmento y/o tintura, de 0 a aprox. 2% de un agente antiespumante, de 0 a aprox. 1% de un conservante, y de 0 a aprox. 75% de un diluyente líquido volátil.

Los compuestos de esta invención se pueden incorporar en una composición de cebo que es consumida por una plaga de invertebrados o usada dentro de un dispositivo tales como una trampa, una estación de cebo, y similares. Tal composición de cebo puede estar en forma de gránulos que comprende (a) ingredientes activos, a saber, una cantidad biológicamente efectiva de un compuesto de la fórmula 1, un *N*-óxido o una de sus sales; (b) uno o más materiales alimenticios; opcionalmente (d) un atrayente, y opcionalmente (e) uno o más humectantes. Tienen interés los gránulos o composiciones señuelo que comprenden entre aproximadamente 0,001-5% de ingredientes activos, aproximadamente 40-99% de material alimenticio y/o atrayente; y opcionalmente aproximadamente 0,05-10% de humectantes, que son eficaces en el control de plagas de invertebrados del suelo a tasas de aplicación muy bajas, particularmente con dosis del ingrediente activo que sean letales por la ingestión en vez que por contacto directo. Algunos materiales alimenticios pueden funcionar tanto como una fuente de alimento como un atrayente. Los materiales alimenticios incluyen carbohidratos, proteínas y lípidos. Los ejemplos de materiales alimenticios son harina vegetal, azúcar; almidones, grasa animal, aceite vegetal, extractos de levadura y sólidos lácteos. Los ejemplos de atrayentes son odorantes y aromatizantes, tales como fruta o extractos de plantas, perfumes, u otros componentes de animales o plantas, feromonas u otros agentes conocidos por atraer a una plaga objetivo de invertebrados. Los ejemplos de humectantes, es decir, agentes que retienen la humedad, son los glicoles y otros polioles, glicerina y sorbitol. Tiene interés una composición señuelo (y un método que utilice tal composición señuelo) usado para controlar al menos una plaga de invertebrados seleccionada entre el grupo que consiste en hormigas, termitas y cucarachas, incluyendo individualmente o en combinaciones. Un dispositivo para controlar una plaga de invertebrados puede comprender la presente composición señuelo y una carcasa adaptada que aloje la composición señuelo, en el que la carcasa tiene al menos una abertura dimensionada para permitir que la plaga de invertebrados pase a través de la abertura de tal modo que la plaga de invertebrados tenga acceso a la composición señuelo desde una posición exterior a la carcasa, y en el que la carcasa se adapta además para situarse dentro o cerca de un lugar de actividad potencial o conocida para la plaga de invertebrados.

Los compuestos de esta invención pueden aplicarse sin otros adyuvantes, pero la aplicación más frecuente será la de una formulación que comprenda uno o más ingredientes activos con vehículos, diluyentes y tensioactivos adecuados y posiblemente en combinación con un alimento dependiendo del uso final contemplado. Un método de aplicación implica la pulverización de una dispersión acuosa o solución de aceite refinado del compuesto de la presente invención. Las combinaciones con aceites de pulverización, concentraciones con aceite de pulverización, esparcidores, adyuvantes, otros disolventes y agentes sinérgicos tales como butóxido de piperonilo a menudo mejoran la eficacia del compuesto. Para usos no agronómicos, dichas pulverizaciones pueden aplicarse a partir de envases aerosoles tales como una lata, una botella u otro recipiente, tanto por medio de una bomba como por su liberación a partir de un recipiente presurizado, por ejemplo, una lata presurizada de un pulverizador de aerosol. Tales composiciones de pulverización pueden tomar varias formas, por ejemplo, pulverizaciones, neblinas, espumas, humos o nieblas. Tales composiciones de pulverización pueden por lo tanto comprender además propulsantes, agentes espumantes, etc. según se requiera. Es de notar una composición en spray que comprende una cantidad biológicamente efectiva de un compuesto o una composición de la presente invención y un portador. Una forma de realización de tal composición en spray comprende una cantidad biológicamente efectiva de un compuesto o una composición de la presente invención y un propelente. Los propulsantes representativos incluyen, sin limitación, metano, etano, propano, butano, isobutano, buteno, pentano, isopentano, neopentano, penteno, hidrofluorocarbonos, clorofluorocarbonos, dimetil-éter, y las mezclas de los anteriores. Tiene interés una composición pulverizadora (y un método de utilización de tal composición pulverizadora dispensada a partir de un recipiente aerosol) usado para controlar al menos una plaga de invertebrados seleccionada entre el grupo que

consiste en mosquitos, trips del guisante, moscas de los establos, moscas del venado, tábanos, avispas, véspulas, avispones, garrapatas, arañas, hormigas, mosquitos y similares, incluyendo individualmente o en combinaciones.

Las aplicaciones no agronómicas incluyen protección de un animal, en particular un vertebrado, más en particular, un vertebrado homeotermo (por ejemplo, mamífero o ave) y más en particular, un mamífero, de una plaga parásita invertebrada por administración de una cantidad de acción parasítica (es decir, biológicamente efectiva) de un compuesto de la invención, típicamente en forma de una composición formulada para uso veterinario al animal por proteger. Por ello, se ha de notar un método para la protección de un animal que comprende la administración al animal de una cantidad de acción parasitocida de un compuesto de la invención. Tal como se menciona en la presente revelación y reivindicaciones, los términos "parasitocida" y "de forma parasitocida" hace referencia a efectos observables en una plaga parásita invertebrada para proporcionar protección de un animal de la plaga. Los efectos parasitocidas se refieren típicamente a la reducción de la presencia o la actividad de la plaga parásita invertebrada blanco. Estos efectos sobre la plaga incluyen necrosis, muerte, crecimiento retardado, movilidad reducida o menor capacidad de permanecer sobre o en el animal huésped, menor alimentación e inhibición de la reproducción. Estos efectos sobre plagas parásitas invertebradas proveen control (incluso prevención, reducción o eliminación) de infestación parásita o infección del animal. Los ejemplos de plagas parásitas invertebradas controladas por administración de una cantidad de eficacia parasitocida de un compuesto de la invención a un animal por proteger incluyen ectoparásitos (artrópodos, ácaros, etc.) y endoparásitos (helmintos, por ejemplo, nematodos, trematodos, cestodos, acantocefalinos, etc.). En particular, los compuestos de esta invención son efectivos contra ectoparásitos que incluyen: moscas tales como *Haematobia (Lyperosia) irritans*, *Stomoxys calcitrans*, *Simulium* spp., *Glossina* spp., *Hydrotaea irritans*, *Musca autumnalis*, *Musca domestica*, *Morelia simplex*, *Tabanus* spp., *Hypoderma bovis*, *Hypoderma lineatum*, *Lucilia sericata*, *Lucilia Cuprina*, *Calliphora* spp., *Protophormia* spp., *Oestrus ovis*, *Culicoides* spp., *Hippobosca equina*, *Gastrophilus intestinalis*, *Gastrophilus haemorrhoidalis* y *Gastrophilus nasalis*; pulgas tales como *Bovicola (Damalinia) bovis*, *Bovicola equi*, *Haematopinus asini*, *Felicola subrostratus*, *Heterodoxus spiniger*, *Lignonathus setosus* y *Trichodectes canis*; *Melofagus ovinus*; ácaros tales como *Psoroptes* spp., *Sarcoptes scabiei*, *Chorioptes bovis*, *Demodex equi*, *Cheiletiella* spp., *Notoedres cati*, *Trombicula* spp. y *Otodectes cyanotis*; garrapatas tales como *Ixodes* spp., *Boophilus* spp., *Rhipicephalus* spp., *Amblyomma* spp., *Dermacentor* spp., *Hyalomma* spp. and *Haemaphysalis* spp.; pulgas tales como *Ctenocephalides felis* y *Ctenocephalides canis*.

Las aplicaciones no agronómicas en el vector veterinario son por medios convencionales como por administración enteral en forma de, por ejemplo, comprimidos, cápsulas, bebidas, preparaciones de imbibición, granulados, pastas, bolos, procedimientos de alimentación, supositorios; o por administración parenteral, tales como por inyección (incluyendo intramuscular, subcutánea, intravenosa, intraperitoneal), implantes; por administración nasal; por administración tópica, por ejemplo, en forma de inmersión; pulverización, lavado, revestimiento con polvo o aplicación a una pequeña área del animal, y a través de artículos tales como collares para el cuello, rótulos de orejas, bandas para la cola, bandas para las extremidades o sostenedores que comprenden compuestos o composiciones de la presente invención.

Típicamente, una composición parasitocida de acuerdo con la presente invención comprende una mezcla de un compuesto de la fórmula 1, un N-óxido o sus sales, con uno o varios portadores farmacéutica o veterinariamente aceptables que comprenden excipientes y auxiliares seleccionados según la vía pretendida de administración (por ejemplo, administración oral, tópica o parenteral tales como inyección) y de acuerdo con la práctica estándar. Además, un portador apropiado está seleccionado sobre la base de la compatibilidad con uno o varios ingredientes activos en la composición, incluyendo tales consideraciones como estabilidad respecto del pH y contenido de humedad. En consecuencia, es de notar una composición para proteger a un animal de una plaga parásita invertebrada que comprende una cantidad de eficacia parasitocida de un compuesto de la invención y al menos un portador.

