



19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA

11 Número de publicación: **2 358 899**

51 Int. Cl.:

C07D 231/44 (2006.01)

C07D 401/12 (2006.01)

C07D 403/12 (2006.01)

C07D 409/12 (2006.01)

C07D 405/12 (2006.01)

A01N 43/56 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Número de solicitud europea: **03789030 .8**

96 Fecha de presentación : **12.11.2003**

97 Número de publicación de la solicitud: **1569910**

97 Fecha de publicación de la solicitud: **07.09.2005**

54 Título: **Pesticidas sulfonilaminopirazoles.**

30 Prioridad: **03.12.2002 EP 02027034**

45 Fecha de publicación de la mención BOPI:
16.05.2011

45 Fecha de la publicación del folleto de la patente:
16.05.2011

73 Titular/es: **MERIAL LIMITED**
3239 Satellite Blvd
Duluth, Georgia 30096-4640, US

72 Inventor/es: **Döller, Uwe;**
Chou, David, Teh-Wei;
Steinsberger, Merwyn;
Maier, Michael;
Kuhlmann, Anke;
Seeger, Karl;
Hawkins, David, William;
Gough, Stanley, Thomas, Derek y
Manning, David, Treadway

74 Agente: **Ponti Sales, Adelaida**

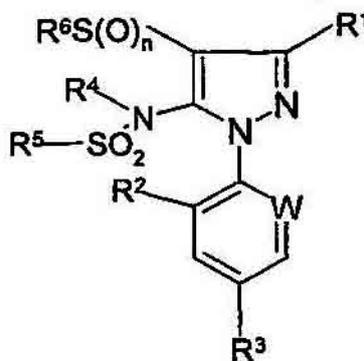
ES 2 358 899 T3

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

Descripción

Pesticidas sulfonilaminopirazoles

- 5 **[0001]** La invención se refiere a derivados sulfonilaminopirazol-5-sustituídos, procesos para su preparación, composiciones de los mismos y su uso para el control de plagas, como artrópodos dañinos (incluyendo insectos y arácnidos) y helmintos (incluyendo nematodos).
El control de artrópodos, como insectos y arácnidos, y helmintos, como nematodos, con compuestos 1-arilpirazol se ha descrito en, por ejemplo, las publicaciones de patentes números WO 93/06089, WO 94/21606, WO 87/03781, EP 0295117, EP 659745, EP 679650, EP 201852 y U.S. 5.232.940. El control de parásitos en animales con compuestos 1-arilpirazol también se ha descrito en, por ejemplo, las publicaciones de patentes números WO 00/35884, EP 0846686, WO 98/24769 y WO 97/28126. En el documento EP 234119 se describe el uso de N-fenilpirazoles en el control de plagas de artrópodos, nematodos de plantas o helmintos.
Sin embargo, el nivel de acción y/o la duración de la acción de estos compuestos previos en la técnica no son
15 completamente satisfactorias en todos los campos de la aplicación, especialmente frente a determinados organismos o cuando se aplican concentraciones bajas.
- [0002]** Puesto que los pesticidas modernos deben cumplir una amplia variedad de demandas, por ejemplo, con respecto al nivel, duración y espectro de acción, espectro utilizado, toxicidad, combinación con otras sustancias
20 activas, combinación con auxiliares de formulación o síntesis y, puesto que es posible la aparición de resistencias, el tratamiento final de estas sustancias nunca debe observarse como concluida y existe constantemente una alta demanda de nuevos compuestos que presenten ventajas sobre los compuestos conocidos, al menos en lo que concierne a algunos aspectos.
- 25 **[0003]** La presente invención proporciona un compuesto que es un derivado sulfonilaminopirazol-5-sustituído de fórmula (I):



(I)

en el que:

- 30 R^1 es alquilo (C_1-C_6), haloalquilo (C_1-C_6), CN, C(S)NH₂ u halógeno;
W es N, C-CH₃ o C-halógeno;
 R^2 es H, CH₃ o halógeno;
 R^3 es halo, alquilo (C_1-C_6), haloalquilo (C_1-C_6), haloalquilo (C_1-C_6), S(O)_p-(C_1-C_6)-haloalquilo o SF₅;
 R^4 es H, alqueno (C_2-C_6), haloalqueno (C_2-C_6), alqueno (C_2-C_6), haloalqueno (C_2-C_6), cicloalquilo (C_3-C_7), CO₂-(C_1-C_6)-alquilo, CO₂-(C_3-C_7)-cicloalquilo, -CO₂-(C_1-C_4)-alquilo-(C_3-C_7)-cicloalquilo, -CO₂-(C_3-C_6)-alqueno, -CO₂-(C_3-C_6)-alqueno, -CO₂-(CH₂)_qR⁷, CONR⁸R⁹, -CO₂-(CH₂)_qR¹⁰, -(CH₂)_qR⁷, -(CH₂)_qR¹⁰, COR⁹, COCH₂NR⁸R⁹, -CO-(CH₂)_qR⁷ o -CO-(CH₂)_qR¹⁰; o alquilo (C_1-C_6) no sustituido o sustituido por uno o más radicales seleccionados entre el grupo constituido por halógeno, alcoxi (C_1-C_6), haloalcoxi (C_1-C_6), cicloalcoxi (C_3-C_7), S(O)_pR¹¹, CO₂-(C_1-C_6)-alquilo, -O(C=O)-(C_1-C_6)-alquilo, NR⁸R⁹, CONR⁸R⁹, SO₂NR⁸R⁹, OH, CN, NO₂, OR⁷, OR¹⁰, NR⁸COR¹² y NR⁸SO₂R¹¹;
35 R^5 es cicloalquilo (C_3-C_7), alqueno (C_2-C_6), haloalqueno (C_2-C_6), R¹³, R¹⁰, R¹⁷ o -CH=CH-R¹⁵; o es alquilo (C_1-C_{15})
40 [preferiblemente alquilo (C_1-C_6)] no sustituido o sustituido por uno o más radicales seleccionados entre el grupo constituido por halógeno, alcoxi (C_1-C_6), haloalcoxi (C_1-C_6), alqueno (C_3-C_6), haloalqueno (C_3-C_6), alqueno (C_3-C_6)

- (C₃-C₆), haloalquinoxiloxi (C₃-C₆), cicloalquilo (C₃-C₇), S(O)_pR⁷, S(O)_pR¹⁰, S(O)_pR¹¹, CN, NO₂, OH, COR⁸, NR⁸COR¹², NR⁸SO₂R¹¹, CONR⁸R⁹, NR⁸R⁹, OR⁷, OR¹⁰, R¹³, R¹⁰ y CO₂R⁸, o un grupo metileno en el alquilo (C₁-C₆) sustituido o no sustituido está reemplazado por un grupo seleccionado entre -CO-, -O-, -S(O)_p-, -NR⁸-, -COO-, -OCO-, -CONR⁸-, -NR⁸CO-, -C(=NOR⁸)-, -C(=N-NR⁸R⁹)- y -C(=NR⁸)- siempre que el grupo sustituyente no se una directamente al grupo SO₂ en la fórmula (I);
- 5 R⁶ y R¹¹ son independientemente cada uno alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆), alqueno (C₂-C₆), haloalqueno (C₂-C₆), alquinoxiloxi (C₂-C₆), haloalquinoxiloxi (C₂-C₆) o cicloalquilo (C₃-C₇);
- R⁷ es fenilo no sustituido o sustituido por uno o más radicales seleccionados entre el grupo constituido por halógeno, alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆), haloalcoxi (C₁-C₆), CN, NO₂, S(O)_pR¹¹ y NR⁹R¹²;
- 10 R⁸ es H, alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆), cicloalquilo (C₃-C₇), -(C₁-C₄)-alquilo-(C₃-C₇)-cicloalquilo, -(CH₂)_qR⁷ o -(CH₂)_qR¹⁰;
- R⁹ y R¹² son independientemente cada uno H, alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆), cicloalquilo (C₃-C₇) o -(C₁-C₄)-alquilo-(C₃-C₇)-cicloalquilo; o
- R⁸ y R⁹ junto con el átomo de N unido forman un anillo saturado de cinco o seis átomos que opcionalmente contiene un heteroátomo adicional en el anillo que se selecciona entre O, S y N, estando el anillo no sustituido o sustituido por uno o más radicales seleccionados entre el grupo constituido por halógeno, alquilo (C₁-C₆) y haloalquilo (C₁-C₆);
- 15 R¹⁰ y R²⁰ son independientemente cada uno heterocíclico no sustituido o sustituido por uno o más radicales seleccionados entre el grupo constituido por halógeno, alquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄), S(O)_pR¹⁴, OH, OR⁷ y oxo;
- 20 R¹³ es arilo no sustituido o sustituido por uno o más radicales seleccionados entre el grupo constituido por halógeno, alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆), haloalcoxi (C₁-C₆), CN, NO₂, S(O)_pR¹¹, SF₅, NR⁸R⁹, COR¹¹, COR⁷, CONR⁸R⁹, SO₂NR⁸R⁹, OH, OR⁷, R¹⁵, R¹⁶, OR¹⁶, SO₃H, alquilidenedimino (C₁-C₆), CH=NOR¹⁴, S(O)_pR¹⁸, CO₂R¹⁹ y R²⁰;
- R¹⁴ es alquilo (C₁-C₆) o haloalquilo (C₁-C₆);
- R¹⁵ es fenilo o naftilo cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos por uno o más radicales seleccionados entre el grupo constituido por halógeno, alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆) y alcoxi (C₁-C₆);
- 25 R¹⁶ es un radical heteroaromático seleccionado entre el grupo constituido por piridilo, pirimidinilo, piridazinilo, pirazinilo, triazinilo, tienilo, tiazolilo, tiadiazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, furilo, pirrolilo, pirazolilo, imidazolilo y triazolilo, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos por uno o más radicales seleccionados entre el grupo constituido por halógeno, alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆) y alcoxi (C₁-C₆);
- 30 R¹⁷ es un radical heteroaromático seleccionado entre el grupo constituido por piridilo, pirimidinilo, piridazinilo, pirazinilo, triazinilo, tienilo, tiazolilo, tiadiazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, furilo, pirrolilo, pirazolilo, imidazolilo y triazolilo, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos por uno o más radicales seleccionados entre el grupo constituido por halógeno, alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆) y alcoxi (C₁-C₆), y cuyo radical heteroaromático está sustituido por R¹⁵, R¹⁶ u OR¹⁶;
- 35 R¹⁸ es fenilo no sustituido o sustituido por uno o más radicales seleccionados entre el grupo constituido por halógeno, alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆) y alcoxi (C₁-C₆);
- R¹⁹ es alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆), R¹⁸ o -(C₁-C₆)-alquilo-(C₁-C₃)-alcoxi;
- n, p y q son independientemente cada uno cero, uno o dos, y cada heterocíclico en los radicales mencionados anteriormente es independientemente un radical heterocíclico que
- 40 tiene de 3 a 6 átomos de anillo y 1, 2 ó 3 heteroátomos en el anillo, seleccionados entre el grupo constituido por N, O y S.
- o una sal del mismo aceptable como pesticida.
- Estos compuestos poseen valiosas propiedades pesticidas.
- 45 **[0004]** La invención también abarca cualquier estereoisómero, enantiómero o isómero geométrico, y mezclas de los mismos. Mediante la expresión "sales aceptables como pesticidas" se quiere decir sales cuyos aniones o cationes son conocidos y aceptados en la técnica para la formación de sales para uso como pesticidas. Entre las sales con bases aceptables, por ejemplo, formadas por los compuestos de fórmula (I) que contienen un ácido carboxílico o grupo sulfonamida, se incluyen sales de metales alcalinos (p. ej., sodio y potasio), metales alcalinotérreos (p. ej., calcio y magnesio), amonio y amina (p. ej., dietanolamina, trietanolamina, octilamina, morfolina y diocilmetilamina). Entre las sales de adición de ácido, p. ej., formadas por compuestos de fórmula (I) que contienen un grupo amino, se incluyen sales con ácidos inorgánicos, por ejemplo, clorhidratos, sulfatos, fosfatos y nitratos y sales con ácidos orgánicos, por ejemplo, ácido acético.
- 50
- 55 **[0005]** En la presente memoria descriptiva de patente, incluyendo las reivindicaciones acompañantes, los sustituyentes mencionados anteriormente tienen los significados siguientes:

Átomo de halógeno significa flúor, cloro, bromo o yodo.

[0006] El término "halo" antes del nombre de un radical significa que este radical está parcial y completamente halogenado, es decir, que está sustituido por F, Cl, Br o I en cualquier combinación, preferiblemente por F o Cl.

- 5 Los grupos alquilo y las porciones de los mismos (siempre que no se indique otra cosa) pueden ser de cadena recta o ramificada.
La expresión "alquilo (C₁-C₆)" se entenderá que significa un radical hidrocarburo no ramificado o ramificado que tiene 1, 2, 3, 4, 5 ó 6 átomos de carbono, como, por ejemplo, un radical metilo, etilo, propilo, isopropilo, 1-butilo, 2-butilo, 2-metilpropilo y terc-butilo.
- 10 Los radicales alquilo y también en grupos compuestos, siempre que no se defina otra cosa, preferiblemente tienen de 1 a 4 átomos de carbono.
"Haloalquilo (C₁-C₆)" significa un grupo alquilo mencionado dentro de la expresión "alquilo (C₁-C₆)" en el que se han sustituido uno o más átomos de hidrógeno por el mismo número de átomos idénticos o diferentes de halógeno, como monohaloalquilo, perhaloalquilo, CF₃, CHF₂, CH₂F, CHFCH₃, CF₃CH₂, CF₃CF₂, CHF₂CF₂, CH₂FCHCl, CH₂Cl, CCl₃, CHCl₂ o CH₂CH₂Cl.
- 15 La expresión "-(C₁-C₄)-alquilo-(C₃-C₇)-cicloalquilo" significa un grupo alquilo (C₁-C₄) que está sustituido por un anillo cicloalquilo (C₃-C₇).
"Alcoxi (C₁-C₆)" significa un grupo alcoxi cuya cadena de carbonos tiene el significado dado en la expresión "alquilo (C₁-C₆)". "Haloalcoxi" es, por ejemplo, OCF₃, OCHF₂, OCH₂F, CF₃CF₂O, OCH₂CF₃ u OCH₂CH₂Cl.
- 20 "Alquenilo (C₂-C₆)" significa una cadena de carbonos no ramificada o ramificada no cíclica que tiene un número de átomos de carbono que se corresponde con este intervalo establecido y que contiene al menos un doble enlace que puede localizarse en cualquier posición de la cadena insaturada respectiva. "Alquenilo (C₂-C₆)" por consiguiente indica, por ejemplo, el grupo vinilo, alilo, 2-metil-2-propenilo, 2-butenilo, pentenilo, 2-metilpentenilo o hexenilo.
"Alquinilo (C₂-C₆)" significa una cadena de carbonos no ramificada o ramificada no cíclica que tiene un número de átomos de carbono que se corresponde con este intervalo establecido y que contiene al menos un triple enlace que puede localizarse en cualquier posición de la cadena insaturada respectiva. Por consiguiente, "alquinilo (C₂-C₆)" indica, por ejemplo, el grupo propargilo, 1-metil-2-propinilo, 2-butenilo o 3-butenilo.