Para la administración parenteral, incluyendo inyección intravenosa, intramuscular y subcutánea, un compuesto de la presente invención se puede formular en suspensión, solución o emulsión en vehículos oleosos o acuosos y puede contener adyuvantes tales como agentes de suspensión, estabilización y/o dispersión. Las composiciones farmacéuticas para inyección incluyen soluciones acuosas de formas hidrosolubles de ingredientes activos (por ejemplo, una sal de un compuesto activo), con preferencia, en tampones fisiológicamente compatibles que contienen otros excipientes o auxiliares conocidos en la técnica de las formulaciones farmacéuticas.

Para la administración oral, incluyendo soluciones (la forma de absorción más fácilmente asequible), emulsiones, suspensiones, pastas, geles, cápsulas, comprimidos, polvos en bolos, gránulos, retención ruminal y bloques de alimento/agua/lamida, se puede formular un compuesto de la presente invención con aglutinantes/rellenos conocidos en la técnica para ser apropiados para composiciones de administración oral, tales como azúcares (por ejemplo, lactosa, sacarosa, manitol, sorbitol), almidón (por ejemplo, almidón de maíz, almidón de trigo, almidón de arroz, almidón de patata), celulosa y derivados (por ejemplo, metilcelulosa, carboximetilcelulosa, etilhidroxilcelulosa), derivados proteicos (por ejemplo, zeína, gelatina), y polímeros sintéticos (por ejemplo, alcohol polivinílico, polivinilpirrolidona). Si se desea, se pueden añadir lubricantes (por ejemplo, estearato de magnesio), agentes desintegrantes (por ejemplo, polivinilpirrolidona entrecruzada; ágar, ácido alginico) y tinturas o pigmentos. Las pastas y geles también contienen a menudo adhesivos (por ejemplo, acacia, ácido alginico, bentonita, celulosa, goma xantán, silicato coloidal de magnesio y aluminio) para ayudar a mantener la composición en contacto con la cavidad oral y que no sea fácilmente rechazada.

Si las composiciones parasiticidas están en forma de concentrados de alimenticios, el portador se selecciona típicamente de alimento de alto rendimiento, cereales alimenticios o concentrados proteicos. Estas composiciones que contienen concentrados alimenticios pueden comprender, además de ingredientes activos parasiticidas, aditivos que promueven la salud animal o el crecimiento, calidad mejorada de la carne de animales para matanza o útiles de otra forma para el manejo animal. Estos aditivos pueden incluir, por ejemplo, vitaminas, antibióticos, agentes quimioterapéuticos, bacteriostatos, fungistatos, coccidiostatos y hormonas.

Se descubrió que los compuestos de la presente invención tienen propiedades farmacocinéticas y farmacodinámicas favorables para proporcionar disponibilidad sistémica de la administración oral e ingestión. En consecuencia, después de la ingestión por el animal por proteger, las concentraciones de eficacia parasitida de los compuestos de la invención en el torrente sanguíneo protegen al animal tratado de plagas chupadoras tales como pulgas, garrapatas y piojos. Por ello, es de notar una composición para proteger un animal de una plaga parásita invertida en forma de administración oral (es decir, que comprende, además de una cantidad de eficacia parasitida de un compuesto de la invención, uno o varios portadores seleccionados de aglutinantes y rellenos apropiados para administración oral y portadores concentrados alimenticios).

Las formulaciones para administración tópica están típicamente en forma de un polvo, crema, suspensión, spray, emulsión, espuma, pasta, aerosol, ungüento, bálsamo o gel. Más típicamente, una formulación tópica es una solución hidrosoluble que puede estar en forma de un concentrado que se diluye antes de usar. Las composiciones parasiticidas apropiadas para administración tópica comprenden típicamente un compuesto de la presente invención y uno o varios portadores típicamente apropiados. En aplicaciones de una composición parasitida por vía tópica al exterior de un animal como una línea o mancha (es decir, tratamiento "spot-on"), se espera que el ingrediente activo migre sobre la superficie del activo para cubrir la mayor parte o toda su superficie externa. Como resultado, el animal tratado se protege en particular de plagas de invertebrados que se alimentan de la epidermis del animal tales como pulgas, garrapatas y piojos. En consecuencia, las formulaciones para administración localizada tópica a menudo comprenden al menos un disolvente orgánico para facilitar el transporte del ingrediente activo a la piel y/o la penetración en la epidermis del animal. Los disolventes comúnmente usados como portadores en tales formulaciones incluyen propilenglicol, parafinas, productos aromáticos, ésteres tales como miristato de isopropilo, glicoléteres, y alcoholes tales como etanol y *n*-propanol.

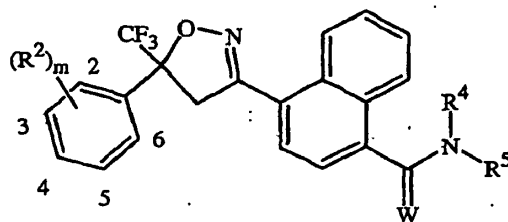
La tasa de aplicación necesaria para un control eficaz (es decir la "cantidad biológicamente eficaz") dependerá de factores tales como la especie de invertebrado a controlar, el ciclo de vida de la plaga, la fase de la vida, su tamaño, localización, momento del año, cultivo o animal hospedador, comportamiento de alimentación, comportamiento de apareamiento, humedad ambiental, temperatura y similares. En circunstancias normales son suficientes relaciones de aplicación de aproximadamente 0,01 a 2 kg de ingredientes activos por hectárea para controlar plagas en ecosistemas agronómicos, pero puede ser suficiente tan solo 0,0001 kg/hectárea o se puede requerir tanto como 8 kg/hectárea. Para aplicaciones no agronómicas, las proporciones de uso eficaces variarán entre aproximadamente 1,0 a 50 mg/metro cuadrado, pero puede ser suficiente una cantidad de tan sólo 0,1 mg/metro cuadrado o puede necesitarse una cantidad de hasta 150 mg/metro cuadrado. Un especialista en la técnica puede determinar fácilmente la cantidad biológicamente eficaz necesaria para el nivel deseado de control de plagas de invertebrados.

En general, para uso veterinario, un compuesto de la fórmula 1, uno *N*-óxido o sus sales, se administra en una cantidad de eficacia parasitida a un animal por proteger de plagas parásitas invertidas. Una cantidad de eficacia parasitida es la cantidad de ingrediente activo necesaria para lograr un efecto observable que reduce la aparición o la actividad de la plaga parásita invertida blanco. Un experto en la técnica apreciará que la dosis de eficacia parasitida puede variar de los diversos compuestos y composiciones de la presente invención, el efecto parasitida deseado y duración, la especie de plaga invertida blanco, el animal por proteger, el modo de aplicación y similares, y la cantidad necesaria para lograr un resultado particular se puede determinar a través de simple experimentación.

Para administración oral de animales homeotermos, la dosis diaria de un compuesto de la presente invención típicamente varía de aprox. 0,01 mg/kg a aprox. 100 mg/kg, más típicamente de aprox. 0,5 mg/kg a aprox. 100 mg/kg, de peso corporal animal. Para administración tópica (por ejemplo, dérmica), los baños de inmersión y sprays contienen típicamente de aprox. 0,5 ppm a aprox. 5000 ppm, más típicamente de aprox. 1 ppm a aprox. 3000 ppm, de un compuesto de la presente invención.

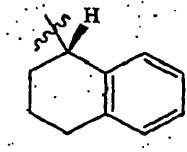
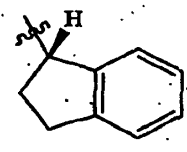
En las Tablas de Índices A-C que se muestran a continuación se usan las siguientes abreviaturas: *i* es iso, *t* es *terc*, *c* es ciclo, Me es metilo, Et es etilo, *c*-Pr es ciclopipilo y *t*-Bu es *terc*-butilo. Naftilo significa naftalenilo. (*R*) o (*S*) denota la quiralidad absoluta del centro de carbono asimétrico. La abreviatura "Ej." significa "Ejemplo" y va seguida de un número que indica en qué ejemplo se prepara el compuesto. En la Tabla de índices A, (*R*²)_m se refiere a la combinación de (*R*²)_n con instancias de CR² para B¹, B² y B³.

TABLA DE ÍNDICE A



en donde m es 1, 2, 3, 4 ó 5.

Compuesto	W	(R ²) _m	R ⁴	R ⁵	p.f. (°C)
1 (Ej. 1)	O	3-Cl 5-Cl		H CH ₂ CF ₃	**
2 (Ej. 2)	O	3-Cl, 5-Cl	H	CH ₂ -2-piridinilo	**
3	O	H	H	CH ₂ CF ₃	*
4	O	H	H	CH ₂ -2-piridinilo	*
5	O	3-Cl, 5-Cl	H	CH ₂ -fenilo	*
6	O	3-Cl, 5-Cl	H	CH ₂ -3-piridinilo	*
7	O	3-Cl, 5-Cl	H	CH ₂ -4-piridinilo	*
8 (Ej. 3)	S	3-Cl, 5-Cl	H	CH ₂ -2-piridinilo	**
9	O	3-Cl, 5-Cl	Me	Et	*
10	O	3-Cl, 5-Cl	H	Et	*
11	O	3-Cl, 5-Cl	CO ₂ Me	CH ₂ -2-piridinilo	*
12	O	3-Cl, 5-Cl	H	Me	*
13	O	3-Cl, 5-Cl	H	CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂	*
14	O	3-Cl, 5-Cl	H	CH ₂ CH ₂ N(CH ₃) ₂ .HCl	*
15	O	3-Cl, 5-Cl	H	(R)-CH(CH ₃)-fenilo	*
16	O	3-Cl, 5-Cl	H	CH(CH ₃) ₂	*
17	O	3-Cl, 5-Cl	H	(S)-CH(CH ₃)-fenilo	*
18	O	3-Cl, 5-Cl	H	CH ₂ CH=CH ₂	*
19	O	3-Cl, 5-Cl	H	CH ₂ O≡CH	*
20	O	3-Cl, 5-Cl	H	CH ₂ -c-Pr	*
21	O	3-Cl, 5-Cl	H	CH(CH ₃)-2-piridinilo	*

Compuesto	W	(R ²) _m	R ⁴	R ⁵	p.f. (°C)
22	O	3-Me, 5-Me	H	CH ₂ -2-piridinilo*	
23	O	3-Cl, 4-Cl	H	CH ₂ -2-piridinilo	*
24	O	3-F, 5-F	H	CH ₂ -2-piridinilo*	
25	O	3-Cl	H	CH ₂ -2-piridinilo	*
26	O	3-Br, 5-Br	H	CH ₂ -2-piridinilo	*
27	O	3-Cl, 5-Cl	H	(R)-CH(CH ₃)-2-naftilo	*
28	O	3-Cl, 5-Cl	H	(R)-CH(CH ₃)-(4-NO ₂ -fenilo	*
29	O	3-Cl, 5-Cl	H	(S)-CH(CO ₂ CH ₃)-fenilo	*
30	O	3-Cl, 5-Cl	H	(R)-CH(CH ₃)-(4-Cl-fenilo	*
31	O	3-Cl, 5-Cl	H	(R)-CH(CH ₃)-(4-F-fenilo	*
32	O	3-Cl, 5-Cl	H	(R)-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	*
33	O	3-Cl, 5-Cl	H	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	*
34	O	3-Cl, 5-Cl	H	(R)-CH(CH ₃)- <i>t</i> -Bu	*
35	O	3-Cl, 5-Cl	H	CH ₂ CH ₂ OH	*
36	O	3-Cl, 5-Cl	H	H	*
37	O	3-Cl, 5-Cl		-CH ₂ CH ₂ N(CH ₃)CH ₂ CH ₂ -	*
38	O	3-Cl, 5-Cl	H		*
39	O	3-Cl, 5-Cl	H		*
40	O	3-Cl, 5-Cl	H		*

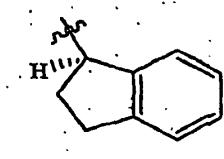
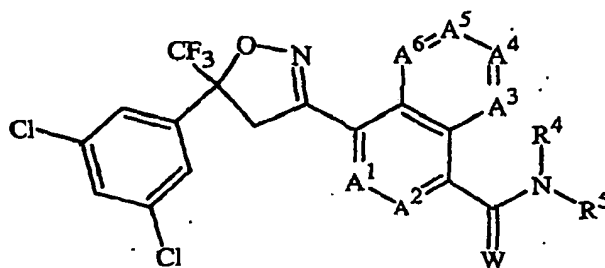
Compuesto	W	(R ²) _m	R ⁴	R ⁵	p.f. (°C)
					
41	O	3-Cl, 5-Cl	H	CH ₂ CH ₂ OCH ₃	*
42	O	3-Cl, 5-Cl	H	CH ₂ CO ₂ Et	*
43	O	3-Cl, 5-Cl	H	CH ₂ CO ₂ H	*
44	O	3-Cl, 5-Cl	H	CH ₂ CO ₂ Na	*
45	O	3-Cl, 5-Cl	H	NHC(=O)Me	*
46	O	3-Cl, 5-Cl	H	NH-fenilo	*
47	O	3-Cl, 5-Cl	H	CH ₂ CH ₂ NH ₂	*
48	O	3-Cl, 5-Cl	H	(S)-CH(Me)CO ₂ Me	*
49	O	3-Cl, 5-Cl	H	(S)-CH(<i>i</i> -Pr)CO ₂ Me	*
50	O	3-Cl, 5-Cl	H	CH ₂ (CH ₂) ₅ NH ₂	*
51	O	3-Cl, 5-Cl	H	CH ₂ CONHCH ₂ CF ₃	*
52	O	3-Cl, 5-Cl	H	CH ₂ CN	*
53	O	3-Cl, 5-Cl	H	NH-2-piridinilo	*
*Véase la Tabla de Índice D para los datos de ¹ H RMN **Véanse los Ejemplos para los datos de ¹ H RMN.					

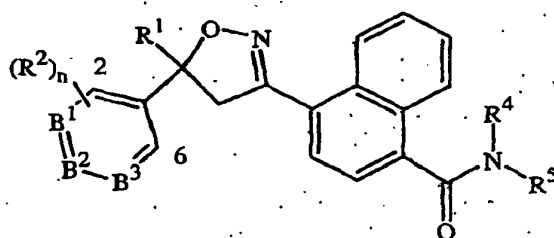
TABLA DE ÍNDICE B



Compuesto	W	A ¹	A ²	A ³	A ⁴	A ⁵	A ⁶	R ⁴	R ⁵	p.f. (°C)
101	O	N	CH	CH	CH	CH	CH	H	CH ₂ -2-piridinilo	*
102	O	CH	N	CH	CH	CH	CH	H	CH ₂ -2-piridinilo	*
103 (Ej. 4)	O	CH	CH	N	CH	CH	CH	H	CH ₂ -2-piridinilo	**
104 (Ej. 5)	O	CH	CH	CH	N	CH	CH	H	CH ₂ -2-piridinilo	**
105	O	CH	CH	CH	CH	N	CH	H	CH ₂ -2-piridinilo	*
106	O	CH	CH	CH	CH	CH	N	H	CH ₂ -2-piridinilo	*
107	O	CH	CH	CH	CH	CH	N	H	CH ₂ CF ₃	*
108	S	CH	CH	CH	CH	CH	N	H	CH ₂ -2-piridinilo	*
109	S	CH	CH	CH	CH	CH	N	H	CH ₂ CF ₃	*
110	O	CH	CCH ₃	CH	CH	CH	CH	H	CH ₂ -2-piridinilo	*
111	O	CH	CCH ₃	CH	CH	CH	CH	H	CH ₂ CF ₃	*

*Véase la Tabla de Índice D para los datos de ¹H RMN **Véanse los Ejemplos para los datos de ¹H RMN.

5 TABLA DE ÍNDICE C



Compuesto	B ¹	B2	B3	(R ²) _n	R ⁴	R ⁵	p.f. (°C)
201	C-Cl	N	CH	H	H	CH ₂ CF ₃	*
202	C-Cl	N	CH	H	H	CH ₂ -2-piridinilo	*

Compuesto	B ¹	B2	B3	(R ²) _n	R ⁴	R ⁵	p.f. (°C)
*Véase la Tabla de Índice D para los datos de ¹ H RMN							