- [0007]** Los grupos cicloalquilo preferiblemente tienen de tres a siete átomos de carbono en el anillo y están opcionalmente sustituidos por halógeno o alquilo.

En compuestos de fórmula (I) se proporcionan los siguientes ejemplos de radicales:

- 35 Un ejemplo de alquilo sustituido por cicloalquilo es ciclopropilmetilo;
Un ejemplo de alquilo sustituido por alcoxi es metoximetilo (CH₃OCH₂-) y un ejemplo de alquilo sustituido por alquiltio es metiltiometilo (CH₃SCH₂-).
Anillo es un sistema mono o bicíclico aromático que contiene de seis a 10 átomos de carbono en el anillo, por ejemplo fenilo, naftilo, tetrahidronaftilo, indenilo, indanilo y similares, preferiblemente fenilo.
- 40 Un grupo "heterociclilo" puede estar saturado, insaturado o heteroaromático; contiene preferiblemente uno o más, en particular, 1, 2 ó 3, heteroátomos en el anillo heterocíclico, preferiblemente seleccionados entre el grupo constituido por N, O y S; preferiblemente es un radical heterociclilo alifático que tiene un anillo de 3 a 7 átomos o un radical heteroaromático que tiene un anillo de 5 ó 6 átomos. El radical heterocíclico puede ser, por ejemplo, un radical o anillo (heteroarilo) heteroaromático como, por ejemplo, un sistema aromático mono, bi o policíclico en el que al menos un anillo contiene uno o más heteroátomos, por ejemplo, piridilo, pirimidinilo, piridazinilo, pirazinilo, triazinilo, tienilo, tiazolilo, tiadiazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, furilo, pirrolilo, pirazolilo, imidazolilo y triazolilo y es un radical parcial o completamente hidrogenado, como oxiranilo, oxetanilo, oxolanilo (=tetrahidrofurilo), oxanilo, piperidilo, piperazinilo, dioxolanilo, oxazolinilo, isoxazolinilo, oxazolidinilo, isoxazolidinilo y morfolinilo. Además, el término "heterociclilo" incluye grupos heterociclilo fusionados, por ejemplo, bencimidazolilo, benzoxazolilo,
- 50 quinolinilo, ftalimido, indolilo y benzodioxolanilo. El grupo "heterociclilo" puede estar no sustituido o sustituido por uno o más radicales (preferiblemente 1, 2 ó 3 radicales) seleccionados entre el grupo compuesto de, por ejemplo, halógeno, alquilo, haloalquilo, alcoxi, OH y oxo. El grupo oxo también puede estar presente en aquellos heteroátomos del anillo en los que son posibles varios números de oxidación, por ejemplo, en el caso de N y S.
- 55 **[0008]** El término plagas significa plagas de artrópodos (incluyendo insectos y arácnidos) y helmintos (incluyendo nematodos).

[0009] Preferiblemente R¹ es CN.

- Preferiblemente W es C-Cl.
 Preferiblemente R² es cloro.
 Preferiblemente R³ es CF₃ u OCF₃ (más preferiblemente R³ es CF₃).
- 5 Preferiblemente, R⁴ es H, alqueno (C₃-C₆), alquino (C₃-C₆), cicloalquilo (C₃-C₇), -CO₂-(C₁-C₆)-alquilo, -(CH₂)_qR⁷ o COCH₂NR⁸R⁹; o alquilo (C₁-C₆) no sustituido o sustituido por uno o más radicales seleccionados entre el grupo constituido por halógeno, cicloalquilo (C₃-C₇) y S(O)_pR¹¹. Más preferiblemente, R⁴ es metilo.
 Preferiblemente R⁵ es R¹³ o R¹⁰; o alquilo (C₁-C₆) no sustituido o sustituido por uno o más radicales seleccionados entre el grupo constituido por halógeno, R¹³ y R¹⁰. Preferiblemente R⁶ es haloalquilo (C₁-C₂) (más preferiblemente R⁶ es CF₃).
- 10 Preferiblemente R⁷ es fenilo no sustituido o sustituido por uno o más radicales seleccionados entre el grupo constituido por halógeno, alquilo (C₁-C₃), haloalquilo (C₁-C₃), alcoxi (C₁-C₃), haloalcoxi (C₁-C₃), S(O)_pR¹¹ y NR₉R¹² (más preferiblemente R⁷ es fenilo no sustituido o sustituido por uno o más radicales seleccionados entre el grupo constituido por halógeno, alquilo (C₁-C₂), haloalquilo (C₁-C₂) y alcoxi (C₁-C₂)).
 Preferiblemente R⁸ es H, alquilo (C₁-C₆) o haloalquilo (C₁-C₆) (más preferiblemente R⁸ es H o alquilo (C₁-C₃)).
- 15 Preferiblemente R⁹ y R¹² son independientemente cada uno H, alquilo (C₁-C₃) o haloalquilo (C₁-C₃); o R⁸ y R⁹ junto con el átomo de N unido forman un anillo saturado de 5 ó 6 átomos que opcionalmente contiene un heteroátomo adicional en el anillo que se selecciona entre O, S y N, estando el anillo no sustituido o sustituido por uno o más radicales seleccionados entre el grupo constituido por halógeno y alquilo (C₁-C₃) (más preferiblemente R⁹ es H o alquilo (C₁-C₃)).
- 20 Preferiblemente R¹⁰ es heterociclilo no sustituido o sustituido por uno o más radicales seleccionados entre el grupo constituido por halógeno, alquilo (C₁-C₃), haloalquilo (C₁-C₃), alcoxi (C₁-C₃), S(O)_pR¹⁴, OH y oxo (más preferiblemente R¹⁰ es heterociclilo no sustituido o sustituido por uno o más radicales seleccionados entre el grupo constituido por halógeno, alquilo (C₁-C₂), haloalquilo (C₁-C₂) y S(O)_pR¹⁴).
- 25 **[0010]** Preferiblemente R¹¹ y R¹⁴ son independientemente cada uno alquilo (C₁-C₃) o haloalquilo (C₁-C₃).
 Preferiblemente R¹³ es fenilo no sustituido o sustituido por uno o más radicales seleccionados entre el grupo constituido por halógeno, alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆), haloalcoxi (C₁-C₆), CN, NO₂, S(O)_pR¹¹, NR⁸R⁹, COR¹¹, COR⁷, CONR⁸R⁹, SO₂NR⁸R⁹, OH, SO₃H y alquilidenimino (C₁-C₆) (más preferiblemente R¹³ es fenilo no sustituido o sustituido por uno o más radicales seleccionados entre el grupo constituido por halógeno, alquilo (C₁-C₂), haloalquilo (C₁-C₂), alcoxi (C₁-C₂), haloalcoxi (C₁-C₂), CN, NO₂, S(O)_pR¹¹ y NR⁸R⁹).
 Preferiblemente q es 0 o 1.
 Preferiblemente cada heterociclilo en los radicales mencionados anteriormente es independientemente un radical heteroaromático que tiene un anillo de 5 ó 6 átomos y 1, 2 ó 3 heteroátomos en el anillo seleccionados entre el grupo constituido por N, O y S (más preferiblemente cada heterociclilo en los radicales mencionados anteriormente es independientemente un radical heteroaromático seleccionado entre el grupo constituido por piridilo, pirimidinilo, piridazinilo, pirazinilo, triazinilo, tienilo, tiazolilo, tiadiazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, furilo, pirrolilo, pirazolilo, imidazolilo y triazolilo).
- 35 **[0011]** Una clase preferida de compuestos de fórmula (I) es aquella en que:
- 40 R¹ es alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆), CN, C(S)NH₂ u halógeno;
 W es N, C-CH₃ o C-halógeno;
 R² es H, CH₃ o halógeno;
 R³ es halo, alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆), haloalcoxi (C₁-C₆), S(O)_p-(C₁-C₆)-haloalquilo o SF₅;
 R⁴ es H, alqueno (C₂-C₆), haloalqueno (C₂-C₆), alquino (C₂-C₆), haloalquino (C₂-C₆), cicloalquilo (C₃-C₇), -CO₂-(C₁-C₆)-alquilo, -CO₂-(C₃-C₇)-cicloalquilo, -CO₂-(C₁-C₄)-alquil-(C₃-C₇)-cicloalquilo, -CO₂-(C₃-C₆)-alqueno, -CO₂-(C₃-C₆)-alquino, -CO₂-(CH₂)_qR⁷, CONR⁸R⁹, -CO₂-(CH₂)_qR¹⁰, -(CH₂)_qR⁷, -(CH₂)_qR¹⁰, COR⁹, COCH₂NR⁸R⁹, -CO-(CH₂)_qR⁷ o -CO-(CH₂)_qR¹⁰; o alquilo (C₁-C₆) no sustituido o sustituido por uno o más radicales seleccionados entre el grupo constituido por halógeno, alcoxi (C₁-C₆), haloalcoxi (C₁-C₆), cicloalquilo (C₃-C₇), S(O)_pR¹¹, CO₂-(C₁-C₆)-alquilo, -O(C=O)-(C₁-C₆)-alquilo, NR⁸R⁹, CONR⁸R⁹, SO₂NR⁸R⁹, OH, CN, NO₂, OR⁷, OR¹⁰, NR⁸COR¹² y NR⁸SO₂R¹¹;
- 50 R⁵ es cicloalquilo (C₃-C₇), alqueno (C₂-C₆), haloalqueno (C₂-C₆), R¹³, R¹⁰, R¹⁷ o -CH=CH-R¹⁵; o es alquilo (C₁-C₆) sustituido o no sustituido por uno o más radicales seleccionados entre el grupo constituido por halógeno, alcoxi (C₁-C₆), haloalcoxi (C₁-C₆), alquenoiloxi (C₃-C₆), haloalquenoiloxi (C₃-C₆), alquinoiloxi (C₃-C₆), haloalquinoiloxi (C₃-C₆), cicloalquilo (C₃-C₇), S(O)_pR⁷, S(O)_pR¹⁰, S(O)_pR¹¹, CN, NO₂, OH, COR⁸, NR⁸COR¹², NR⁸SO₂R¹¹, CONR⁸R⁹, NR⁸R⁹, OR⁷, OR¹⁰, R¹³, R¹⁰ y CO₂R⁸, o un grupo metileno en el alquilo (C₁-C₆) sustituido o no sustituido está reemplazado por un grupo seleccionado entre -CO-, -O-, -S(O)_p-, -NR⁸-, -COO-, -OCO-, -CONR⁸-, -NR⁸CO-, -C(=NOR⁸)-, -C(=NR⁸R⁹)- y -C(=NR⁸)- siempre que el grupo sustituyente no se una directamente al grupo SO₂ en la fórmula (I);
 R⁶ y R¹¹ son independientemente cada uno alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆), alqueno (C₂-C₆), haloalqueno (C₂-C₆), alquino (C₂-C₆), haloalquino (C₂-C₆) o cicloalquilo (C₃-C₇);

- R^7 es fenilo no sustituido o sustituido por uno o más radicales seleccionados entre el grupo constituido por halógeno, alquilo (C_1-C_6), haloalquilo (C_1-C_6), alcoxi (C_1-C_6), haloalcoxi (C_1-C_6), CN, NO_2 , $S(O)_pR^{11}$ y NR^9R^{12} ;
 R^8 es H, alquilo (C_1-C_6), haloalquilo (C_1-C_6), cicloalquilo (C_3-C_7), $-(C_1-C_4)$ -alquil- (C_3-C_7) -cicloalquilo, $-(CH_2)_qR^7$ o $-(CH_2)_qR^{10}$;
- 5 R^9 y R^{12} son independientemente cada uno H, alquilo (C_1-C_6), haloalquilo (C_1-C_6), cicloalquilo (C_3-C_7) o $-(C_1-C_4)$ -alquil- (C_3-C_7) -cicloalquilo; o
 R^8 y R^9 junto con el átomo de N unido forman un anillo saturado de cinco o seis átomos que opcionalmente contiene un heteroátomo adicional en el anillo que se selecciona entre O, S y N, estando el anillo no sustituido o sustituido por uno o más radicales seleccionados entre el grupo constituido por halógeno, alquilo (C_1-C_6) y haloalquilo (C_1-C_6);
- 10 R^{10} es heterociclilo no sustituido o sustituido por uno o más radicales seleccionados entre el grupo constituido por halógeno, alquilo (C_1-C_4), haloalquilo (C_1-C_4), alcoxi (C_1-C_4), $S(O)_pR^{14}$, OH, OR^7 y oxo;
 R^{13} es arilo no sustituido o sustituido por uno o más radicales seleccionados entre el grupo constituido por halógeno, alquilo (C_1-C_6), haloalquilo (C_1-C_6), alcoxi (C_1-C_6), haloalcoxi (C_1-C_6), CN, NO_2 , $S(O)_pR^{11}$, SF_5 , NR^8R^9 , COR^{11} , COR^7 , $CONR^8R^9$, $SO_2NR^8R^9$, OH, OR^7 , R^{15} , R^{16} , OR^{16} , SO_3H y alquilidenimino (C_1-C_6);
- 15 R^{14} es alquilo (C_1-C_6) o haloalquilo (C_1-C_6);
 R^{15} es fenilo o naftilo cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos por uno o más radicales seleccionados entre el grupo constituido por halógeno, alquilo (C_1-C_6), haloalquilo (C_1-C_6) y alcoxi (C_1-C_6);
 R^{16} es un radical heteroaromático seleccionado entre el grupo constituido por piridilo, pirimidinilo, piridazinilo, pirazinilo, triazinilo, tienilo, tiazolilo, tiadiazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, furilo, pirrolilo, pirazolilo, imidazolilo y triazolilo, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos por uno o más radicales seleccionados entre el grupo constituido por halógeno, alquilo (C_1-C_6), haloalquilo (C_1-C_6) y alcoxi (C_1-C_6);
- 20 R^{17} es un radical heteroaromático seleccionado entre el grupo constituido por piridilo, pirimidinilo, piridazinilo, pirazinilo, triazinilo, tienilo, tiazolilo, tiadiazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, furilo, pirrolilo, pirazolilo, imidazolilo y triazolilo, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos por uno o más radicales seleccionados entre el grupo constituido por halógeno, alquilo (C_1-C_6), haloalquilo (C_1-C_6) y alcoxi (C_1-C_6), y cuyo radical heteroaromático está sustituido por R^{15} , R^{16} u OR^{16} ;
- 25 n, p y q son independientemente cada uno cero, uno o dos, y
cada heterociclilo en los radicales mencionados anteriormente es independientemente un radical heterocíclico que tiene de 3 a 6 átomos y 1, 2 ó 3 heteroátomos en el anillo, seleccionados entre el grupo constituido por N, O y S.
- 30 **[0012]** Una clase preferida adicional de compuestos de fórmula (I) es aquella en que:
- R^1 es CN;
W es C-Cl;
- 35 R^2 es cloro;
 R^3 es CF_3 u OCF_3 ;
 R^4 es H, alqueno (C_3-C_6), alquino (C_3-C_6), cicloalquilo (C_3-C_7), $-CO_2-(C_1-C_6)$ -alquilo, $-(CH_2)_qR^7$ o $COCH_2NR^8R^9$; o alquilo (C_1-C_6) no sustituido o sustituido por uno o más radicales seleccionados entre el grupo constituido por halógeno, cicloalquilo (C_3-C_7) y $S(O)_pR^{11}$ (más preferiblemente R^4 es metilo);
- 40 R^5 es R^{13} o R^{10} ; o alquilo (C_1-C_6) no sustituido o sustituido por uno o más radicales seleccionados entre el grupo constituido por halógeno, R^{13} y R^{10} ;
 R^6 es haloalquilo (C_1-C_2);
 R^7 es fenilo no sustituido o sustituido por uno o más radicales seleccionados entre el grupo constituido por halógeno, alquilo (C_1-C_3), haloalquilo (C_1-C_3), alcoxi (C_1-C_3), haloalcoxi (C_1-C_3), $S(O)_pR^{11}$ y NR^9R^{12} ;
- 45 R^8 es H, alquilo (C_1-C_6) o haloalquilo (C_1-C_6);
 R^9 y R^{12} son independientemente cada uno H, alquilo (C_1-C_3) o haloalquilo (C_1-C_3) o
 R^8 y R^9 junto con el átomo de N unido forman un anillo saturado de cinco o seis átomos que opcionalmente contiene un heteroátomo adicional en el anillo que se selecciona entre O, S y N, estando el anillo no sustituido o sustituido por uno o más radicales seleccionados entre el grupo constituido por halógeno y alquilo (C_1-C_3);
- 50 R^{10} es heterociclilo no sustituido o sustituido por uno o más radicales seleccionados entre el grupo constituido por halógeno, alquilo (C_1-C_3), haloalquilo (C_1-C_3), alcoxi (C_1-C_3), $S(O)_pR^{14}$, OH y oxo;
 R^{11} y R^{14} son independientemente cada uno alquilo (C_1-C_3) o haloalquilo (C_1-C_3);
 R^{13} es fenilo no sustituido o sustituido por uno o más radicales seleccionados entre el grupo constituido por halógeno, alquilo (C_1-C_6), haloalquilo (C_1-C_6), alcoxi (C_1-C_6), haloalcoxi (C_1-C_6), CN, NO_2 , $S(O)_pR^{11}$, NR^8R^9 , COR^{11} , COR^7 , $CONR^8R^9$, $SO_2NR^8R^9$, OH, SO_3H y alquilidenimino (C_1-C_6);
- 55 n, p y q son independientemente cada uno 0, 1 ó 2; y
cada heterociclilo en los radicales mencionados anteriormente es independientemente un radical heteroaromático que tiene 5 ó 6 átomos y 1, 2 ó 3 heteroátomos en el anillo, seleccionados entre el grupo constituido por N, O y S.

[0013] Una clase más preferida de compuestos de fórmula (I) es aquella en que:

- R¹ es CN;
 W es C-Cl;
 5 R² es cloro;
 R³ es CF₃;
 R⁴ es H, alqueno (C₃-C₄), alquino (C₃-C₄), cicloalquilo (C₃-C₆), -CO₂-(C₁-C₆)-alquilo, -(CH₂)_qR⁷ o COCH₂NR⁸R⁹; o alquilo (C₁-C₄) no sustituido o sustituido por uno o más radicales seleccionados entre el grupo constituido por halógeno, cicloalquilo (C₃-C₆) y S(O)_pR¹¹ (más preferiblemente R⁴ es metilo);
 10 R⁵ es R¹³ o R¹⁰; o alquilo (C₁-C₄) no sustituido o sustituido por uno o más radicales seleccionados entre el grupo constituido por halógeno, R¹³ y R¹⁰;
 R⁶ es CF₃;
 R⁷ es fenilo no sustituido o sustituido por uno o más radicales seleccionados entre el grupo constituido por halógeno, alquilo (C₁-C₂), haloalquilo (C₁-C₂) y alcoxi (C₁-C₂);
 15 R⁸ es H o alquilo (C₁-C₃);
 R⁹ es H o alquilo (C₁-C₃);
 R¹⁰ es heterociclilo no sustituido o sustituido por uno o más radicales seleccionados entre el grupo constituido por halógeno, alquilo (C₁-C₂), haloalquilo (C₁-C₂), alcoxi (C₁-C₂) y S(O)_pR¹⁴;
 R¹¹ y R¹⁴ son independientemente cada uno alquilo (C₁-C₂) o haloalquilo (C₁-C₂);
 20 R¹³ es fenilo no sustituido o sustituido por uno o más radicales seleccionados entre el grupo constituido por halógeno, alquilo (C₁-C₂), haloalquilo (C₁-C₂), alcoxi (C₁-C₂), haloalcoxi (C₁-C₂), CN, NO₂, S(O)_pR¹¹ y NR⁸R⁹;
 n y p son independientemente cada uno 0, 1 ó 2, y
 q es 0 o 1, y
 cada heterociclilo en los radicales mencionados anteriormente es independientemente un radical heteroaromático
 25 seleccionado entre el grupo constituido por piridilo, pirimidinilo, piridazinilo, pirazinilo, triazinilo, tienilo, tiazolilo, tiadiazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, furilo, pirrolilo, pirazolilo, imidazolilo y triazolilo.

[0014] Una clase preferida adicional de compuestos de fórmula (I) es aquella en que:

- 30 R¹ es CN;
 W es C-Cl;
 R² es cloro;
 R³ es CF₃;
 R⁴ es H, alqueno (C₃-C₄), alquino (C₃-C₄), cicloalquilo (C₃-C₆), -CO₂-(C₁-C₃)-alquilo o (CH₂)_qR⁷ en la que R⁷ es
 35 fenilo no sustituido o sustituido por uno o más radicales halógeno, o alquilo (C₁-C₄) no sustituido o sustituido por uno o más radicales seleccionados entre el grupo constituido por halógeno, cicloalquilo (C₃-C₆) y S(O)_pR¹¹ en el que R¹¹ es alquilo (C₁-C₄) o haloalquilo (C₁-C₄) (más preferiblemente R⁴ es metilo);
 R⁵ es cicloalquilo (C₃-C₆); o es fenilo, bencilo o fenetilo cuyos últimos tres grupos mencionados están no sustituidos o sustituidos por uno o más radicales seleccionados entre el grupo constituido por halógeno, alquilo (C₁-C₄),
 40 haloalquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄), fenilo, naftilo, -CO₂-(C₁-C₄)-alquilo, fenoxi no sustituidos o sustituidos por uno o más radicales halógeno y S(O)_pR¹¹ en el que R¹¹ es alquilo (C₁-C₄) o haloalquilo (C₁-C₄); o es R¹⁰ o -CH₂R¹⁰ en el que R¹⁰ es piridilo, pirimidilo, tienilo, pirazolilo, imidazolilo, tiazolilo, pirrolilo, tetrazolilo, triazolilo o furilo no sustituido o sustituido por uno o más radicales halógeno; o es alquilo (C₁-C₄) no sustituido o sustituido por uno o más radicales seleccionados entre el grupo constituido por halógeno, S(O)_pR¹¹ en el que R¹¹ es alquilo (C₁-C₄)
 45 o haloalquilo (C₁-C₄) y NR⁸R⁹; en la que R⁸ y R⁹ son independientemente cada uno H o alquilo (C₁-C₄);
 R⁶ es CF₃;
 n y p son independientemente cada uno 0, 1 ó 2; y
 q es 0 o 1.

50 **[0015]** Una clase preferida adicional de compuestos de fórmula (I) es aquella en que:

- R¹ es CN;
 W es C-Cl;
 R² es cloro;
 55 R³ es CF₃;
 R⁴ es H, alqueno (C₃-C₄), alquino (C₃-C₄), cicloalquilo (C₃-C₆), -CO₂-(C₁-C₃)-alquilo o -(CH₂)_qR⁷ en el que R⁷ es fenilo no sustituido o sustituido por uno o más radicales halógeno, o alquilo (C₁-C₄) no sustituido o sustituido por uno o más radicales seleccionados entre el grupo constituido por halógeno, alcoxi (C₃-C₆) y cicloalquilo (C₃-C₆) (más preferiblemente R⁴ es metilo);

R⁵ es alqueno (C₃-C₄), cicloalquilo (C₃-C₆) o CH=CH-fenilo; o alquilo (C₁-C₄) no sustituido o sustituido por uno o más radicales seleccionados entre el grupo constituido por halógeno, S(O)_p(C₁-C₄)-alquilo, alcoxi (C₁-C₄) y NR⁸R⁹ en el que R⁸ y R⁹ son independientemente cada uno H o alquilo (C₁-C₄); o junto con el átomo de N unido forman un anillo saturado de cinco o seis átomos que opcionalmente contiene un heteroátomo adicional en el anillo que se selecciona entre O, S y N;
 5 R⁶ es CF₃;
 n y p son independientemente cada uno 0, 1 ó 2; y
 q es 0 o 1.

10 **[0016]** Una clase preferida adicional de compuestos de fórmula (I) es aquella en que:

R¹ es CN;

W es C-Cl;

R² es cloro;

15 R³ es CF₃;

R⁴ es alquilo (C₁-C₄) (más preferiblemente R⁴ es metilo);

R⁵ es fenilo no sustituido o sustituido por uno o más radicales seleccionados entre el grupo constituido por halógeno, alquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄), cicloalquilo (C₃-C₆), alcoxi (C₁-C₄), haloalcoxi (C₁-C₄), S(O)_p(C₁-C₄)-alquilo, S(O)_p(C₁-C₄)-haloalquilo, NO₂, SF₅, naftilo, -CO₂-(C₁-C₄)-alquilo y benzodioxolanilo, o fenilo sustituido por fenoxi, estando este último grupo mencionado no sustituido o sustituido por uno o más radicales seleccionados entre el grupo constituido por halógeno, alquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄) y alcoxi (C₁-C₄) o fenilo sustituido por fenilo estando este último grupo mencionado no sustituido o sustituido por uno o más radicales seleccionados entre el grupo constituido por halógeno, alquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄) y alcoxi (C₁-C₄).

R⁶ es CF₃; y

20 n y p son independientemente cada uno 0, 1 ó 2.

[0017] Una clase preferida adicional de compuestos de fórmula (I) es aquella en que:

R¹ es CN;

30 W es C-Cl;

R² es cloro;

R³ es CF₃;

R⁴ es alquilo (C₁-C₄) (más preferiblemente R⁴ es metilo);

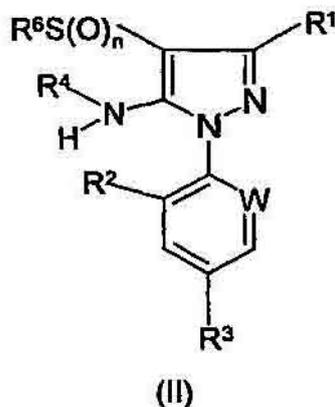
R⁵ es piridilo, pirimidilo, pirazolilo, imidazolilo, tiazolilo, pirrolilo, tetrazolilo, triazolilo, furilo, tetrahydrofurilo o tetrahidrotienilo, estando estos últimos 11 grupos mencionados no sustituidos o sustituidos por uno o más radicales seleccionados entre el grupo constituido por halógeno, alquilo (C₁-C₄) y haloalquilo (C₁-C₄); o tienilo no sustituido o sustituido por uno o más radicales seleccionados entre el grupo constituido por halógeno, alquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄) y piridilo;

R⁶ es CF₃; y

40 n es 0, 1 ó 2.

[0018] Los compuestos de fórmula general (I) pueden prepararse mediante la aplicación o adaptación de procedimientos conocidos (es decir, procedimientos utilizados o descritos anteriormente en la bibliografía química). En la siguiente descripción de los procesos cuando aparecen símbolos en las fórmulas que no están específicamente definidos, se entiende que son "como se define anteriormente" según la primera definición de cada símbolo en la memoria descriptiva.

[0019] Según una característica adicional de la invención, los compuestos de fórmula (I) en los que R¹, R⁷, R³, R⁴, R⁵, R⁶, W y n son como se define anteriormente, pueden prepararse mediante la reacción de un compuesto de fórmula (II):



en la que R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^6 , W y n son como se define anteriormente, con un compuesto de fórmula (III):



en el que R^5 es como se define anteriormente y L^1 es un grupo saliente, generalmente halógeno y preferiblemente, cloro. La reacción se realiza generalmente en presencia de una base como hidruro sódico, en un solvente como dioxano, tetrahidrofurano o N,N-dimetilformamida, a una temperatura de 0° a 100° C (preferiblemente 0° a 50° C).

10 **[0020]** Según una característica adicional de la invención, los compuestos de fórmula (I) en los que R^1 , R^2 , R^3 , R^5 , R^6 , W y n son como se define anteriormente y R^4 es como se define anteriormente con la exclusión de hidrógeno, pueden también prepararse mediante la alquilación o acilación del compuesto correspondiente de fórmula (I) en el que R^4 es hidrógeno. Las reacciones de alquilación o acilación pueden realizarse según los
15 procedimientos generales descritos en las publicaciones de patente números WO 93/06089, WO 94/21606, WO 87/03781, EP 0295117 y U.S. 5.232.940.

20 **[0021]** Según una característica adicional de la invención, los compuestos de fórmula (I) en los que R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 y W son como se define anteriormente y n es 1 ó 2 pueden prepararse mediante oxidación de un compuesto correspondiente en el que n es 0 ó 1. La oxidación generalmente se realiza usando un perácido, como ácido 3-cloroperbenzoico, en un solvente como diclorometano o 1,2-dicloroetano, a una temperatura de 0° C a la temperatura de reflujo del solvente.

25 **[0022]** Las colecciones de compuestos de la fórmula (I) que pueden sintetizarse mediante el proceso mencionado anteriormente también pueden prepararse de forma paralela y esto puede efectuarse manualmente o de forma semiautomática o completamente automática. En este caso, es posible, por ejemplo, automatizar el proceso de la reacción, tratamiento final o purificación de los productos o de los compuestos intermedios. En total, se entenderá que significa un procedimiento como los descritos, por ejemplo, en S.H. DeWitt en "Annual Reports in
30 Combinatorial Chemistry and Molecular Diversity: Automated Synthesis", Volumen 1, Verlag Escom 1997, páginas 69 a 77.

35 **[0023]** Una serie de equipos disponibles en el mercado como los ofrecidos, por ejemplo, por Stem Corporation, Woodrolfe Road, Tollesbury, Essex, CM9 8SE, Inglaterra, H+P Labortechnik GmbH, Bruckmannring 28, 85764 Oberschleißheim, Alemania o Radleys, Shirehill, Saffron Walden, Essex, Inglaterra, pueden usarse para el procedimiento paralelo de reacción y tratamiento final. Para la purificación paralela de los compuestos de fórmula (I) o de los productos intermedios obtenidos durante la preparación, pueden usarse, entre otros, equipos cromatográficos, por ejemplo, los de ISCO, Inc., 4700 Superior Street, Lincoln, NE 68504, EE.UU.

40 **[0024]** Los equipos mencionados llevan a un procedimiento modular en el que las etapas del proceso individual están automatizadas, aunque deben realizarse operaciones manuales entre las etapas del proceso. Esto puede prevenirse empleando sistemas de automatización semi-integrados o completamente integrados en los que los módulos de automatización en cuestión están controlados mediante, por ejemplo, robots. Dichos sistemas de

automatización pueden obtenerse, por ejemplo, de Zymark Corporation, Zymark Center, Hopkinton, MA 01748, EE.UU.