TABLA DE ÍNDICE D

Comp. N°	Datos de ¹ H RMN (solución de CDCl ₃ a menos que se indique lo contrario) ^a
3	δ 8,67 (d, 1H), 8,06 (d, 1H), 7,66-7,45 (m, 7H), 7,39 (d, 1H), 7,29 (d, 1H), 6,78 (br s 1H), 4,19 (d, 1H), 4,15 (m, 2H), 3,88 (d, 1H).
4	δ 8,82 (d, 1H), 8,50 (d, 1H), 8,35 (d, 1H), 7,71-7,44 (m, 11H), 7,35 (d, 1H), 7,20 (dd, 1H), 4,83 (d, 2H), 4,25 (d, 1H), 3,95 (d, 1H).
5	δ 8,78 (d, 1H), 8,27 (d, 1H), 7,64-7,30 (m, 12H), 6,40 (br t 1H), 4,71 (d, 2H), 4,22 (d, 1H), 3,86 (d, 1H).
6	δ 8,72 (d, 1H), 8,53 (d, 1H), 8,49 (dd, 1H), 8,18 (d, 1H), 7,72 (d, 1H), 7,60-7,52 (m, 4H), 7,45 (m, 2H), 7,36 (d, 1H), 7,27 (m, 1H), 6,93 (br t, 1H), 4,66 (d, 2H), 4,21 (d, 1H), 3,86 (d, 1H).
7	δ 8,72 (d, 1H), 8,50 (d, 2H), 8,19 (d, 1H), 7,61-7,54 (m, 4H), 7,47 (m, 2H), 7,37 (d, 1H), 7,23 (d, 2H), 7,02 (br t, 1H), 4,66 (d, 2H), 4,22 (d, 1H), 3,86 (d, 1H).
9	δ 8,88 (m, 1H), 7,83 (m, 1H), 7,66-7,40 (m, 7H), 4,27 (d, 1H), 3,92 (d, 1H), 3,80-3,66 y 3,09 (m, 2H), 3,22 y 2,74 (s, 3H), 1,01 y 1,36 (t, 3H).
10	δ 8,78 (d, 1H), 8,25 (d, 1H), 7,64-7,42 (m, 7H), 6,08 (br s, 1H), 4,24 (d, 1H), 3,88 (d, 1H), 3,58 (m, 2H), 1,31 (t, 3H).
11	δ 8,92 (d, 1H), 8,63 (d, 1H), 8,17 (d, 1H), 7,74-7,53 (m, 7H), 7,45 (t, 1H), 7,35 (d, 1H), 7,23 (dd, 1H), 5,33 (s, 2H), 4,29 (d, 1H), 3,92 (d, 1H), 3,43 (s, 3H).
12	δ 8,77 (d, 1H), 8,21 (d, 1H), 7,63-7,55 (m, 5H), 7,44 (d, 1H), 7,38 (d, 1H), 6,18 (br s, 1H), 4,23 (d, 1H), 3,87 (d, 1H), 3,07 (d, 3H).
13	δ 8,78 (d, 1H), 8,27 (d, 1H), 7,39-7,62 (m, H), 6,77 (br s, 1H), 4,22 (d, 1H), 3,88 (d, 1H), 3,58 (q, 2H), 2,53 (t, 2H), 2,25 (s, 6H).
15	δ 8,63 (dd, 1H), 8,00 (dd, 1H), 7,56 (s, 2H), 7,47-7,16 (m, 9H), 6,78 (dd, 1H), 5,34 (m, 1H), 4,14 (dd, 1H), 3,80 (dd, 1H), 1,60 (d, 3H).
16	δ 8,80 (d, 1H), 8,25 (d, 1H), 7,66-7,45 (m, 7H), 5,87 (d, 1H), 4,41 (m, 1H), 4,24 (d, 1H), 3,88 (d, 1H), 1,33 (d, 6H).
17	δ 8,77 (d, 1H), 8,19 (dd, 1H), 7,63-7,30 (m, 12H), 6,30 (d, 1H), 5,44 (m, 1H), 4,22 (d, 1H), 3,86 (d, 1H), 1,67 (d, 1H).
18	δ 8,80 (d, 1H), 8,27 (d, 1H), 7,67-7,45 (m, 7H), 6,15 (br t, 1H), 5,99 (m, 1H), 5,31 (d, 1H), 5,24 (d, 1H), 4,25 (d, 1H), 4,17 (m, 2H), 3,88 (d, 1H).
19	δ 8,77 (d, 1H), 8,24 (d, 1H), 7,64-7,56 (m, 4H), 7,50 (d, 1H), 7,46 (dd, 1H), 7,40 (d, 1H), 6,38 (br t, 1H), 4,33 (dd, 2H), 4,23 (d, 1H), 3,87 (d, 1H), 2,32 (t, 1H).
20	δ 8,82 (d, 1H), 8,29 (d, 1H), 7,67-7,45 (m, 7H), 6,14 (br s, 1H), 4,26 (d, 1H), 3,90 (d, 1H), 3,42 (dd, 2H), 1,12 (m, 1H), 0,59 (m, 2H), 0,32 (m, 2H).

Comp. N°	Datos de ^1H RMN (solución de CDCl_3 a menos que se indique lo contrario) ^a
21	δ 8,82 (d, 1H), 8,50 (d, 1H), 8,34 (d, 1H), 7,72 (dt, 1H), 7,67-7,57 (m, 6H), 7,50 (d, 1H), 7,45 (dd, 1H), 7,34 (d, 1H), 7,21 (dd, 1H), 5,45 (m, 1H), 4,26 (d, 1H), 3,90 (d, 1H), 1,66 (d, 3H).
22	δ 8,85 (d, 1H), 8,51 (d, 1H), 8,36 (d, 1H), 7,72-7,57 (m, 4H), 7,51 (d, 1H), 7,45 (br t, 1H), 7,36 (d, 1H), 7,25 (s, 2H), 7,21 (dd, 1H), 7,07 (s, 1H), 4,85 (d, 1H), 4,22 (d, 1H), 3,94 (d, 1H), 2,38 (s, 6H).
23	δ 8,81 (d, 1H), 8,51 (d, 1H), 8,37 (d, 1H), 7,78-7,46 (m, 9H), 7,36 (d, 1H), 7,22 (dd, 1H), 4,85 (d, 2H), 4,26 (d, 1H), 3,90 (d, 1H).
24	δ 8,83 (d, 1H), 8,52 (d, 1H), 8,39 (d, 1H), 7,74-7,22 (m, H), 6,91 (dt, 1H), 4,87 (d, 2H), 4,27 (d, 1H), 3,90 (d, 1H).
25	δ 8,83 (d, 1H), 8,51 (d, 1H), 8,37 (d, 1H), 7,73-7,41 (m, 10H), 7,37 (d, 1H), 7,22 (dd, 1H), 4,86 (d, 2H), 4,26 (d, 1H), 3,92 (d, 1H).
26	δ 8,82 (d, 1H), 8,52 (d, 1H), 8,38 (d, 1H), 7,76 (s, 2H), 7,74-7,59 (m, H), 7,52 (d, 1H), 7,44 (br t, 1H), 7,37 (d, 1H), 7,23 (dd, 1H), 4,87 (d, 2H), 4,26 (d, 1H), 3,90 (d, 1H).
27	δ 8,76 (d, 1H), 8,19 (dd, 1H), 7,87-7,36 (m, 14H), 6,46 (d, 1H), 5,59 (m, 1H), 4,20 (d, 1H), 3,84 (d, 1H), 1,73 (d, 3H).
28	δ 8,77 (d, 1H), 8,23 (d, 2H), 8,14 (dd, 1H), 7,66-7,44 (m, 9H), 6,45 (d, 1H), 5,47 (m, 1H), 4,24 (d, 1H), 3,88 (d, 1H), 1,66 (d, 3H).
29	δ 8,80 (d, 1H), 8,28 (d, 1H), 7,66-7,37 (m, H), 6,99 (d, 1H), 5,87 (d, 1H), 4,24 (d, 1H), 3,88 (d, 1H), 3,80 (s, 3H).
30	δ 8,76 (d, 1H), 8,14 (dd, 1H), 7,63-7,35 (m, 11H), 6,35 (d, 1H), 5,38 (m, 1H), 4,21 (d, 1H), 3,85 (d, 1H), 1,62 (d, 3H).
31	δ 8,76 (d, 1H), 8,16 (dd, 1H), 7,64-7,38 (m, 9H), 7,07 (d, 1H), 7,05 (d, 1H), 6,30 (d, 1H), 5,41 (m, 1H), 4,22 (d, 1H), 3,86 (d, 1H), 1,64 (d, 3H).
32	δ 8,81 (d, 1H), 8,26 (d, 1H), 7,67-7,45 (m, 7H), 5,78 (d, 1H), 4,26 (d, 1H), 4,25 (m, 1H), 3,88 (d, 1H), 1,63 (m, 2H), 1,30 (d, 3H), 1,04 (t, 3H).
33	δ 8,81 (d, 1H), 8,26 (d, 1H), 7,67-7,45 (m, 7H), 5,78 (d, 1H), 4,26 (d, 1H), 4,25 (m, 1H), 3,88 (d, 1H), 1,63 (m, 2H), 1,30 (d, 3H), 1,04 (t, 3H).
34	δ 8,80 (d, 1H), 8,26 (d, 1H), 7,68-7,46 (m, 7H), 5,80 (d, 1H), 4,26 (d, 1H), 4,23 (m, 1H), 3,88 (d, 1H), 1,24 (d, 3H), 1,01 (s, 9H).
35	δ 8,65 (d, 1H), 8,08 (d, 1H), 7,55 (s, 2H), 7,52-7,44 (m, 7H), 7,27 (d, 1H), 7,19 (d, 1H), 6,93 (br t, 1H), 4,16 (d, 1H), 3,81 (d, 1H), 3,73 (s, br, 2H), 3,53 (m, 2H), 3,27 (br s, 1H).
36	δ 8,75 (d, 1H), 8,30 (d, 1H), 7,63-7,35 (m, 7H), 6,69 (br s, 1H), 6,32 (br s, 1H), 4,22 (d, 1H), 3,86 (d, 1H).
38	δ 8,79 (m, 1H), 8,34 (d, 1H), 7,64-7,12 (m, 11H), 6,29 (dd, 1H), 5,50 (m, 1H), 4,22 (d, 1H), 3,87 (d, 1H), 2,82 (m, 2H), 2,24 (m, 1H), 2,05 (m, 1H), 1,91 (m, 2H).
39	δ 8,80 (d, 1H), 8,34 (d, 1H), 7,65-7,25 (m, H), 6:28 (d, 1H), 5,79 (q, 1H), 4,24 (d, 1H), 3,87 (d, 1H), 3,92-3,07 (m, 2H), 2,77 (m, 1H), 1,99 (m, 1H).
40	δ 8,81 (d, 1H), 8,37 (d, 1H), 7,67-7,26 (m, H), 6,26 (d, 1H), 5,80 (q, 1H), 4,24 (d, 1H), 3,88 (d, 1H), 3,09-