[0025] Además de lo descrito en este documento, pueden prepararse compuestos de fórmula (I) en parte o por completo mediante procedimientos en fase sólida. Para este fin, las etapas intermedias individuales o todas las etapas intermedias de la síntesis o de una síntesis adaptada para cubrir el procedimiento en cuestión están ligadas a una resina sintética. Los procedimientos de síntesis en fase sólida se describen exhaustivamente en la bibliografía especializada, por ejemplo, Barry A. Bunin en "The Combinatorial Index", Academic Press, 1998. El uso de procedimientos de síntesis en fase sólida permite una serie de protocolos que son bien conocidos en la bibliografía y que, por turnos, pueden realizarse manualmente y de forma automatizada. Por ejemplo, el "procedimiento de la bolsa de té" (Houghten, documento US 4.631.211; Houghten y col., Proc. Natl. Acad. Sci, 1985, 82, 5131-5135) en el que se emplean productos de IRORI, 11149 North Torrey Pines Road, La Jolla, CA 92037, EE.UU., pueden ser semiautomáticos. La automatización de las síntesis paralelas en fase sólida se realiza de forma eficaz, por ejemplo, mediante los equipos de Argonaut Technologies, Inc., 887 Industrial Road, San Carlos, CA 94070, EE.UU. o MultiSynTech GmbH, Wullener Feld 4, 58454 Witten, Alemania.

[0026] La preparación de los procesos descritos en este documento produce compuestos de fórmula (I) en forma de colecciones de sustancias que se denominan bibliotecas. La presente invención también se refiere a bibliotecas que comprenden al menos dos compuesto de fórmula (I).

[0027] Los productos intermedios de fórmula (II) en los que L es cloro, bromo o yodo pueden prepararse según procedimientos conocidos, por ejemplo, como se describe en el documento EP 0295117, mediante diazotización de la amina correspondiente de fórmula (VIII), generalmente usando un nitrito de alquilo, como nitrito de t-butilo, en presencia de un agente halogenante adecuado, preferiblemente bromoformo, yodo o cloruro cúprico anhidro, opcionalmente en presencia de un solvente como acetonitrilo o cloroformo, a una temperatura de 0° a 100°C.

[0028] Los compuestos de fórmula (II) y (III) son conocidos o pueden prepararse mediante procedimientos conocidos.

[0029] Los ejemplos siguientes no limitantes ilustran la preparación de los compuestos de fórmula (I).

Ejemplos químicos

Ejemplo 1
1-(2,6-Dicloro-4-trifluorometilfenil)-3-ciano-5-(N-bencilsulfonil-N-metilamino)-4-trifluorometilsulfonilpirazol (compuesto número 2-16)

[0030] A una solución de 1-(2,6-dicloro-4-trifluorometilfenil)-3-ciano-5-metilamino-4-trifluorometilsulfonilpirazol (2,0 g, 4,0 mmoles) en tetrahidrofurano se le añadió hidruro sódico (al 60%, 0,144 g, 6,0 mmoles). Después de agitar durante 1 hora a 20°C, se añadió gota a gota cloruro de bencilsulfonilo (1,14 g, 6,0 mmoles). La mezcla se agitó durante 8 horas más a 20°C. Se añadió cloruro amónico acuoso y el tratamiento final de extracción con carbonato sódico acuoso y diclorometano produjo un sólido que se lavó con heptano-acetato de etilo (1:1), se filtró y secó para obtener el compuesto del título (1,5 g, Compuesto 2-16) como un sólido de color blanquecino, p.f. 161°C.

Ejemplo 2
1-(2,6-Dicloro-4-trifluorometilfenil)-5-[N-(3-cloropropilsulfonil)-N-metilamino]-3-ciano-4-trifluorometilsulfonilpirazol (compuesto número 1-121)

[0031] A una solución de 1-(2,6-dicloro-4-trifluorometilfenil)-3-ciano-5-metilamino-4-trifluorometilsulfonilpirazol (1,0 g, 2,1 mmoles) en tetrahidrofurano se le añadió hidruro sódico (al 60%, 0,1 g, 3,0 mmoles). Después de agitar durante 1 hora a 20°C, se añadió gota a gota cloruro de 3-cloropropilsulfonilo (0,52 g, 3,0 mmoles). La mezcla se agitó durante 8 horas más a 20°C. Se añadió cloruro de amonio acuoso y el tratamiento final de extracción con carbonato sódico acuoso y diclorometano produjo un sólido que se lavó con heptano-acetato de etilo (1:1), se filtró y secó para obtener el compuesto del título (0,15 g, Compuesto 1-121) como un sólido de color beige.

Ejemplo 3
1-(2,6-Dicloro-4-trifluorometilfenil)-5-[N-(4-clorofenilsulfonil)-N-metilamino]-3-ciano-4-trifluorometiltiopirazol (compuesto número 5-3)

[0032] A una solución de 1-(2,6-dicloro-4-trifluorometilfenil)-3-ciano-5-metilamino-4-trifluorometiltiopirazol (0,5 g, 1,0 mmoles) en tetrahidrofurano se le añadió 4-dimetilaminopiridina (0,12 g, 1,0 mmoles) y trietilamina (0,4 g, 4,0 mmoles). Después de agitar durante 30 minutos a 20°C, se añadió gota a gota cloruro de 4-clorfenilsulfonilo (0,63 g, 3,0 mmoles) y la mezcla se calentó a reflujo durante 10 horas. Tras el tratamiento final de extracción con carbonato sódico acuoso y diclorometano, el producto se purificó mediante cromatografía eluida con heptano-diclorometano (1:1) para obtener el producto del título (0,02 g, Compuesto 5-3) como un sólido.

[0033] Los siguientes compuestos preferidos mostrados en las tablas 1 a 7 también forman parte de la presente invención y se prepararon o pueden prepararse con, o de forma análoga, los ejemplos 1 a 3 mencionados anteriormente y los procedimientos generales descritos anteriormente. En la tablas, i-Pr significa isopropilo, t-Bu significa terc-butilo, Ph significa fenilo y 4-(3,5-Cl₂-FeO) significa 4-(3,5-diclorofenoxi). Cuando se omiten los subíndices tras los átomos, se entenderá que se pretende que, por ejemplo, CH₃ signifique CH₃. No se muestran explícitamente los dobles y triples enlaces. El átomo de carbono del lado izquierdo de los valores R⁴ está unido al átomo N mostrado en fórmula (I), y el átomo de carbono del lado izquierdo de los valores R⁵ está unido al grupo SO₂ mostrado en la fórmula (I). Los números de los compuestos se dan sólo a fines de referencia.

Tabla 1: compuestos de fórmula (I) en los que R¹ es CN; R² es Cl; W es C-Cl; R³ es CF₃ y R⁶ es CF₃.

Número de compuesto	R ⁴	R ⁵	n	p.f. (°C)/RMN ¹ H NCH ₃
1-1	H	CH ₃	0	
1-2	CH ₃	CH ₃	0	152
1-3	CH ₂ CH ₃	CH ₃	0	
1-4	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	0	
1-5	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	0	
1-6	CH ₂ CHCH ₂	CH ₃	0	
1-7	CH ₂ CCH	CH ₃	0	
1-8	C(O)OCH ₃	CH ₃	0	
1-9	C(O)OCH ₂ CH ₃	CH ₃	0	
1-10	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	0	
1-11	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₃	0	
1-12	CH ₂ ciclopropilo	CH ₃	0	
1-13	ciclopropilo	CH ₃	0	
1-14	CH ₂ Ph	CH ₃	0	
1-15	H	CH ₃	1	
1-16	CH ₃	CH ₃	1	164
1-17	CH ₂ CH ₃	CH ₃	1	
1-18	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	1	
1-19	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	1	
1-20	CH ₂ CHCH ₂	CH ₃	1	
1-21	CH ₂ CCH	CH ₃	1	
1-22	C(O)OCH ₃	CH ₃	1	
1-23	C(O)OCH ₂ CH ₃	CH ₃	1	
1-24	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	1	
1-25	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₃	1	
1-26	CH ₂ ciclopropilo	CH ₃	1	
1-27	ciclopropilo	CH ₃	1	
1-28	CH ₂ Ph	CH ₃	1	
1-29	H	CH ₃	2	
1-30	CH ₃	CH ₃	2	
1-31	CH ₂ CH ₃	CH ₃	2	
1-32	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	2	
1-33	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₃	2	
1-34	CH ₂ CHCH ₂	CH ₃	2	

20

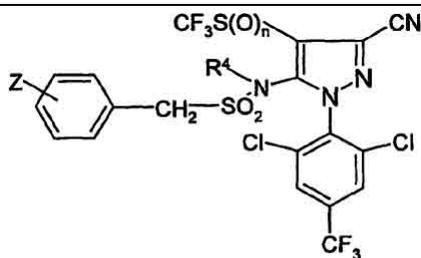
(continuación)

1-35	CH ₂ CCH	CH ₃	2	
1-36	C(O)OCH ₃	CH ₃	2	
1-37	C(O)OCH ₂ CH ₃	CH ₃	2	
1-38	CH ₂ OCH ₃	CH ₃	2	
1-39	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₃	2	
1-40	CH ₂ ciclopropilo	CH ₃	2	
1-41	ciclopropilo	CH ₃	2	
1-42	CH ₂ Ph	CH ₃	2	
1-43	H	CH ₂ CH ₃	0	
1-44	CH ₃	CH ₂ CH ₃	0	114
1-45	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	0	
1-46	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	0	
1-47	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	0	
1-48	CH ₂ CHCH ₂	CH ₂ CH ₃	0	
1-49	CH ₂ CCH	CH ₂ CH ₃	0	
1-50	C(O)OCH ₃	CH ₂ CH ₃	0	
1-51	C(O)OCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	0	
1-52	CH ₂ OCH ₃	CH ₂ CH ₃	0	
1-53	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	0	
1-54	CH ₂ ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	0	
1-55	Ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	0	
1-56	CH ₂ Ph	CH ₂ CH ₃	0	
1-57	H	CH ₂ CH ₃	1	Aceite
1-58	CH ₃	CH ₂ CH ₃	1	131
1-59	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	1	
1-60	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	1	
1-61	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	1	
1-62	CH ₂ CHCH ₂	CH ₂ CH ₃	1	
1-63	CH ₂ CCH	CH ₂ CH ₃	1	
1-64	C(O)OCH ₃	CH ₂ CH ₃	1	
1-65	C(O)OCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	1	
1-66	CH ₂ OCH ₃	CH ₂ CH ₃	1	
1-67	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	1	
1-68	CH ₂ ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	1	
1-69	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	1	
1-70	CH ₂ Ph	CH ₂ CH ₃	1	
1-71	H	CH ₂ CH ₃	2	
1-72	CH ₃	CH ₂ CH ₃	2	
1-73	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	2	
1-74	CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	2	
1-75	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	2	
1-76	CH ₂ CHCH ₂	CH ₂ CH ₃	2	
1-77	CH ₂ CCH	CH ₂ CH ₃	2	
1-78	C(O)OCH ₃	CH ₂ CH ₃	2	
1-79	C(O)OCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	2	
1-80	CH ₂ OCH ₃	CH ₂ CH ₃	2	
1-81	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	2	
1-82	CH ₂ ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	2	
1-83	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	2	
1-84	CH ₂ Ph	CH ₂ CH ₃	2	
1-85	CH ₃	iPr	1	3,38s,3H
1-86	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₃	1	140
1-87	CH ₃	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	1	3,38s,3H
1-88	CH ₃	CHCl ₂	1	

(continuación)

1-89	CH3	CH2Cl	1	112
1-90	CH3	CF3	1	112
1-91	CH3	CFH2	1	
1-92	CH3	CF2H	1	
1-93	CH3	C8H17	1	
1-94	CH3	C9H19	1	
1-95	CH3	C10 H21	1	
1-96	CH3	C12H25	1	
1-97	CH3	CHCH2	1	143
1-98	CH3	CH2CHCH2	1	
1-99	CH3	ciclo-C5H9	1	
1-100	CH3	ciclo-C6H11	1	
1-101	CH3	CH2CH2CH2Cl	1	3,40s,3H
1-102	CH3	CH2SO2CH3	1	
1-103	CH3	CH2NH2	1	
1-104	CH3	CH2NHCH3	1	
1-105	CH3	CH2N(CH3)2	1	
1-106	CH3	CH2NHCH2CH3	1	
1-107	CH3	CH2N(CH2CH3)2	1	
1-108	CH3	CH2CH2N (CH3)2	1	
1-109	CH3	CH2CH2N(CH2CH3)2	1	
1-110	CH3	CH2-N-morfolinilo	1	
1-111	CH3	CH2OCH3	1	
1-112	CH3	CH2OCH2CH3	1	
1-113	CH3	CH2SCH3	1	
1-114	CH3	CHCHFe	1	123
1-115	CH3	CHCHFe	2	138
1-116	Na	CH3	0	
1-117	H	CH2CH3	1	
1-118	CH3	CC13	1	99
1-119	CH3	CHCl2	1	3,58s,3H
1-120	CH3	CH2CH2CH2CH3	2	
1-121	CH3	CH2CH2CH2Cl	2	102
1-122	CH3	iPr	0	3,40s,3H
1-123	CH3	C8H17	1	93
1-124	CH3	C9H19	0	3,36s,3H
1-125	CH3	C1 0H21	0	3,38s,3H
1-126	CH3	C12H25	1	91
1-127	CH3	C8H17	2	3,42s,3H
1-128	CH3	C8H17	0	3,36s,3H
1-129	CH3	C12H25	0	3,38s,3H

Tabla 2: compuestos de fórmula (Ia)



(Ia)

Número de compuesto	R ⁴	Z	n	p. f. (°C)
2-1	H	H	0	
2-2	CH ₃	H	0	
2-3	CH ₂ CH ₃	H	0	
2-4	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	0	
2-5	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	0	
2-6	CH ₂ CHCH ₃	H	0	
2-7	CH ₂ CCH ₃	H	0	
2-8	C(O)OCH ₃	O	0	
2-9	C(O)OCH ₂ CH ₃	H	0	
2-10	CH ₂ OC H ₃	H	0	
2-11	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	H	0	
2-12	CH ₂ ciclopropilo	H	0	
2-13	Ciclopropilo	H	0	
2-14	CH ₂ Ph	H	0	
2-15	H	H	1	
2-16	CH ₃	H	1	161
2-17	CH ₂ CH ₃	H	1	
2-18	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	1	
2-19	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	1	
2-20	CH ₂ CHCH ₃	H	1	
2-21	CH ₂ CCH ₃	H	1	
2-22	C(O)OCH ₃	1	1	
2-23	C(O)OCH ₂ CH ₃	H	1	
2-24	CH ₂ OCH ₃	H	1	
2-25	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	H	1	
2-26	CH ₂ ciclopropilo	H	1	
2-27	ciclopropilo	H	1	
2-28	CH ₂ Ph	H	1	
2-29	H	H	2	
2-30	CH ₃	H	2	
2-31	CH ₂ CH ₃	H	2	
2-32	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	2	
2-33	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	2	
2-34	CH ₂ CHCH ₃	H	2	
2-35	CH ₂ CCH ₃	H	2	
2-36	C(O)OCH ₃	H	2	
2-37	C(O)OCH ₂ CH ₃	H	2	
2-38	CH ₂ OCH ₃	H	2	
2-39	CH ₂ OC H ₂ CH ₃	H	2	
2-40	CH ₂ ciclopropilo	H	2	

(continuación)

2-41	ciclopropilo	H	2	
2-42	CH ₂ Ph	H	2	
2-43	CH ₃	2-Cl	0	
2-44	H ₃	3-Cl	0	
2-45	CH ₃	4-Cl	0	
2-46	CH ₃	2,5-Cl ₂	0	
2-47	CH ₃	2,6-Cl ₂	0	
2-48	CH ₃	3,4-Cl ₂	0	
2-49	CH ₃	2-F	0	
2-50	CH ₃	3-F	0	
2-51	CH ₃	4-F	0	
2-52	CH ₃	3,4-F ₂	0	
2-53	CH ₃	2,6-F ₂	0	
2-54	CH ₃	4-Br	0	
2-55	CH ₃	4-I	0	
2-56	CH ₃	2-CF ₃	0	
2-57	CH ₃	3-CF ₃	0	
2-58	CH ₃	4-CF ₃	0	
2-59	CH ₃	3,5-(CF ₃) ₂	0	
2-60	CH ₃	4-CF ₃ , 2-Cl	0	
2-61	CH ₃	3-CF ₃ , 4-Cl	0	
2-62	CH ₃	2-OCH ₃	0	
2-63	CH ₃	3-OCH ₃	0	
2-64	CH ₃	4-OCH ₃	0	
2-65	CH ₃	4-SCH ₃	0	
2-66	CH ₃	4-SCF ₃	0	
2-67	CH ₃	4-SF ₅	0	
2-68	CH ₃	3,4-(OCH ₃) ₂	0	
2-69	CH ₃	4-Ph	0	
2-70	CH ₃	4-I	0	
2-71	CH ₃	2-CH ₃	0	
2-72	CH ₃	3-CH ₃	0	
2-73	CH ₃	2,3-(CH ₃	0	
2-74	CH ₃	4-CH ₃	0	
2-75	CH ₃	2,5-(CH ₃) ₂	0	
2-76	CH ₃	2,6-(CH ₃) ₂	0	
2-77	CH ₃	3,4-(CH ₃) ₂	0	
2-78	CH ₃	2-Cl	1	
2-79	CH ₃	3-Cl	1	199
2-80	CH ₃	4-Cl	1	
2-81	CH ₃	2,5-Cl ₂	1	
2-82	CH ₃	2,6-Cl ₂	1	
2-83	CH ₃	3,4-Cl ₂	1	223
2-84	CH ₃	2-F	1	
2-85	CH ₃	3-F	1	
2-86	CH ₃	4-F	1	207
2-87	CH ₃	3,4-F ₂	1	
2-88	CH ₃	2,6-F ₂	1	
2-89	CH ₃	4-Br	1	
2-90	CH ₃	4-I	1	
2-91	CH ₃	2-CF ₃	1	
2-92	CH ₃	3-CF ₃	1	
2-93	CH ₃	4-CF ₃	1	
2-94	CH ₃	3,5-(CF ₃) ₂	1	
2-95	CH ₃	4-CF ₃ , 2-Cl	1	

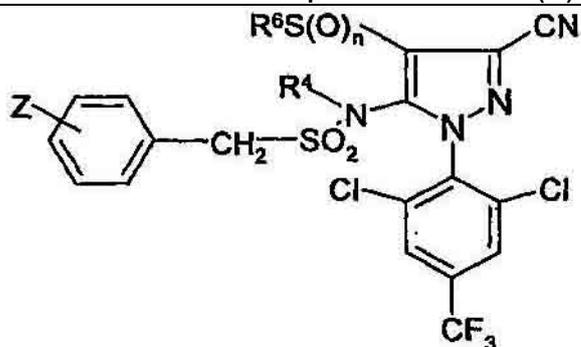
(continuación)

2-96	CH3	3-CF3, 4-Cl	1	
2-97	CH3	2-OCH3	1	
2-98	CH3	3-OCH3	1	
2-99	CH3	4-OCH3	1	
2-100	CH3	4-SCH3	1	
2-101	CH3	4-SCF3	1	
2-102	CH3	4-SF5	1	
2-103	CH3	3,4-(OCH3)2	1	
2-104	CH3	4-Fe	1	
2-105	CH3	4-I	1	
2-106	CH3	2-CH3	1	
2-107	CH3	3-CH3	1	
2-108	CH3	2,3-(CH3)2	1	
2-109	CH3	4-CH3	1	
2-110	CH3	2,5-(CH3)2	1	
2-111	CH3	2,6-(CH3)2	1	
2-112	CH3	3,4-(CH3)2	1	
2-113	CH3	2-Cl	2	
2-114	CH3	3-Cl	2	
2-115	CH3	4-Cl	2	
2-116	CH3	2,5-Cl2	2	
2-117	CH3	2,6-Cl2	2	
2-118	CH3	3,4-Cl2	2	
2-119	CH3	2-F	2	
2-120	CH3	3-F	2	
2-121	CH3	4-F	2	
2-122	CH3	3,4-F2	2	
2-123	CH3	2,6-F2	2	
2-124	CH3	4-Br	2	
2-125	CH3	4-I	2	
2-126	CH3	2-CF3	2	
2-127	CH3	3-CF3	2	
2-128	CH3	4-CF3	2	
2-129	CH3	3,5-(CF3)2	2	
2-130	CH3	4-CF3, 2-Cl	2	
2-131	CH3	3-CF3, 4-Cl	2	
2-132	CH3	2-OCH3	2	
2-133	CH3	3-OCH3	2	
2-134	CH3	4-OCH3	2	
2-135	CH3	4-SCH3	2	
2-136	CH3	4-SCF3	2	
2-137	CH3	4-SF5	2	
2-138	CH3	3,4-(OCH3)2	2	
2-139	CH3	4-Fe	2	
2-140	CH3	4-I	2	
2-141	CH3	2-CH3	2	
2-142	CH3	3-CH3	2	
2-143	CH3	2,3-(CH3)2	2	
2-144	CH3	4-CH3	2	
2-145	CH3	2,5-(CH3)2	2	
2-146	CH3	2,6-(CH3)2	2	
2-147	CH3	3,4-(CH3)2	2	
2-148	CH3	4-C5H11	0	
2-149	CH3	3,5-Cl2	0	
2-150	CH3	3,5-Cl2	1	

(continuación)

2-151	CH3	3,5-Cl2	2	
-------	-----	---------	---	--

Tabla 3: compuestos de fórmula (Ib)



(Ib)

Número de compuesto	R ⁶	R ⁴	Z	n	p.f.(°C)
3-1	CFCI2	H	H	0	
3-2	CFCI2	CH3	H	0	
3-3	CFCI2	CH2CH3	H	0	
3-4	CFCI2	CH2CH2CH3	H	0	
3-5	CFCI2	CH2CH2CH2CH3	H	0	
3-6	CFCI2	CH2CHCH2	H	0	
3-7	CFCI2	CH2CCH	H	0	
3-8	CFCI2	C(O)OCH3	H	0	
3-9	CFCI2	C(O)OCH2CH3	H	0	
3-10	CFCI2	CH2OCH3	H	0	
3-11	CFCI2	CH2OCH2CH3	H	0	
3-12	CFCI2	CH2ciclopropilo	H	0	
3-13	CFCI2	ciclopropilo	H	0	
3-14	CFCI2	CH2Ph	H	0	
3-15	CFCI2	H	H	1	
3-16	CFCI2	CH3	H	1	cera
3-17	CFCI2	CH2CH3	H	1	
3-18	CFCI2	CH2CH2CH3	H	1	
3-19	CFCI2	CH2CH2CH2CH3	H	1	
3-20	CFCI2	CH2CHCH2	H	1	
3-21	CFCI2	CH2CCH	H	1	
3-22	CFCI2	C(O)OCH3	H	1	
3-23	CFCI2	C(O)OCH2CH3	H	1	
3-24	CFCI2	CH2OCH3	H	1	
3-25	CFCI2	CH2OCH2C H3	H	1	
3-26	CFCI2	CH2ciclopropilo	H	1	
3-27	CFCI2	ciclopropilo	H	1	
3-28	CFCI2	CH2Ph	H	1	
3-29	CFCI2	H	H	2	
3-30	CFCI2	CH3	H	2	
3-31	CFCI2	CH2CH3	H	2	
3-32	CFCI2	CH2CH2CH 3	H	2	
3-33	CFCI2	CH2CH2CH2CH3	H	2	
3-34	CFCI2	CH2CHCH2	H	2	
3-35	CFCI2	CH2CCH	H	2	
3-36	CFCI2	C(O)OCH3	H	2	

(continuación)

3-37	CFCI2	C(O)OCH2CH3	H	2	
3-38	CFCI2	CH2OCH3	H	2	
3-39	CFCI2	CH2OCH2CH3	H	2	
3-40	CFCI2	CH2ciclopropilo	H	2	
3-41	CFCI2	ciclopropilo	H	2	
3-42	CFCI2	CH2Ph	H	2	
3-43	CFCI2	CH3	2-Cl	0	
3-44	CFCI2	CH3	3-Cl	0	
3-45	CFCI2	CH3	4-Cl	0	
3-46	CFCI2	CH3	2,5-Cl2	0	
3-47	CFCI2	CH3	2,6-Cl2	0	
3-48	CFCI2	CH3	3,4-Cl2	0	
3-49	CFCI2	CH3	2-F	0	
3-50	CFCI2	CH3	3-F	0	
3-51	CFCI2	CH3	4-F	0	
3-52	CFCI2	CH3	3,4-F2	0	
3-53	CFCI2	CH3	2,6-F2	0	
3-54	CFCI2	CH3	4-Br	0	
3-55	CFCI2	CH3	4-I	0	
3-56	CFCI2	CH3	2-CF3	0	
3-57	CFCI2	CH3	3-CF3	0	
3-58	CFCI2	CH3	4-CF3	0	
3-59	CFCI2	CH3	3,5-(CF3)2	0	
3-60	CFCI2	CH3	4-CF3, 2-Cl	0	
3-61	CFCI2	CH3	3-CF3, 4-Cl	0	
3-62	CFCI2	CH3	2-OCH3	0	
3-63	CFCI2	CH3	3-OCH3	0	
3-64	CFCI2	CH3	4-OCH3	0	
3-65	CFCI2	CH3	4-SCH3	0	
3-66	CFCI2	CH3	4-SCF3	0	
3-67	CFCI2	CH3	4-SF5	0	
3-68	CFCI2	CH3	3,4-(OCH3)2	0	
3-69	CFCI2	CH3	4-Ph	0	
3-70	CFCI2	CH3	4-I	0	
3-71	CFCI2	CH3	2-C H3	0	
3-72	CFCI2	CH3	3-CH3	0	
3-73	CFCI2	CH3	2,3-(CH3)2	0	
3-74	CFCI2	CH3	4-CH3	0	
3-75	CFCI2	CH3	2,5-(CH3)2	0	
3-76	CFCI2	CH3	2,6-(CH3)2	0	
3-77	CFCI2	CH3	3,4-(CH3)2	0	
3-78	CFCI2	CH3	2-Cl	1	
3-79	CFCI2	CH3	3-Cl	1	
3-80	CFCI2	CH3	4-Cl	1	
3-81	CFCI2	CH3	2,5-Cl2	1	
3-82	CFCI2	CH3	2,6-Cl2	1	
3-83	CFCI2	CH3	3,4-Cl2	1	
3-84	CFCI2	CH3	2-F	1	
3-85	CFCI2	CH3	3-F	1	
3-86	CFCI2	CH3	4-F	1	
3-87	CFCI2	CH3	3,4-F2	1	
3-88	CFCI2	CH3	2,6-F2	1	
3-89	CFCI 2	CH3	4-Br	1	
3-90	CFCI2	CH3	4-I	1	

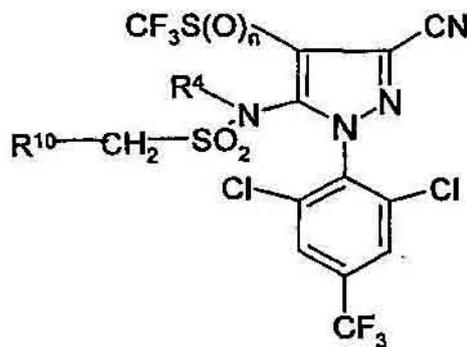
(continuación)

3-91	CFCI2	CH3	2-CF3	1	
3-92	CFCI2	CH3	3-CF3	1	
3-93	CFCI2	CH3	4-CF3	1	
3-94	CFCI2	CH3	3,5-(CF3)2	1	
3-95	CFCI2	CH3	4-CF3, 2-Cl	1	
3-96	CFCI2	CH3	3-CF3, 4-Cl	1	
3-97	CFCI2	CH3	2-OCH3	1	
3-98	CFCI2	CH3	3-OCH3	1	
3-99	CFCI2	CH3	4-OCH3	1	
3-100	CFCI2	CH3	4-SCH3	1	
3-101	CFCI2	CH3	4-SCF3	1	
3-102	CFCI2	CH3	4-SF5	1	
3-103	CFCI2	CH3	3,4-(OCH3)2	1	
3-104	CFCI2	CH3	4-Fe	1	
3-105	CFCI2	CH3	4-I	1	
3-106	CFCI2	CH3	2-CH3	1	
3-107	CFCI 2	CH3	3-CH3	1	
3-108	CFCI2	CH3	2,3-(CH3)2	1	
3-109	CFCI2	CH3	4-CH3	1	
3-110	CFCI2	CH3	2,5-(CH3)2	1	
3-111	CFCI2	CH3	2,6-(CH3)2	1	
3-112	CFCI2	CH3	3,4-(CH3)2	1	
3-113	CFCI2	CH3	2-Cl	2	
3-114	CFCI2	CH3	3-Cl	2	
3-115	CFCI2	CH3	4-Cl	2	
3-116	CFCI2	CH3	2,5-Cl2	2	
3-117	CFCI2	CH3	2,6-Cl2	2	
3-118	CFCI2	CH3	3,4-Cl2	2	
3-119	CFCI2	CH3	2-F	2	
3-120	CFCI2	CH3	3-F	2	
3-121	CFCI2	CH3	4-F	2	
3-122	CFCI2	CH3	3,4-F2	2	
3-123	CFCI2	CH3	2,6-F2	2	
3-124	CFCI2	CH3	4-Br	2	
3-125	CFCI2	CH3	4-I	2	
3-126	CFCI2	CH3	2-CF3	2	
3-127	CFCI2	CH3	3-CF3	2	
3-128	CFCI2	CH3	4-CF3	2	
3-129	CFCI2	CH3	3,5-(CF3)2	2	
3-130	CFCI2	CH3	4-CF3, 2-Cl	2	
3-131	CFCI2	CH3	3-CF3, 4-Cl	2	
3-132	CFCI2	CH3	2-OCH3	2	
3-133	CFCI2	CH3	3-OCH3	2	
3-134	CFCI2	CH3	4-OCH3	2	
3-135	CFCI2	CH3	4-SCH3	2	
3-136	CFCI2	CH3	4-SCF3	2	
3-137	CFCI2	CH3	4-SF5	2	
3-138	CFCI2	CH3	3,4-(OCH3)2	2	
3-139	CFCI2	CH3	4-Fe	2	
3-140	CFCI2	CH3	4-I	2	
3-141	CFCI2	CH3	2-CH3	2	
3-142	CFCI2	CH3	3-CH3	2	
3-143	CFCI2	CH3	2,3-(CH3)2	2	
3-144	CFCI2	CH3	4-CH3	2	