Comp. N°	Datos de ^1H RMN (solución de CDCl_3 a menos que se indique lo contrario) ^a
	2,93 (m, 2H), 2,79 (m, 1H), 1,99 (m, 1H).
41	δ 8,82 (d, 1H), 8,30 (d, 1H), 7,67-7,46 (m, 7H), 6,40 (br t, 1H), 4,25 (d, 1H), 3,89 (d, 1H), 3,75 (q, 2H), 3,63 (dd, 2H), 3,39 (s, 3H).
42	δ 8,84 (d, 1H), 8,37 (d, 1H), 7,67-7,46 (m, 7H), 6,53 (br t, 1H), 4,33 (d, 2H), 4,29 (q, 2H), 4,26 (d, 1H), 3,90 (d, 1H), 1,34 (t, 3H).
43	DMSO- d_6 : δ 9,02 (t, 1H), 8,81 (d, 1H), 8,37 (d, 1H), 7,92 (d, 1H), 7,83 (t, 1H), 7,74-7,65 (m, 5H), 4,58 (d, 1H), 4,54 (d, 1H), 4,02 (d, 2H).
44	DMSO- d_6 : δ 8,86 (d, 1H), 8,50 (d, 1H), 7,96-7,67 (m, 8H), 4,61 (s obvio, 2H), 3,64 (d, 2H).
45	DMSO- d_6 δ 10,44 (s, 1H), 10,10 (s, 1H), 8,86 (d, 1H), 8,46 (d, 1H), 7,98 (d, 1H), 7,90 (t, 1H), 7,76 (m, 5H), 4,63 (d, 1H), 4,59 (d, 1H), 2,04 (s, 3H).
46	δ 10,45 (s, 1H), 8,80 (d, 1H), 8,24 (d, 1H), 7,95 (d, 1H), 7,85-7,63 (m, 7H), 7,22 (t, 2H), 6,90 (d, 2H), 6,78 (t, 1H), 4,57 (s obvio, 2H).
47	δ 8,83 (d, 1H), 8,33 (d, 1H), 7,69-7,46 (m, 9H), 6,54 (br s, 1H), 4,27 (d, 1H), 3,90 (d, 1H), 3,61 (q, 2H), 3,02 (t, 3H).
48	δ 8,83 (d, 1H), 8,35 (d, 1H), 7,68-7,46 (m, 7H), 6,54 (d, 1H), 4,91 (m, 1H), 4,26 (d, 1H), 3,90 (d, 1H), 3,83 (s, 3H), 1,60 (d, 3H).
49	δ 8,84 (d, 1H), 8,34 (d, 1H), 7,70-7,46 (m, 7H), 6,46 (d, 1H), 4,91 (dd, 1H), 4,26 (d, 1H), 3,90 (d, 1H), 3,83 (s, 3H), 2,36 (m, 1H), 1,10 (d, 3H), 0,99 (d, 3H).
50	DMSO- d_6 δ 8,79 (d, 1H), 8,71 (t, 1H), 8,19 (d, 1H), 8,08 (br s, 2H), 7,90 (d, 1H), 7,84 (dd, 1H), 7,73-7,66 (m, 4H), 7,62 (d, 1H), 4,54 (s obvio, 2H), 3,35 (m, 2H), 2,76 (m, 2H), 1,60 (m, 4H), 1,39 (m, 4H).
51	δ 8,82 (d, 1H), 8,26 (d, 1H), 7,67-7,46 (m, 7H), 7,09(m, 2H), 4,28 (d, 2H), 4,25 (d, 1H), 3,96 (m, 2H), 3,88 (d, 1H).
52	δ 8,79 (d, 1H), 8,23 (d, 1H), 7,68-7,46 (m, 7H), 6,53 (br t, 1H), 4,46 (d, 2H), 4,26 (d, 1H), 3,89 (d, 1H).
53	δ 8,83 (d, 1H), 8,42 (q, 1H), 8,18 (d, 1H), 7,73 (d, 1H), 7,70-7,55 (m, 7H); 7,50 (d, 1H), 7,46 (dd, 1H), 6,84 (dd, 1H), 6,80 (d, 1H), 4,26 (d, 1H), 3,90 (d, 1H).
101	δ 9,24 (d, 1H), 8,75 (s, 1H), 8,52 (d, 1H), 8,45 (d, 1H), 7,82-7,70 (m, 3H), 7,64 (br s, 1H), 7,58 (s, 2H), 7,44 (t, 1H), 7,37 (d, 1H), 7,24 (dd, 1H), 4,87 (d, 2H),
102	δ 9,63 (d, 1H), 9,04 (br t, 1H), 8,93 (d, 1H), 8,60 (d, 1H), 8,52 (s, 1H), 7,86 (dd, 1H), 7,74 (dd, 1H), 7,69 (dd, 1H), 7,57 (s, 2H), 7,46 (dd, 1H), 7,40 (d, 1H), 7,23 (dd, 1H), 4,85 (d, 2H), 4,31 (d, 1H), 3,94 (d, 1H).
105	10,17 (s, 1H), 8,64 (d, 1H), 8,53 (d, 1H), 8,22 (d, 1H), 7,90 (d, 1H), 7,73 (dt, 1H), 7,68 (br t, 1H), 7,59 (d, 1H), 7,56 (s, 2H), 7,46 (t, 1H), 7,37 (d, 1H), 7,24 (dd, 1H), 4,85 (d, 2H), 4,27 (d, 1H), 3,92 (d, 1H).
106	δ 8,95 (dd, 1H), 8,88 (dd, 1H), 8,55 (d, 1H), 8,26 (d, 1H), 7,83 (d, 1H), 7,72 (dt, 1H), 7,60-7,50 (m, 4H), 7,43 (t, 1H), 7,36 (d, 1H), 7,24 (dd, 1H), 4:85 (d, 2H), 4,72 (d, 1H). 4,42 (d, 1H).
107	δ 8,89 (dd, 1H), 8,61 (d, 1H), 7,99 (d, 1H), 7,59 (d, 1H), 7,55 (s, 2H), 7,45 (m, 2H), 6,89 (br t, 1H), 4,68 (d, 1H), 4,32 (d, 1H), 4,18 (m, 2H).

Comp. N°	Datos de ¹ H RMN (solución de CDCl ₃ a menos que se indique lo contrario) ^a
108	δ 9,41 (br s, 1H), 8,91 (dd, 1H), 8,70 (dd, 1H), 8,46 (d, 1H), 8,21 (d, 1H), 7,75 (dt, 1H), 7,64 (d, 1H), 7,57 (s, 2H), 7,47 (dd, 1H), 7,43 (t, 1H), 7,38 (d, 1H), 7,24 (dd, 1H), 5,14 (d, 2H), 4,68 (d, 1H), 4,39 (d, 1H).
109	δ 8,88 (d, 1H), 8,47 (dd, 1H), 8,12 (br s, 1H), 7,97 (d, 1H), 7,53 (s, 2H), 7,47 (m, 3H), 4,74 (m, 2H), 4,59 (d, 1H), 4,25 (d, 1H).
110	δ 8,75 (d, 1H), 8,42 (d, 1H), 7,86 (d, 1H), 7,68 (dt, 1H), 7,57 (s, 2H), 7,55-7,35 (m, 5H), 7,31 (s, 1H), 7,18 (dd, 1H), 4,82 (d, 2H), 4,25 (d, 1H), 3,90 (d, 1H), 2,44 (s, 3H).
111	δ 8,59 (d, 1H), 7,58 (s, 2H), 7,54 (d, 1H), 7,47 (t, 1H), 7,36-7,44 (m, 2H), 7,10 (s, 1H), 6,80 (br t, 1H), 4,20 (d, 1H), 4,08 (m, 2H), 3,86 (d, 1H), 2,23 (s, 3H).
201	δ 8,71 (d, 1H), 8,48 (m, 1H), 8,13 (d, 1H), 7,55-7,64 (m, 3H), 7,49 (d, 1H), 7,44 (d, 1H), 7,35 (dd, 1H), 6,74 (t, 1H), 4,24 (d, 1H), 4,17 (m, 2H), 3,83 (d, 1H).
202	δ 8,79 (d, 1H), 8,50 (m, 2H), 8,35 (d, 1H), 7,50-7,72 (m, 7H), 7,47 (d, 1H), 7,36 (d, 1H), 7,22 (dd, 1H), 4,83 (d, 2H), 4,28 (d, 1H), 3,89 (d, 1H).

Los espectros de ¹H RMN se informan en ppm campo abajo de tetrametilsilano; Los acoplamientos están nombrados como (s)-singulete, (d)-doblete, (t)-triplete, (q)-cuartete, (m)-multiplete, (dd)-doblete de dobletes, (dt)-doblete de tripletes, (s ancho)-singulete ancho.

EJEMPLOS BIOLÓGICOS DE LA INVENCION

- 5 Las pruebas siguientes demuestran la eficacia de control de los compuestos de esta invención en plagas específicas. La "eficacia del control" representa la inhibición del desarrollo de la plaga de invertebrados (que incluye la mortalidad) que causa una alimentación reducida de forma significativa. Sin embargo, la protección de control de plagas producida por los compuestos no se limita a estas especies. Véanse las Tablas de Índices A-C para las descripciones de los compuestos.