(continuación)

3-145	CFCI2	CH3	2,5-(CH3)2	2	
3-146	CFCI2	CH3	2,6-(CH3)2	2	
3-147	CFCI2	CH3	3,4-(CH3)2	2	
3-148	CF2CI	CH3	H	0	
3-149	CF2H	CH3	H	0	
3-150	CFH2	CH3	H	0	
3-151	CH3	CH3	H	0	
3-152	CH2CH3	CH3	H	0	
3-153	CCI2CF3	CH3	H	0	
3-154	CH2CF3	CH3	H	0	
3-155	CHCICF3	CH3	H	0	
3-156	CFHCF2H	CH3	H	0	
3-157	CFHCFH2	CH3	H	0	
3-148	CF2CI	CH3	H	1	
3-149	CF2H	CH3	H	1	
3-150	CFH2	CH3	H	1	
3-151	CH3	CH3	H	1	
3-152	CH2CH3	CH3	H	1	
3-153	CCI2CF3	CH3	H	1	
3-154	CH2CF3	CH3	H	1	
3-155	CHCICF3	CH3	H	1	
3-156	CFHCF2H	CH3	H	1	
3-157	CFHCFH2	CH3	H	1	
3-148	CF2CI	CH3	H	2	
3-149	CF2H	CH3	H	2	
3-150	CFH2	CH3	H	2	
3-151	CH3	CH3	2	2	
3-152	CH2CH3	CH3	H	2	
3-153	CCI2CF3	CH3	H	2	
3-154	CH2CF3	CH3	H	2	
3-155	CHCICF3	CH3	H	2	
3-156	CFHCF2H	CH3	H	2	
3-157	CFHCFH2	CH3	H	2	

Tabla 4: compuestos de fórmula (Ic)



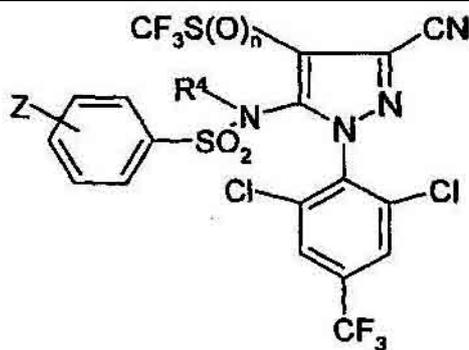
(Ic)

Número de compuesto	R^{10}	R^4	n	p. f. (°C)
4-1	2-piridilo	CH_3	1	
4-2	3-piridilo	CH_3	1	

(continuación)

4-3	5-Cl-3-piridilo	CH3	1	
4-4	4-piridilo	CH3	1	
4-5	1-pirimidilo	CH3	1	
4-6	3-pirimidilo	CH3	1	
4-7	4-pirimidilo	CH3	1	
4-8	2-tienilo	CH3	1	
4-9	3-tienilo	CH3	1	
4-10	2-furilo	CH3	1	
4-11	3-furilo	CH3	1	
4-12	2-tetrahidrofurilo	CH3	1	
4-13	3-tetrahidrofurilo	CH3	1	
4-14	3-pirazolilo	CH3	1	
4-15	4-pirazolilo	CH3	1	
4-16	5-pirazolilo	CH3	1	
4-17	2-imidazolilo	CH3	1	
4-18	4-imidazolilo	CH3	1	
4-19	5-imidazolilo	CH3	1	
4-20	2-tiazolilo	CH3	1	
4-21	4-tiazolilo	CH3	1	
4-22	5-tiazolilo	CH3	1	
4-23	2-tetrahidrotienilo	CH3	1	
4-24	2-pirrolilo	CH3	1	
4-25	3-pirrolilo	CH3	1	
4-26	4-pirrolilo	CH3	1	
4-27	1-tetrazolilo	CH3	1	
4-29	5-tetrazolilo	CH3	1	
4-30	3-(1,2,4)-triazolilo	CH3	1	
4-31	5-(1,2,4)-triazolilo	CH3	1	
4-32	5-Cl-2-tienilo	CH3	0	
4-33	2-tienilo	CH3	0	
4-34	2-tienilo	CH3	2	
4-35	5-Cl-2-tienilo	CH3	1	

Tabla 5: compuestos de fórmula (Id)



(Id)

Número de compuesto	R ⁴	Z	n	p.f. (°C)/ RMN ¹ H NCH ₃
5-1	CH3	2-Cl	0	
5-2	CH3	3-Cl	0	
5-3	CH3	4-Cl	0	177
5-4	CH3	2,5-Cl2	0	

(continuación)

5-5	CH3	2,6-Cl2	0	
5-6	CH3	3,4-Cl2	0	
5-7	CH3	2-F	0	
5-8	CH3	3-F	0	
5-9	CH3	4-F	0	153
5-10	CH3	3,4-F2	0	
5-11	CH3	2,6-F2	0	
5-12	CH3	4-Br	0	
5-13	CH3	4-I	0	
5-14	CH3	2-CF3	0	
5-15	CH3	3-CF3	0	167
5-16	CH3	4-CF3	0	158
5-17	CH3	3,5-(CF3)2	0	
5-18	CH3	4-CF3, 2-Cl	0	
5-19	CH3	3-CF3, 4-Cl	0	
5-20	CH3	2-OCH3	0	
5-21	CH3	3-OCH3	0	
5-22	CH3	4-OCH3	0	152
5-23	CH3	4-SCH3	0	
5-24	CH3	4-SCF3	0	
5-25	CH3	4-SF5	0	
5-26	CH3	3,4-(OCH3)2	0	
5-27	CH3	4-Fe	0	
5-28	CH3	4-I	0	
5-29	CH3	2-CH3	0	
5-30	CH3	3-CH3	0	105
5-31	CH3	2,3-(CH3)2	0	
5-32	CH3	4-CH3	0	154
5-33	CH3	2,5-(CH3)2	0	
5-34	CH3	2,6-(CH3)2	0	
5-35	CH3	3,4-(CH3)2	0	
5-36	CH3	H	0	112
5-37	CH3	4-OCF3	0	141
5-38	CH3	t-C4 H9	0	170
5-39	CH3	2,4,6-Cl3	0	
5-40	2,4,6-(CH3)3	2,4,6-(CH3)3	0	135
5-41	CH3	2-CO2CH3,5-I	0	
5-42	CH3	3,5-Cl2	0	138
5-43	CH3	4-NO2	0	
5-44	CH3	1-naftilo	0	131
5-45	CH3	2,6-Cl2,4-CF3	0	
5-46	CH3	2-Cl	1	195
5-47	CH3	3-Cl	1	129
5-48	CH3	4-Cl	1	
5-49	CH3	2,5-Cl2	1	180
5-50	CH3	2,6-Cl2	1	
5-51	CH3	3,4-Cl2	1	
5-52	CH3	2-F	1	
5-53	CH3	3-F	1	
5-54	CH3	4-F	1	144
5-55	CH3	3,4-F2	1	
5-56	CH3	2,6-F2	1	
5-57	CH3	4-Br	1	
5-58	CH3	4-I	1	

(continuación)

5-59	CH3	2-CF3	1	
5-60	CH3	3-CF3	1	161
5-61	CH3	4-CF3	1	138
5-62	CH3	3,5-(CF3)2	1	
5-63	CH3	4-CF3,2Cl	1	
5-64	CH3	3-CF3,4-Cl	1	
5-65	CH3	2-OCH3	1	cera
5-66	CH3	3-OCH3	1	
5-67	CH3	4-OCH3	1	
5-68	CH3	4-SCH3	1	
5-69	CH3	4-SCF3	1	
5-70	CH3	4-SF5	1	
5-71	CH3	3,4-(OCH3)2	1	
5-72	CH3	4-Fe	1	
5-73	CH3	4-I	1	
5-74	CH3	2-CH3	1	
5-75	CH3	3-CH3	1	3,24s,3H
5-76	CH3	2,3-(CH3)2	1	
5-77	CH3	4-CH3	1	
5-78	CH3	2,5-(CH3)2	1	
5-79	CH3	2,6-(CH3)2	1	
5-80	CH3	3,4-(CH3)2	1	
5-81	CH3	H	1	161
5-82	CH3	4-OCF3	1	96
5-83	CH3	t-C4H9	1	74
5-84	C H3	2,4,6-Cl3	1	168
5-85	CH3	2,4,6-(CH3)3	1	147
5-86	CH3	2-CO2CH3,5-I	1	3,40s,3H
5-87	CH3	3,5-Cl2	1	131
5-88	CH3	4-NO2	1	194
5-89	CH3	1-naftilo	1	140
5-90	CH3	2,6-Cl2,4-CF3	1	
5-91	CH3	2-Cl	2	
5-92	CH3	3-Cl	2	
5-93	CH3	4-Cl	2	
5-94	CH3	2,5-Cl2	2	
5-95	CH3	2,6-Cl2	2	
5-96	CH3	3,4-Cl2	2	
5-97	CH3	2-F	2	
5-98	CH3	3-F	2	
5-99	CH3	4-F	2	
5-100	CH3	3,4-F2	2	
5-101	CH3	2,6-F2	2	
5-102	CH3	4-Br	2	
5-103	CH3	4-I	2	
5-104	CH3	2-CF3	2	171
5-105	CH3	3-CF3	2	
5-106	CH3	4-CF3	2	
5-107	CH3	3,5-(CF3) 2	2	
5-108	CH3	4-CF3, 2-Cl	2	
5-109	CH3	3-CF3, 4-Cl	2	
5-110	CH3	2-OCH3	2	
5-111	CH3	3-OCH3	2	
5-112	CH3	4-OCH3	2	

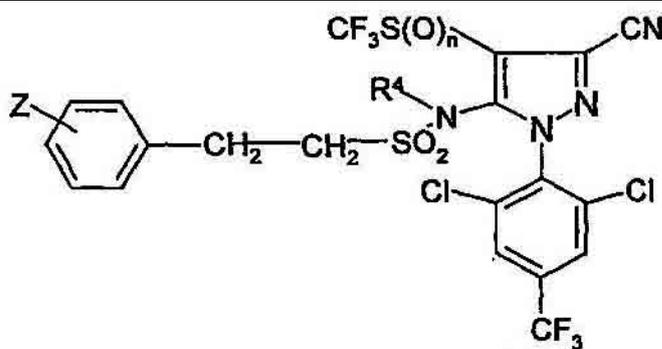
(continuación)

5-113	CH3	4-SCH3	2	
5-114	CH3	4-SCF3	2	
5-115	CH3	4SF5	2	
5-116	CH3	3,4-(OCH3)2	2	
5-117	CH3	4-Ph	2	
5-118	CH3	4-I	2	
5-119	CH3	2-CH3	2	
5-120	CH3	3-CH3	2	
5-121	CH3	2,3-(CH3)2	2	
5-122	CH3	4-CH3	2	
5-123	CH3	2,5-(CH3)2	2	
5-124	CH3	2,6-(CH3)2	2	
5-125	CH3	3,4-(CH3)2	2	
5-126	CH3	H	2	
5-127	CH3	4-OCF3	2	
5-128	CH3	t-C4H9	2	
5-129	CH3	2,4,6-Cl3	2	
5-130	CH3	2,4,6-(CH3)3	2	
5-131	CH3	2-CO2CH3,5-I	2	
5-132	CH3	3,5-Cl2	2	
5-133	CH3	4-NO2	2	
5-134	CH3	1-naftilo	2	
5-135	CH3	2,6-Cl2,4-CF3	2	
5-136	CH3	4-(4-F-PhO)	1	147
5-137	CH3	4-(3,5-Cl2-PhO)	1	159
5-138	CH3	4-(4-Cl-PhO)	1	cera
5-139	CH3	4-(4-CH3O-PhO)	1	167
5-140	CH3	4-PhO	1	144
5-141	CH3	4-(3,5-CF3-PhO)	1	
5-142	CH3	4-(4-CF3-PhO)	1	cera
5-143	CH3	4-(4-CH3-PhO)	1	190
5-144	CH3	4-(3,4-Cl2-PhO)	1	158
5-145	CH3	4-(2-CF3-PhO)	1	
5-146	CH3	4-(2-CH3-PhO)	1	
5-147	CH3	4-(2-OCH3-PhO)	1	
5-148	CH3	4-(2-Cl-PhO)	1	
5-149	CH3	4-(4-CF3-Ph)	1	166
5-150	CH3	4-(3,4-Cl2-Ph)	1	102
5-151	CH3	4-(4-F-Ph)	1	159
5-152	CH3	4-(4-CH3-Ph)	1	110
5-153	CH3	4-(2,3-Cl2-Ph)	1	
5-154	CH3	4-(4-OCH3-Ph)	1	cera
5-155	CH3	4-(4,6-Cl2-Ph)	1	
5-156	CH3	4-(3,5-Cl2-Ph)	1	
5-157	CH3	2,4,5-Cl3	1	
5-158	CH3	Ph-(3,4-OCH2CH2O-)	0	139
5-159	CH3	Ph-(3,4-OCH2CH2O-)	1	
5-160	CH3	4-C5H11	0	98
5-161	CH3	4-C5H11	1	104
5-162	CH3	4-(4-Cl-Ph)	1	cera
5-163	CH3	4-[3,5-(CF3)2-Ph]	1	145
5-164	CH3	2-OCH3, 5-Br	1	197
5-165	CH 3	2-Br	1	cera
5-166	CH3	2-CN	1	191

(continuación)

5-167	CH3	2-OCH3, 5-Cl	1	178
5-168	CH3	2,6-(CH3)2,4-isopropilo	1	170
5-169	CH3	6-Cumarilo	1	>235
5-170	CH3	2-CH=N-O-CH3	1	146
5-171	CH3	2,3-(CH3)2, 5-t-C4H9	1	210
5-172	CH3	2-Ph	1	cera
5-173	CH3	2-OCH3, 6-Cl	1	Aceite
5-174	CH3	4-CH(CH3)CH2CH3	1	145
5-175	CH3	2-Cl,4-CH3	1	98
5-176	CH3	2-CH3, 4-Cl	1	106
5-177	CH3	2,4-(isopropil)2	1	aceite
5-178	CH3	2,4-CH2CH3	1	73
5-179	CH3	2,5-(isopropil)2	1	aceite
5-180	CH3	2-CH3, 3,5-Cl2	1	97
5-181	CH3	2-OCH2CH3, 5-isopropilo	1	97
5-182	CH3	2-Cl, 3,5-(CH3)2	1	95
5-183	CH3	3-F, 5-CH3	1	175
5-184	CH3	2-F, 5-OCH3	1	173
5-185	CH3	2-C(O)OPh	1	57
5-186	CH3	2-OCH2CH2CH3, 6-CH3	1	101
5-187	CH3	3-NO2, 4-OCF3	1	98
5-188	CH3	4-O-pirid-2-ilo	1	116
5-189	CH3	2-S-Ph	1	179
5-190	CH3	2-C(O)OCH2CF3, 5-CH3	1	aceite
5-191	CH3	2-C(O)OCH2CH2OCH3	1	135