ENSAYO A

- 10 Para evaluar el control de la polilla de dorso de diamante (*Plutella xylostella*) la unidad de ensayo consistía en un pequeño recipiente abierto con una planta de 12-14 días en su interior. Esto se preinfestó con aprox. 50 larvas de neonato que se dispensaron en la unidad de ensayo a través de mazorkas de maíz usando un inoculador de bazooka. Las larvas se movieron a la planta de ensayo después de ser dispensadas en la unidad de ensayo.
- 15 Los compuestos de ensayo se formularon usando una solución que contenía 10% de acetona, 90% de agua y 300 ppm de tensoactivo no iónico X-77Spreader Lo-Foam Formula que contenía alquilarilpolioxietileno, ácidos grasos libres, glicoles e isopropanol (Loveland Industries, Inc. Greeley, Colorado, EE.UU.). Los compuestos formulados se aplicaron en 1 mL de líquido a través de una boquilla atomizadora SUJ2 con un cuerpo a medida 1/8 JJ (Spraying Systems Co. Wheaton, Illinois, EE.UU.) colocada a 1,27 cm (0,5 pulgadas) por encima de la parte superior de cada unidad de ensayo. Todos los compuestos experimentales en estos ensayos se rociaron a 250 y/o 50 ppm, y el ensayo se replicó tres veces. Después de la pulverización del compuesto de ensayo formulado, cada unidad de ensayo se dejó secar durante 1 hora y después se puso encima una tapa negra reticulada. Las unidades de ensayo se mantuvieron durante 6 días en una cámara de crecimiento a 25°C y 70% de humedad relativa. El daño de alimentación de la planta se evaluó luego visualmente en base al folaje consumido y también se contó una tasa de mortalidad de la plaga y se calculó para cada unidad de ensayo.
- 20
- 25 De los compuestos de la fórmula 1 ensayados, los siguientes proporcionaron niveles muy buenos a excelentes de eficacia de control (20% o menos de daño en la alimentación u 80% o más mortalidad): 1, 2, 4, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11, 12, 13, 14, 15, 16, 18, 19, 20, 21, 22, 23, 26, 27, 28, 29, 30, 31, 32, 33, 34, 35, 36, 38, 39, 41, 42, 43, 45, 46, 47, 48, 49, 50, 51, 101, 102, 103, 104, 105, 106, 107*, 108*, 109*, 110, 111, 201 y 202.

* implica niveles muy buenos a excelentes de eficacia de control observados sólo a 250 ppm.

ENSAYO B

5 Para evaluar el control de la oruga militar tardía (*Spodoptera frugiperda*), la unidad de ensayo consistía en un pequeño recipiente abierto con una planta de cereal (maíz) de 4-5 días de edad en su interior. Esta planta se había preinfestado (mediante el uso de un muestreador) con larvas de 10-15 días en una pieza de material de alimentación de insectos. Los compuestos de ensayo se formularon y se pulverizaron a 250 y/o 50 ppm, y se replicó tres veces. Después de pulverizar, las unidades de ensayo se mantuvieron en una cámara de crecimiento y luego se probó la eficacia de control para cada unidad de ensayo tal como se describió para el ensayo A.

10 De los compuestos de la fórmula 1 ensayados, los siguientes proporcionaron niveles muy buenos a excelentes de eficacia de control (20% o menos de daño en la alimentación u 80% o más mortalidad): 1, 2, 5, 6, 7, 8, 9, 10, 11, 12, 13, 14, 15, 16, 18, 19, 20, 21, 22, 23, 25, 26, 28, 29, 30, 31, 32, 33, 34, 35, 36, 39, 41, 42, 46, 49, 51, 101, 102, 103, 104, 106*, 107*, 110*, 111*, 201 y 202.

* implica niveles muy buenos a excelentes de eficacia de control observados sólo a 250 ppm.

ENSAYO C

15 Para evaluar el control del saltahojas de la patata (*Empoasca fabae* Harris) por medios de contacto y/o sistémicos, la unidad de prueba consistió en un pequeño recipiente abierto con una planta de judías Longio de 5-6 días (con las hojas primarias brotadas) en el interior. Se añadió arena blanca en la parte de arriba del suelo y se extirpó una de las hojas primarias antes de la aplicación. Se formularon los compuestos de prueba y se pulverizaron 250 y/o 50 ppm, y se repitió tres veces la aplicación como se describió para el ensayo A. Después de la pulverización, se dejaron secar las unidades de prueba durante 1 hora antes de post-infestarlas con 5 saltahojas de la patata (adultos de 21 días de edad). Se colocó una tapa negra, de vigilancia en la parte superior del cilindro. Se mantuvieron las unidades de ensayo durante 6 días en una cámara de crecimiento a 19-21 °C y 50-70% de humedad relativa. La eficacia de control de cada unidad de ensayo se evaluó luego visualmente con la mortalidad de los insectos.

20 De los compuestos de la fórmula 1 ensayados, los siguientes proporcionaron niveles muy buenos a excelentes de eficacia de control (80% o menos de daño en la alimentación u % o más mortalidad): 1, 2, 8, 10, 11, 14*, 15, 16, 18*, 19, 20, 21, 26, 28, 31, 32*, 34, 36, 38, 46*, 101, 102* y 106*.

* implica niveles muy buenos a excelentes de eficacia de control observados sólo a 250 ppm.

ENSAYO D

30 Para evaluar el control de los trips occidental de las flores (*Frankliniella occidentalis* Pergande) por medios de contacto y/o sistémicos, cada unidad de prueba consistió en un pequeño recipiente abierto con una planta de judía de 5 a -7 días var. Los compuestos de ensayo se formularon y rociaron a 250 y/o 50 ppm, y el ensayo se replicó tres veces tal como se describió para el ensayo A. Después de pulverizar, las unidades de ensayo se dejaron secar y luego se añadieron 22-27 trips adultos a cada unidad y luego se colocó una tapa de tamiz negra en la parte superior. Se mantuvieron las unidades de prueba durante 6 días a 25 C y 45-55% de humedad relativa. Se evaluó una tasa de mortalidad junto con una tasa de daño en la planta para cada unidad de ensayo.

35 De los compuestos de la fórmula 1 ensayados, los siguientes proporcionaron niveles muy buenos a excelentes de eficacia de control (20% o menos de daño en la alimentación u 80% o más mortalidad): 1, 2, 8, 10, 11, 13*, 14*, 15*, 16, 18, 19, 20*, 21, 26, 32, 33*, 34*, 35, 39*, 1, 42, 45*, 46*, 47*, 48*, 49, 51, 101 y 104.

* implica niveles muy buenos a excelentes de eficacia de control observados sólo a 250 ppm.

ENSAYO E

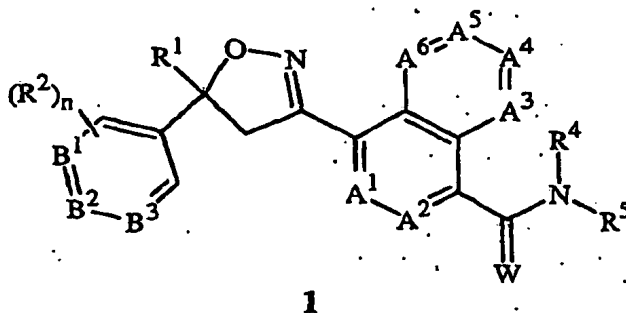
40 Para evaluar el control de la pulga *Ctenocephalides felis* Bouche), se dosificó por vía oral un ratón CD-1® (de aprox. 30 g, macho, obtenido de Charles River Laboratories, Wilmington, MA) con un compuesto de ensayo en una cantidad de 10 mg/kg solubilizada en propilenglicol/glicerol formal (60:40). Dos horas después de la administración oral del compuesto de ensayo, se aplicaron aprox. 8 a 16 pulgas adultas a cada ratón. Las pulgas se evaluaron luego en cuanto a la mortalidad 48 horas después de la aplicación de pulgas al ratón.

45 De los compuestos ensayados, los siguientes compuestos causaron el 30% o más de mortalidad: 1*, 2, 10*, 41* y 51*.

* implica que el compuesto causó el 50% o más de mortalidad.

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de la fórmula 1, uno de sus N-óxidos o sus sales,



en la que

- 5 A¹, A², A³, A⁴, A⁵ y A⁶ están seleccionados, de modo independiente entre sí, del grupo que consiste en CR³ y N, siempre que, como máximo, 3 de A¹, A², A³, A⁴, A⁵ y A⁶ sean N;
- B¹, B² y B³ están seleccionados, de modo independiente entre sí, del grupo que consiste en CR² y N; W es O o S;
- R¹ es alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alquil-cicloalquilo C₄-C₇ o cicloalquilalquilo C₄-C₇, cada uno opcionalmente sustituido con uno o varios sustituyentes seleccionados, de modo independiente, de R⁶;
- 10 cada R² es, de modo independiente, H, halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆-tio, -haloalquil C₁-C₆-tio, alquil C₁-C₆-sulfinilo, haloalquil C₁-C₆-sulfinilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, haloalquil C₁-C₆-sulfonilo, alquil C₁-C₆-amino, dialquil C₂-C₆-amino, alcoxi C₂-C₄-carbonilo, -CN o -NO₂;
- 15 cada R³ es, de modo independiente, H, halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆-tio, haloalquil C₁-C₆-tio, alquil C₁-C₆-sulfinilo, haloalquil C₁-C₆-sulfinilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, haloalquil C₁-C₆-sulfonilo, alquil C₁-C₆-amino, dialquil C₂-C₆-amino, -CN o -NO₂;
- R⁴ es H, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alquil-cicloalquilo C₄-C₇, cicloalquilalquilo C₄-C₇, alquil C₂-C₇-carbonilo o alcoxi C₂-C₇-carbonilo;
- 20 R⁵ es H, OR¹⁰, NR¹¹R¹² o Q¹; o alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alquil-cicloalquilo C₄-C₇ o cicloalquilalquilo C₄-C₇, cada uno opcionalmente sustituido con uno o varios sustituyentes seleccionados, de modo independiente, de R⁷; o
- 25 R⁴ y R⁵ se toman junto con el nitrógeno al que están unidos para formar un anillo que contiene 2 a 6 átomos de carbono y opcionalmente un átomo adicional seleccionado del grupo que consiste en N, S y O, dicho anillo opcionalmente sustituido con 1 a 4 sustituyentes seleccionados, de modo independiente, del grupo que consiste en alquilo C₁-C₂, halógeno, -CN, -NO₂ y alcoxi C₁-C₂;
- cada R⁶ es, de modo independiente, halógeno, alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆-tio, alquil C₁-C₆-sulfinilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, -CN o -NO₂;
- 30 cada R⁷ es, de modo independiente, halógeno; alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆-tio, alquil C₁-C₆-sulfinilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, alquil C₁-C₆-amino, dialquil C₂-C₈-amino, cicloalquil C₃-C₆-amino, alquil C₂-C₇-carbonilo, alcoxi C₂-C₇-carbonilo, alquil C₂-C₇-aminocarbonilo, dialquil C₃-C₉-aminocarbonilo, haloalquil C₂-C₇-carbonilo, haloalcoxi C₂-C₇-carbonilo, haloalquil C₂-C₇-aminocarbonilo, halodialquil C₃-C₉-aminocarbonilo, hidroxilo, -NH₂, -CN o -NO₂; o Q²;
- 35 cada R⁸ es, de modo independiente, halógeno, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆-tio, haloalquil C₁-C₆-tio, alquil C₁-C₆-sulfinilo, haloalquil C₁-C₆-sulfinilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, haloalquil C₁-C₆-sulfonilo, alquil C₁-C₆-amino, dialquil C₂-C₆-amino, alcoxi C₂-C₄-carbonilo, -CN o -NO₂;
- cada R⁹ es, de modo independiente, halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆-tio, haloalquil C₁-C₆-tio, alquil C₁-C₆-sulfinilo, haloalquil C₁-C₆-sulfinilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, haloalquil C₁-C₆-sulfonilo, alquil C₁-C₆-amino, dialquil C₂-C₆-amino, -CN, -NO₂, fenilo o piridinilo;
- 40 R¹⁰ es H; o alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alquil C₄-C₇-cicloalquilo o cicloalquilalquilo C₄-C₇, cada uno opcionalmente sustituido con uno o varios halógenos;

R⁴ es H, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alquil-cicloalquilo C₄-C₇, cicloalquilalquilo C₄-C₇, alquil C₂-C₇.carbonilo o alcoxi C₂-C₇.carbonilo;

5 R¹² es H; Q³, o alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alquil-cicloalquilo C₄-C₇ o cicloalquilalquilo C₄-C₇, cada uno opcionalmente sustituido con uno o varios sustituyentes seleccionados, de modo independiente, de R⁷; o

R¹¹ y R¹² se toman junto con el nitrógeno al que están unidos para formar un anillo que contiene 2 to 6 átomos de carbono y opcionalmente un átomo adicional seleccionado del grupo que consiste en N, S y O, dicho anillo opcionalmente sustituido con 1 a 4 sustituyentes seleccionados, de modo independiente, del grupo que consiste en alquilo C₁-C₂, halógeno, -CN, -NO₂ y alcoxi C₁-C₂;

10 Q¹ es un anillo fenilo, un anillo heterocíclico de 5 ó 6 miembros, o un sistema de anillos bicíclicos fusionados de 8, 9 ó 10 miembros que opcionalmente contiene uno a tres heteroátomos seleccionados de hasta 1 O, hasta 1 S y hasta 3 N, cada anillo o sistema de anillos opcionalmente sustituido con uno o varios sustituyentes seleccionados, de modo independiente, de R⁸;

15 cada Q² es, de modo independiente, un anillo fenilo o un anillo heterocíclico de 5 ó 6 miembros, cada anillo opcionalmente sustituido con uno o varios sustituyentes seleccionados, de modo independiente, de R⁹;

Q³ es un anillo fenilo o un anillo heterocíclico de 5 ó 6 miembros, cada anillo opcionalmente sustituido con uno o varios sustituyentes seleccionados, de modo independiente, de R⁹; y n es 0, 1 ó 2.

2. Un compuesto de la reivindicación 1, en el que

20 R¹ es alquilo C₁-C₃ opcionalmente sustituido con uno o varios sustituyentes seleccionados, de modo independiente, de R⁶;

cada R² es, de modo independiente, H, halógeno, haloalquilo C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆ o -CN; y

cada R³ es, de modo independiente, H, halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, -CN o -NO₂.

3. Un compuesto de la reivindicación 2, en el que

25 B¹, B² y B³ son, de modo independiente, CR²;

W es O;

R⁴ es H, alquilo C₁-C₆, alquil C₂-C₇.carbonilo o alcoxi C₂-C₇.carbonilo; y R⁵ es H, NR¹¹R¹² o Q¹; o alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alquil-cicloalquilo C₄-C₇ o cicloalquilalquilo C₄-C₇, cada uno opcionalmente sustituido con uno o varios sustituyentes seleccionados, de modo independiente, de R⁷;

30 4. Un compuesto de la reivindicación 3, en el que

R¹ es alquilo C₁-C₃ opcionalmente sustituido con halógeno;

cada R² es, de modo independiente, H, CF₃, OCF₃, halógeno o -CN;

cada R³ es, de modo independiente, H, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, ciclopropilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₄ o -CN; y

35 cada R⁷ es, de modo independiente, halógeno, alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄-tio, alquil C₁-C₄.sulfonilo, alquil C₁-C₄.sulfonilo, alquil C₂-C₄.carbonilo, alcoxi C₂-C₄.carbonilo, alquil C₂-C₅.aminocarbonilo, haloalquil C₂-C₅.carbonilo, haloalcoxi C₂-C₅.carbonilo, haloalquil C₂-C₅.aminocarbonilo, -NH₂, -CN o -NO₂; o Q².

5. Un compuesto de la reivindicación 4, en el que

R⁴ es H;

40 R⁵ es alquilo C₁-C₄ opcionalmente sustituido con uno o varios sustituyentes seleccionados, de modo independiente, de R⁷;

cada R⁷ es, de modo independiente, halógeno o Q²; y

cada Q² es, de modo independiente, fenilo, piridinilo o tiazolilo.

6. Un compuesto de la reivindicación 5, en el que

R¹ es CF₃;

45 A¹, A², A³, A⁴, A⁵ y A⁶ son cada uno CR³;

B^2 es CR^2 ; y

cada R^3 es, de modo independiente, H, alquilo C_1-C_4 o $-CN$.

7. Un compuesto de la reivindicación 6, en el que

B^2 es CH ;

5 cada R^2 es, de modo independiente, halógeno o haloalquilo C_1-C_3 ;

R^3 es H;

R^5 es CH_2CF_3 o CH_2 -2-piridinilo; y

n es 0.

8. Un compuesto de la reivindicación 1 que está seleccionado del grupo que consiste en:

10 4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]-N-(2,2,2-trifluoroetil)-1-naftalencarboxamida,

4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]-N-(2-piridinilmetil)-1-naftalencarboxamida,

4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]-N-(2-piridinilmetil)-1-naftalencarbotioamida,

4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]-N-etil-1-naftalencarboxamida,

4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]-N-(2-metoxietil)-1-naftalencarboxamida,

15 5-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]-N-(2-piridinilmetil)-8-quinolincarboxamida,

5-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]-N-(2-piridinilmetil)-8-isoquinolincarboxamida, y

1-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]-N-(2-piridinilmetil)-4-isoquinolincarboxamida.

9. Una composición que comprende un compuesto de la reivindicación 1 y al menos un componente adicional seleccionado del grupo que consiste en un tensioactivo, un diluyente sólido y un diluyente líquido, en donde dicha composición opcionalmente también comprende al menos un compuesto o agente adicional biológicamente activo.

10. Una composición para controlar una plaga de invertebrados que comprende una cantidad biológicamente efectiva de un compuesto de la reivindicación 1 y al menos un componente adicional seleccionado del grupo que consiste en un tensioactivo, un diluyente sólido y un diluyente líquido, en donde dicha composición opcionalmente también comprende una cantidad biológicamente efectiva de al menos un compuesto o agente adicional biológicamente activo.