Tabla 6: compuestos de fórmula (Ie)



(Ie)

Número de compuesto	R ⁴	Z	n	p. f. (°C)
6-1	H	H	0	
6-2	CH3	H	0	
6-3	CH2CH3	H	0	
6-4	CH2CH2CH3	H	0	
6-5	CH2CH2CH2CH3	H	0	
6-6	CH2CHCH2	H	0	
6-7	CH2CCH	H	0	
6-8	C(O)OCH3	H	0	
6-9	C(O)OCH2CH3	H	0	
6-10	CH2OCH3	H	0	

(continuación)

6-11	CH 2OCH ₂ CH ₃	H	0	
6-12	CH ₂ ciclopropilo	H	0	
6-13	ciclopropilo	H	0	
6-14	CH ₂ Ph	H	0	
6-15	H	H	1	
6-16	CH ₃	H	1	
6-17	CH ₂ CH ₃	H	1	
6-18	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	1	
6-19	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	1	
6-20	CH ₂ CHCH ₂	H	1	
6-21	CH ₂ CCH	H	1	
6-22	C(O)OCH ₃	H	1	
6-23	C(O)OCH ₂ CH ₃	H	1	
6-24	CH ₂ OCH ₃	H	1	
6-25	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	H	1	
6-26	CH ₂ ciclopropilo	H	1	
6-27	ciclopropilo	H	1	
6-28	CH ₂ Ph	H	1	
6-29	H	H	2	
6-30	CH ₃	H	2	
6-31	CH ₂ CH ₃	H	2	
6-32	CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	2	
6-33	CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₃	H	2	
6-34	CH ₂ CHCH ₂	H	2	
6-35	CH ₂ CCH	H	2	
6-36	C(O)OCH ₃	H	2	
6-37	C(O)OCH ₂ CH ₃	H	2	
6-38	CH ₂ OCH ₃	H	2	
6-39	CH ₂ OCH ₂ CH ₃	H	2	
6-40	CH ₂ ciclopropilo	H	2	
6-41	ciclopropilo	H	2	
6-42	CH ₂ Ph	H	2	
6-43	CH ₃	2-Cl	0	
6-44	CH ₃	3-Cl	0	
6-45	CH ₃	4-Cl	0	
6-46	CH ₃	2,5-Cl ₂	0	
6-47	CH ₃	2,6-Cl ₂	0	
6-48	CH ₃	3,4-Cl ₂	0	
6-49	CH ₃	2-F	0	
6-50	CH ₃	3-F	0	
6-51	CH ₃	4-F	0	
6-52	CH ₃	3,4-F ₂	0	
6-53	CH ₃	2,6-F ₂	0	
6-54	CH ₃	4-Br	0	
6-55	CH ₃	4-I	0	
6-56	CH ₃	2-CF ₃	0	
6-57	CH ₃	3-CF ₃	0	
6-58	CH ₃	4-CF ₃	0	
6-59	CH ₃	3,5-(CF ₃) ₂	0	
6-60	CH ₃	4-CF ₃ , 2-Cl	0	
6-61	CH ₃	3-CF ₃ , 4-Cl	0	
6-62	CH ₃	2-OCH ₃	0	
6-63	CH ₃	3-OCH ₃	0	
6-64	CH ₃	4-OCH ₃	0	

(continuación)

6-65	CH3	4-SCH3	0	
6-66	CH3	4-SCF3	0	
6-67	CH3	4-SF5	0	
6-68	CH3	3,4-(OCH3)2	0	
6-69	CH3	4-Ph	0	
6-70	CH3	4-I	0	
6-71	CH3	2-CH3	0	
6-72	CH3	3-CH3	0	
6-73	CH3	2,3-(CH3)2	0	
6-74	CH3	4-CH3	0	
6-75	CH3	2,5-(CH3)2	0	
6-76	CH3	2,6-(CH3)2	0	
6-77	CH 3	3,4-(CH3)2	0	
6-78	CH3	2-Cl	1	
6-79	CH3	3-Cl	1	
6-80	CH3	4-Cl	1	
6-81	CH3	2,5-Cl2	1	
6-82	CH3	2,6-Cl2	1	
6-83	CH3	3,4-Cl2	1	
6-84	CH3	2-F	1	
6-85	CH3	3-F	1	
6-86	CH3	4-F	1	
6-87	CH3	3,4-F2	1	
6-88	CH3	2,6-F2	1	
6-89	CH3	4-Br	1	
6-90	CH3	4-I	1	
6-91	CH3	2-CF3	1	
6-92	CH3	3-CF 3	1	
6-93	CH3	4-CF3	1	
6-94	CH3	3,5-(CF3)2	1	
6-95	CH 3	4-CF3, 2-Cl	1	
6-96	CH3	3-CF3, 4-Cl	1	
6-97	CH3	2-OCH3	1	
6-98	CH3	3-OCH3	1	
6-99	CH3	4-OCH3	1	
6-100	CH3	4-SCH3	1	
6-101	CH3	4-SCF3	1	
6-102	CH3	4-SF5	1	
6-103	CH3	3,4-(OCH3)2	1	
6-104	CH3	4-Ph	1	
6-105	CH3	4-1	1	
6-106	CH3	2-CH3	1	
6-107	CH3	3-CH3	1	
6-108	CH3	2,3-(CH3)2	1	
6-109	CH3	4-CH3	1	
6-110	CH3	2,5-(CH3)2	1	
6-111	CH3	2,6-(CH3)2	1	
6-112	CH3	3,4-(CH3)2	1	
6-113	CH3	2-Cl	2	
6-114	CH3	3-Cl	2	
6-115	CH3	4-Cl	2	
6-116	CH3	2,5-Cl2	2	
6-117	CH3	2,6-Cl2	2	
6-118	CH3	3,4-Cl2	2	

(continuación)

6-119	CH3	2-F	2	
6-120	CH3	3-F	2	
6-121	CH3	4-F	2	
6-122	CH3	3,4-F2	2	
6-123	CH3	2,6-F2	2	
6-124	CH3	4-Br	2	
6-125	CH3	4-I	2	
6-126	CH3	2-CF3	2	
6-127	CH3	3-CF3	2	
6-128	CH3	4-CF3	2	
6-129	CH3	3,5-(CF3)2	2	
6-130	CH3	4-CF3, 2-Cl	2	
6-131	CH3	3-CF3, 4-Cl	2	
6-132	CH3	2-OCH3	2	
6-133	CH3	3-OCH3	2	
6-134	CH3	4-OCH3	2	
6-135	CH3	4-SCH3	2	
6-136	CH3	4-SCF3	2	
6-137	CH3	4-SF5	2	
6-138	CH3	3,4-(OCH3)2	2	
6-139	CH3	4-Ph	2	
6-140	CH3	4-I	2	
6-141	CH3	2-CH3	2	
6-142	CH3	3-CH3	2	
6-143	CH3	2,3-(CH3)2	2	
6-144	CH3	4-CH3	2	
6-145	CH3	2,5-(CH3)2	2	
6-146	CH3	2,6-(CH3)2	2	
6-147	CH3	3,4-(CH3)2	2	

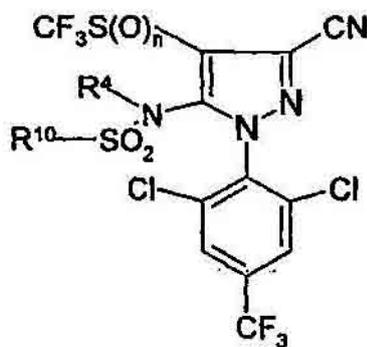
Tabla 7: compuestos de fórmula (I) en los que R¹ es CSNH₂; R² es Cl; W 3s C-Cl; R³ 3s CF₃ y R⁶ es CF₃.

Número de compuesto	R ⁴	R ⁵	n	m. p. (°C)
7-1	CH3	iPr	1	
7-2	CH3	CH ₂ CH ₂ CH ₃	1	
7-3	CH3	CH ₂ CH ₂ C H ₂ CH ₃	1	
7-4	CH3	CHCH ₂	1	
7-5	CH3	CH ₂ Cl	1	
7-6	CH3	CF ₃	1	
7-8	CH3	CFH ₂	1	
7-9	CH3	CF ₂ H	1	
7-10	CH3	C ₈ H ₁₇	1	
7-11	CH3	C ₉ H ₁₉	1	
7-11	CH3	C ₁₀ H ₂₁	1	
7-12	CH3	C ₁₂ H ₂₅	1	
7-13	CH3	CHCH ₂	1	
7-14	CH3	CH ₂ CHCH ₂	1	
7-15	CH3	ciclo-C ₅ H ₉	1	
7-16	CH3	ciclo-C ₆ H ₁₁	1	
7-17	CH3	CH ₂ CH ₂ CH ₂ Cl	1	
7-18	CH3	CH 2SO ₂ CH ₃	1	
7-19	CH3	CH ₂ NH ₂	1	
7-20	CH3	CH ₂ NHCH ₃	1	
7-21	CH3	CH ₂ N(CH ₃) ₂	1	

(continuación)

7-22	CH3	CH2NHCH2CH3	1	
7-23	CH3	CH2N(CH2CH3)2	1	
7-24	CH3	CH2CH2N(CH3)2	1	
7-25	CH3	CH2CH2 N(CH2CH3)2	1	
7-26	CH3	CH2-N-morfolinilo	1	
7-27	CH3	CH2OCH3	1	
7-28	CH3	CH2OCH2CH3	1	
7-29	CH3	CH2SCH3	1	
7-30	CH3	CH3	1	
7-31	CH3	CH2CH3	1	
7-32	CH3	CH2Ph	1	134

Tabla 8: compuestos de fórmula (If)

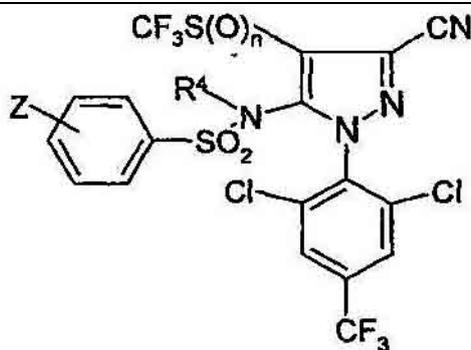


Número de compuesto	R ¹⁰	R ⁴	n	m. p. (°C)
8-1	2-piridilo	CH3	1	
8-2	3-piridilo	CH3	1	
8-3	5-Cl-3-piridilo	CH3	1	
8-4	4-piridilo	CH3	1	
8-5	1-pirimidilo	CH3	1	
8-6	3-pirimidilo	CH3	1	
8-7	4-pirimidilo	CH3	1	
8-8	2-tienilo	CH3	1	138
8-9	3-tienilo	CH3	1	
8-10	2-furilo	CH3	1	
8-11	3-furilo	CH3	1	
8-12	2-tetrahydrofurilo	CH3	1	
8-13	3-tetrahydrofurilo	CH3	1	
8-14	3-pirazolilo	CH3	1	
8-15	4-pirazolilo	CH3	1	
8-16	5-pirazolilo	CH3	1	
8-17	2-imidazolilo	CH3	1	
8-18	4-imidazolilo	CH3	1	
8-19	5-imidazolilo	CH3	1	
8-20	2-tiazolilo	CH3	1	
8-21	4-tiazolilo	CH3	1	
8-22	5-tiazolilo	CH3	1	
8-23	2-tetrahidrotienilo	CH3	1	
8-24	2-pirrolilo	CH3	1	

(continuación)

8-25	3-pirrolilo	CH3	1	
8-26	4-pirrolilo	CH3	1	
8-27	1-tetrazolilo	CH3	1	
8-28	5-tetrazolilo	CH3	1	
8-29	3-(1,2,4)-triazolilo	CH3	1	
8-30	5-(1,2,4)-triazolilo	CH3	1	
8-31	5-Cl-2-tienilo	CH3	0	
8-32	2-tienilo	CH3	0	
8-33	2-tienilo	CH3	2	
8-34	5-Cl-2-tienilo	CH3	1	171
8-35	1-metil-4-imidazolilo	CH3	0	
8-36	1-metil-4-imidazolilo	CH3	1	
8-37	1,3-dimetil-5-Cl-pirazolilo	CH3	0	150
8-38	2,4-dimetil-5-tiazolilo	CH3	1	149
8-39	5-(2-piridil)-2-tienilo	CH3	1	176
8-40	2-metil-5-CF3-4-furilo	CH3	1	161
8-41	2,5-dimetil-3-tienilo	CH3	1	134
8-42	tetradecilo	CH3	1	cera
8-43	Ciclopropilo	CH3	1	227
8-44	CH2Br	CH 3	1	aceite
8-45	CH2CH2 CH2CF2CF3	CH3	1	161
8-46	2-Cl-3-piridilo	CH3	1	92

Tabla 9: compuestos de fórmula (Id)



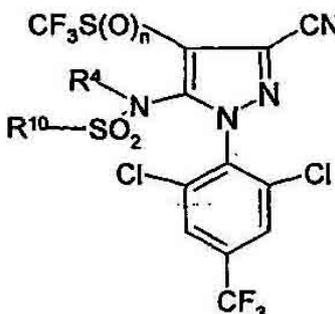
(Id)

Número de compuesto	R ⁴	Z	n	p. f. (°C)/RMN ¹ H
9-1	CH3	4-(Ph-4-OCH3)	1	3,21s, 3H, N-CH3
9-2	CH3	4-(Ph-4-Cl)	1	3,25s, 3H, N-CH3
9-3	CH3	4-(Ph-3,4-(Cl)2)	1	102
9-4	CH3	4-(Ph-4-F)	1	159
9-5	CH3	4-(Ph-4-CH3)	1	110
9-6	CH3	4-(Ph-4-CF3)	1	166
9-7	CH3	4-(Ph-3,5-bis-CF3)	1	145
9-8	CH3	4-OPh	1	144
9-9	CH3	4-(OPh-4-OCH3)	1	167
9-10	CH3	O-(Ph-4-Cl)	1	3,22s, 3H, N-CH3
9-11	CH3	4-(OPh-3,5-(Cl)2)	1	159
9-12	CH3	4-(OPh-3,4-(Cl)2)	1	158
9-13	CH3	4-(OPh-4-F)	1	147
9-14	CH3	4-(OPh-4-CH3)	1	190

(continuación)

9-15	CH3	4-(OPh-4-CF3)	1	3,30s, 3H, N-CH3
9-16	CH3	4-OCF3	1	96
9-17	CH3	2-OCH3-5-Br	1	197
9-18	CH3	2-Br	1	3,52s, 3H, N-CH3
9-19	CH3	2-CN	1	191
9-20	CH3	2-OCH3-5-Cl	1	178
9-21	CH3	2,6-Di-CH3-4-iso-propilo	1	170
9-22	CH3	6-Cromen-2-ona	1	>235
9-23	CH3	2-CH=N-O-CH3	1	146
9-24	CH3	2,3-di-CH3-5-terc-Butilo	1	210
9-25	CH3	2-Ph	1	2,94s, 3H, N-CH3
9-26	CH3	2-OCH3-6-Cl	1	3,42s, 3H, N-CH3
9-27	CH3	4-CH(CH3)-CH2-CH3	1	145
9-28	CH3	2-C14-CH3	1	98
9-29	CH3	2-CH2 4-Cl	1	106
9-30	CH3	2,4-CH(CH3)-CH3	1	3,26s, 3H, N-CH3
9-31	CH3	2,4-CH2-CH3	1	73
9-32	CH3	2,5-CH(CH3)-CH3	1	3,28s, 3H, N-CH3
9-33	CH3	2-CH3 3,5-Cl	1	97
9-34	CH3	2-OCH3	1	174
9-35	CH3	2-OCH2CH3-5-CH(CH3)-CH3	1	97
9-36	CH3	2-Cl 3,5-CH3	1	95
9-37	CH3	3-F 5-CH3	1	175
9-38	CH3	2-F 5-OCH3	1	173
9-39	CH3	2-C(O)-O-Ph	1	57
9-40	CH3	2-OCH2CH2CH3 6-CH3	1	101
9-41	CH3	3-NO2 4-OCF3	1	98
9-42	CH3	4-O-pirid-2-ilo	1	116
9-43	CH3	2-S-Ph	1	179
9-44	CH3	2-C(O)OCH2CF3 5-CH3	1	2,57 d, 3H, N-CH3
9-45	CH3	2-C(O)OCH2CH 2OCH3	1	135

Tabla 10: compuestos de fórmula (If)

 <p style="text-align: center;">(If)</p>				
Número de compuesto	R ¹⁰	R ⁴	n	p. f. (°C)/RMN ¹ H
10-1	tetradecilo	CH3	1	3,38s, 3H, N-CH3
10-2	ciclopropilo	CH3	1	227
10-3	CH2-Br	CH3	1	3,51s, 3H, N-CH3
10-4	CH2CH2CH2CF2CF3	CH3	1	161
10-5	2-Cl-pirid-3-ilo	CH3	1	92

[0034] Según una característica adicional de la presente invención se proporciona un procedimiento para el control de plagas en un locus que comprende la aplicación de una cantidad eficaz de un compuesto de fórmula (I) o una sal del mismo. Para este fin, dicho compuesto normalmente se usa en forma de composición pesticida (es decir, en asociación con diluyentes o vehículos compatibles y/o agentes tensioactivos adecuados para su uso en composiciones pesticidas), por ejemplo, como se describe anteriormente en este documento.