11. La composición de la reivindicación 10, en donde al menos un compuesto o agente adicional biológicamente activo está seleccionado de insecticidas del grupo que consiste en moduladores del canal de sodio, inhibidores de colinesterasa, neonicotinoides, lactonas macrocíclicas insecticidas, bloqueadores del canal de cloruro regulado por GABA, inhibidores de la síntesis de quitina, mímicos de la hormona juvenil, ligandos del receptor de octopamina, agonistas de ecdisona, ligandos del receptor de rianodina, análogos de nereistoxina, inhibidores del transporte de electrones mitocondriales, inhibidores de la biosíntesis de lípidos, insecticidas ed ciclodienos, inhibidores de la muda, nucleopolihedrovirus, un miembro de *Bacillus thuringiensis*, una delta-endotoxina encapsulada de *Bacillus thuringiensis* y un insecticida viral natural o genéticamente modificado.

12. La composición de la reivindicación 10, en donde al menos un compuesto o agente adicional biológicamente activo está seleccionado del grupo que consiste en abamectina, acefato, acetamiprid, acetoprol, aldicarb, amidoflomet, amitraz, avermectina, azadiractina, azinfos-metilo, bifentrina, bifenazato, bistriflurona, buprofezina, carbofurano, cartap, quinometionato, clorfenapir, clorfluazurona, clorantraniliprol, clorpirifos, clorpirifos-metilo, clorobenzilato, cromafenoazida, clotianidina, ciflometofeno, ciflutrina, beta-ciflutrina, cihalotrina, gamma-cihalotrina, lambda-cihalotrina, cihexatina, cipermetrina, ciromazina, deltametrina, diafenthiurona; diazinona, dicofol, dieldrina, dienoclor, diflubenzurona, dimeflutrina, dimetoato, dinotefurano, diofenolano, emamectina, endosulfano, esfenvalerato, etiprol, etoxazol, fenamifos, fenazaquina, óxido de fenbutatina, fenotiocarb, fenoxicarb, fenpropatrina, fenpiroximato, fenvalerato, fipronilo, flonicamida, flubendiamida, flucitrinato, tau-fluvalinato, flufenerim, flufenoxurona, fonofos, halofenozida, hexaflumurona, hexitiazox, hidrametilnona, imiciafos, imidacloprida, indoxacarb, isofenfos, lufenurona, malationa, metaflumizona, metaldehído, metamidofos, metidationa, metomilo, metoprene, metoxiclor, metoxifenoazida, metoflutrina, monocrotofos, nitenpiram, nitiazina, novalurona, noviflumurona, oxamilo, parationa, parationa-metilo, permetrina, forato, fosalona, fosmet, fosfamidona, pirimicarb, profenofos, proflutrina, propargita, protrifenbuta, pimetrozina, pirafuprol, piretrina, piridabeno, piridialilo, pirifluquinazona, piriprol, piriproxifeno, rotenona, rianodina, espinetoram, espinosad, espiroclorfenol, espiromesifeno, espirotetramato, sulprofos, tebufenozida, tebufenpirad, teflubenzurona, teflutrina, terbufos, tetraclorvinfos, tiacloprida, tiametoxam, tiodicarb, tiosultap-sodio, tolfenpirad, tralometrina, triazamato, triclorfona, triflumurona, *Bacillus thuringiensis* subsp. *aizawai*, *Bacillus*

thuringiensis subsp. *kurstaki*, nucleopolihedrovirus, una delta-endotoxina encapsulada de *Bacillus thuringiensis*, baculovirus, bacterias entomopatógenas, virus entomopatógenos y hongos entomopatógenos.

13. La composición de la reivindicación 12, en donde al menos un compuesto o agente adicional biológicamente activo está seleccionado del grupo que consiste en abamectina, acetamiprid, amitraz, avermectina, azadiractina, bifentrina, buprofezina, cartap, clorantianiliprol, clorfenapir, clorpirifos, clotianidina, ciflutrina, beta-ciflutrina, cihalotrina, lambda-cihalotrina, cipermetrina, ciromazina, deltametrina, dieldrina, dinotefurano, diofenolano, emamectina, endosulfano, esfenvalerato, etiprol, fenotiocarb, fenoxicarb, fenvalerato, fipronil, flonicamida, flubendiamida, flufenoxurona, hexaflumurona, hidrametilnona, imidacloprid, indoxacarb, lufenurona, metaflumizona, metomilo, metoprene, metoxifenoza, nitenpiram, nitiazina, novalurona, oxamilo, pimetrozina, piretrina, piridabeno, piridialilo, piriproxifeno, rianodina, espinetoram, espinosad, espirodiclofeno, espiromesifeno, tebufenozida, tiacloprida, tiametoxam, tiodicarb, tiosultap-sodio, tralometrina, triazamato, triflumurona, *Bacillus thuringiensis* subsp. *aizawai*, *Bacillus thuringiensis* subsp. *kurstaki*, nucleopolihedrovirus y una delta-endotoxina encapsulada de *Bacillus thuringiensis*.
14. La composición de la reivindicación 10 en la forma de una formulación de líquida para empapado del suelo.
15. Una composición en spray para controlar una plaga de invertebrados que comprende:
- (a) una cantidad biológicamente efectiva del compuesto de la reivindicación 1 o la composición de la reivindicación 10; y
- (b) un propulsante.
16. Una composición de cebo para controlar una plaga de invertebrados que comprende:
- (a) una cantidad biológicamente efectiva del compuesto de la reivindicación 1 o la composición de la reivindicación 10;
- (b) uno o más materiales alimenticios;
- (c) opcionalmente un atrayente; y
- (d) opcionalmente un humectante.
17. Un dispositivo trampa para controlar una plaga de invertebrados, que comprende:
- (a) la composición señuelo de la reivindicación 16; y
- (b) una carcasa adaptada para recibir la composición señuelo, en la que la carcasa tiene al menos una abertura dimensionada para permitir que la plaga de invertebrados pase a través de la abertura, de tal modo que la plaga de invertebrados pueda tener acceso a la composición señuelo desde una posición exterior a la carcasa, y en la que la carcasa está adaptada además para situarse dentro o cerca de un lugar de actividad potencial o conocida para la plaga de invertebrados.
18. Un método para controlar una plaga de invertebrados, que comprende poner en contacto la plaga de invertebrados o su entorno con una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8, a condición de que el método no sea un método terapéutico para el tratamiento del cuerpo humano o animal.
19. Un método para controlar una plaga de invertebrados, que comprende poner en contacto la plaga de invertebrados o su entorno con una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 9 a 16, a condición de que el método no sea un método terapéutico para el tratamiento del cuerpo humano o animal.
20. El método de la reivindicación 19 en donde el ambiente es suelo y la composición se aplica al suelo como una formulación de empapado de suelo.
21. Un método para controlar una cucaracha, una hormiga o una termita, que comprende poner en contacto una cucaracha, una hormiga o una termita con la composición de cebo en un dispositivo de trampa de la reivindicación 17, con la condición de que el método no sea un método de tratamiento de un cuerpo humano o animal por terapia.
22. Un método para controlar un mosquito, una mosca negra, una mosca estable, una mosca de ciervo, una mosca de caballo, una avispa, una chaqueta amarilla, una pulga, una araña, una hormiga, o un mosquito, que comprende poner en contacto un mosquito, una mosca negra, una mosca estable, una mosca de ciervo, una mosca de caballo, una avispa, una chaqueta amarilla, una pulga, una araña, una hormiga, o un mosquito con la composición en spray de la reivindicación 15 dispensada como un recipiente de spray, siempre que el método no sea un método de tratamiento de un cuerpo humano o animal por terapia.

23. Un método para proteger una semilla de una plaga de invertebrados que comprende poner en contacto la semilla con una cantidad biológicamente efectiva de un compuesto de la reivindicación 1.

24. El método de la reivindicación 23 en donde la semilla se recubre con el compuesto de la reivindicación 1 formulado como una composición que comprende un formador de película o un agente adhesivo.

5 25. Una semilla tratada que comprende un compuesto de la reivindicación 1 en una cantidad de aproximadamente 0,0001 a 1% en peso de la semilla antes del tratamiento.

26. Un compuesto de la reivindicación 1 que está seleccionado del grupo que consiste en: 4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]-N-(2,2,2-trifluoroetil)-1-naftalencarboxamida; 4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]-N-(2-piridinilmetil)-1-naftalencarboxamida; 4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]-N-etil-1-naftalencarboxamida; 4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]-N-(2-metoxietil)-1-naftalencarboxamida; y 4-[5-(3,5-diclorofenil)-4,5-dihidro-5-(trifluorometil)-3-isoxazolil]-N-[2-oxo-2-[(2,2,2-trifluoroetil)amino]etil]-1-naftalencarboxamida.

10

27. Una composición para proteger a un animal de una plaga parásita invertebrada que comprende una cantidad de eficacia parasitocida de un compuesto de la reivindicación 1 ó 26 y al menos un portador.

15 28. La composición de la reivindicación 27 en una forma para administración oral.

29. Un compuesto de la reivindicación 1 o de la reivindicación 26, para usar en la protección de un animal de una plaga parásita invertebrada.