[0035] La expresión "compuesto de la invención" según se usa anteriormente en este documento abarca un alquilaminopirazol 5-sustituido de fórmula (I) como se define anteriormente y una sal aceptable como pesticida del mismo.

[0036] Un aspecto de la presente invención como se define anteriormente es un procedimiento para el control de plagas en un locus. El locus incluye, por ejemplo, la plaga en sí, el lugar (planta, campo, bosque, huerto, canal, suelo, producto vegetal o similar) donde habita o se alimenta la plaga o un lugar susceptible de infestación futura por la plaga. Por tanto, el compuesto de la invención puede aplicarse directamente a la plaga, al lugar donde habita o se alimenta la plaga o al lugar susceptible de infestación futura por la plaga. Como es evidente a partir de los usos anteriores como pesticida, la presente invención proporciona compuestos con actividad pesticida y procedimientos de uso de dichos compuestos para el control de diversas especies de plagas que incluyen: artrópodos, especialmente insectos o arácnidos, como ácaros, o nematodos de plantas. El compuesto de la invención puede, por tanto, emplearse de forma ventajosa en aplicaciones prácticas, por ejemplo, en cosechas agrícolas o de horticultura, en bosques, en veterinaria o de cría de ganado, o en salud pública. Los compuestos de la invención pueden usarse, por ejemplo, en las aplicaciones siguientes y sobre las plagas siguientes:

Para el control de los insectos del suelo, como el gusano de la raíz del maíz, termitas (especialmente para la protección de estructuras), gusanos de las raíces, gusanos de elatérico, gorgojos, taladradores, orugas, áfidos de la raíces o larvas. También pueden usarse para proporcionar actividad frente a nematodos patógenos de plantas, como nematodos de la raíz, quistes, dagas, de lesiones, tallos o bulbos o frente a ácaros. Para el control de las plagas del suelo, por ejemplo, el gusano de la raíz del maíz, los compuestos se aplican o incorporan de forma ventajosa en una proporción eficaz al suelo en el que se plantan o van a plantar las cosechas, o a las semillas o raíces de plantas en crecimiento.

En el área de la salud pública, los compuestos son especialmente útiles para el control de muchos insectos, especialmente las moscas de la mugre u otras plagas de dípteros, como las moscas caseras, moscas de los establos, moscas soldado, moscas de los cuernos, moscas del venado, tábanos, mosquillas, chinches chupadoras, moscas negras o mosquitos.

En la protección de productos almacenados, por ejemplo cereales, incluyendo grano o harina, cacahuetes, piensos para animales, madera o enseres domésticos, como alfombras y tejidos, los compuestos de la invención son útiles frente al ataque de artrópodos, más especialmente, escarabajos, como gorgojos, polillas o ácaros, por ejemplo, *Ephestia* spp. (polillas de la harina), *Anthrenus* spp. (antrenos), *Tribolium* spp. (gorgojo de la harina), *Sitophilus* spp. (gorgojos de los graneros) o *Acarus* spp. (ácaros).

En el control de cucarachas, hormigas o termitas o de plagas de artrópodos similares en locales domésticos o industriales infestados o en el control de larvas de mosquito en canales, pozos, embalses u otras reservas de agua corriente o estancada.

Para el tratamiento de cimientos, estructuras o suelos como prevención del ataque de un edificio por termitas, por ejemplo, *Reticulitermes* spp., *Heterotermes* spp. o *Coptotermes* spp.

En agricultura frente a organismos adultos, larvas y huevos de lepidópteros (mariposas y polillas), p. ej., *Heliothis* spp., como *Heliothis virescens* (gusano bellotero), *Heliothis armigera* y *Heliothis zea*. Frente a organismos adultos y larvas de coleópteros (escarabajos), p. ej., *Anthonomus* spp. p. ej., *grandis* (picudo del algodón), *Leptinotarsa decemlineata* (escarabajo de la patata), *Diabrotica* spp. (gusano de la raíz del maíz). Frente a hepteropteros (Hemiptera y Homoptera), p. ej., *Psylla* spp., *Bemisia* spp., *Trialeurodes* spp., *Aphis* spp., *Myzus* spp., *Megoura viciae*, *Phylloxera* spp., *Nephotettix* spp. (saltamontes de las hojas del arroz), *Nilaparvata* spp.

[0037] Frente de dípteros, p. ej. *Musca* spp. Frente a trisanópteros como *Thrips tabaci*.

Frente a ortópteros como *Locusta* y *Schistocerca* spp. (langostas y grillos) p. ej., *Gryllus* spp. y *Acheta* spp. por ejemplo, *Blatta orientales*, *Periplaneta americana*, *Blatella germanica*, *Locusta migratoria migratorioides* y *Schistocerca gregaria*. Frente a *Collembola*, p. ej. *Priplaneta* spp. y *Blatella* spp. (cucarachas).

Frente a artrópodos de importancia agrícola, como *Acar* (ácaros) p. ej., *Tetranychus* spp. y *Panonychus* spp.

Frente a nematodos que atacan plantas o árboles de importancia para la agricultura, silvicultura u horticultura directamente o mediante la propagación de enfermedades bacterianas, virales, de micoplasmas o fúngicas de las plantas. Por ejemplo nematodos de los nudos de la raíz, como *Meloidogyne* spp. (p. ej., *M. incognita*).

En el campo de la veterinaria o de la cría de ganado, o en el mantenimiento de la salud pública frente a artrópodos que parasitan interna o externamente a vertebrados, especialmente vertebrados de sangre caliente, por ejemplo, animales domésticos, p. ej., ganado vacuno, ovejas, cabras, equinos, cerdos, aves de corral, perros o gatos, por ejemplo *Acarina* (incluyendo garrapatas (p. ej., garrapatas de cuerpo blando como *Argasidae spp.* p. ej. *Argas spp.* y *Ornithodoros spp.* (p. ej. *Ornithodoros moubata*), garrapatas de cuerpo duro como *Ixodidae spp.*, p. ej., *Boophilus spp.* p. ej., *Boophilus microplus*, *Rhipicephalus spp.*, p. ej., *Rhipicephalus appendiculatus* y *Rhipicephalus sanguineus*; ácaros (p. ej., *Damalina spp.*); pulgas (p. ej., *Ctenocephalides spp.* p. ej., *Ctenocephalides felis* (pulga de gato) y *Ctenocephalides canis* (pulga de perro); piojos, p. ej., *Menopon spp.*; dípteros (p. ej., *Aedes spp.*, *Anopheles spp.*, *Musca spp.*, *Hypoderma spp.*); hemipteros; dictiópteros (p. ej., *Periplaneta spp.*, *Blatella spp.*); himenópteros, por ejemplo, frente a infecciones de tubo digestivo causadas por gusanos nematodos parásitos, por ejemplo, los miembros de la familia *Trichostrongylidae*.

[0038] En un aspecto preferido de la invención, los compuestos de fórmula (I) se usan para el control de los parásitos de animales. Preferiblemente, el animal que se va a tratar es una mascota doméstica como un perro o un gato.

[0039] En un aspecto adicional de la invención, los compuestos de fórmula (i), sales o composiciones de los mismos se usan para la preparación de un medicamento de uso veterinario.

[0040] En el uso práctico para el control de plagas de artrópodos, especialmente insectos o ácaros, o de nematodos de plantas, un procedimiento comprende, por ejemplo, aplicar a las plantas, o en el medio en el que crecen, una cantidad eficaz de un compuesto de la invención. Para dicho procedimiento, el compuesto de la invención se aplica generalmente al locus en el que se quiere controlar la infestación por el artrópodo o el nematodo a una tasa eficaz en el intervalo de aproximadamente 2 g a aproximadamente 1 kg del compuesto activo por hectárea del locus tratado. En condiciones ideales, dependiendo de la plaga que se quiere controlar, una tasa menor puede ofrecer una protección adecuada. Por otro lado, las condiciones meteorológicas adversas, la resistencia de la plaga u otros factores pueden requerir que el principio activo se use a tasas más altas. La tasa óptima depende normalmente de diversos factores, por ejemplo, el tipo de plaga que se quiere controlar, el tipo o la fase de crecimiento de la planta infestada, la distancia entre las hileras y también el procedimiento de aplicación. Preferiblemente un intervalo de tasa eficaz del compuesto activo es de aproximadamente 10 g/ha a aproximadamente 400 g/ha, más preferiblemente de aproximadamente 50 g/ha a aproximadamente 200 g/ha.

Cuando una plaga es transmitida por el suelo, el compuesto activo generalmente en una composición formulada, se distribuye uniformemente sobre el área que se va a tratar (es decir, por ejemplo, tratamiento a voleo o en bandas) en cualquier forma conveniente y se aplica tasas de aproximadamente 10 g/ha a aproximadamente 400 g de p.a./ha, preferiblemente de aproximadamente 50 g/ha a aproximadamente 200 g p.a./ha. Cuando se aplica mediante inmersión de la raíz a plantas de semillero o mediante riego por goteo de las plantas, la solución o suspensión líquida contiene de aproximadamente 0,075 a aproximadamente 1.000 mg de p.a./l, preferiblemente de aproximadamente 25 a aproximadamente 200 mg de p.a./l. La aplicación puede hacerse, si se desea, al campo o al área de crecimiento de la cosecha, en general o próximo a la semilla o planta que se quiere proteger del ataque. El compuesto de la invención puede lavarse en el suelo pulverizando con agua sobre el área o puede dejarse a la acción natural de las precipitaciones. Durante o después de la aplicación, el compuesto formulado puede, si se desea, distribuirse mecánicamente en el suelo, por ejemplo, arando, rastreando con una grada de discos o usando una cadena de arrastre. La aplicación puede ser previa a la plantación, durante la plantación, después de la misma pero antes de que tenga lugar la germinación o tras la germinación.

El compuesto de la invención y los procedimientos de control de plagas con este son especialmente valiosos para la protección de campos, forraje, plantaciones, invernaderos, huertos o viñedos, de plantas ornamentales o plantaciones de árboles o bosques, por ejemplo: cereales (como trigo o arroz), algodón, vegetales (como pimientos), campos, cultivos (como caña de azúcar, soja o aceite de colza), pastizales o cultivos forrajeros (como maíz o sorgo), huertos o arboledas (como las de frutos de hueso o cítricos), plantas ornamentales, flores, vegetales o arbustos en invernaderos o en jardines o parques, o árboles forestales (tanto de hoja caduca como perennes), plantaciones o viveros.

También son valiosos en la protección de la madera (permanencia, tala, elaboración, almacenamiento o estructural) del ataque, por ejemplo de la mosca de sierra, carcoma o termitas.

Tienen aplicaciones en la protección de productos almacenados, tales como granos, frutas, frutos secos, especias o tabaco, tanto enteros, molidos o como componentes de productos, del ataque de polillas, escarabajos, ácaros o gorgojos de los graneros. También se protegen productos animales almacenados como pieles, pelo, lana o plumas en forma natural o procesados (p. ej., alfombras o tejidos) del ataque de polillas o escarabajos así como carne, pescado o grano almacenado, del ataque de escarabajos, ácaros o moscas.

Adicionalmente, el compuesto de la invención y los procedimientos de uso del mismo son especialmente valiosos para el control de artrópodos o helmintos que son lesivos, se extienden o actúan como vectores de enfermedades de animales domésticos, por ejemplo, los mencionados anteriormente en este documento y, más especialmente, en el control de garrapatas, ácaros, piojos, pulgas, mosquitos, insectos que producen picaduras, molestos o productos de miasas. Los compuestos de la invención son especialmente útiles para el control de artrópodos o helmintos que se encuentran dentro de animales domésticos hospedadores o que se alimentan de o sobre la piel o chupando la sangre del animal, para cuyo propósito pueden administrarse por vía oral, parenteral, percutánea o tópica.

En general, las composiciones descritas anteriormente en este documento para su aplicación a cosechas en crecimiento, lozi en los que crecen las cosechas o como desinfección de semillas pueden emplearse alternativamente para la protección de productos almacenados, enseres domésticos, bienes o áreas del medioambiente general. Entre los sistemas adecuados para aplicar los compuestos de la invención se incluyen: a cosechas en crecimiento como pulverización foliar (por ejemplo, como pulverización de surcos), polvos, gránulos, nieblas o espumas, o también como suspensiones de composiciones finamente divididas o encapsuladas como tratamientos de suelo o raíces empañando con líquido, polvos, gránulos, humos o espumas; a las semillas de las cosechas mediante la aplicación como desinfectante mediante suspensiones líquidas o polvos; a animales infestados o expuestos a la infestación por artrópodos o helmintos, mediante aplicación parenteral, oral o tópica de composiciones en las que el compuesto activo muestra una acción inmediata y/o prolongada durante un periodo de tiempo contra los artrópodos o helmintos, por ejemplo, mediante la incorporación en piensos o formulaciones farmacéuticas adecuadas ingeribles por vía oral, cebos comestibles, piedras de sal, suplementos de la dieta, formulaciones para verter por encima, pulverizadores, baños, desinfectantes, duchas, grasas, champúes, cremas, láminas de cera, lacas o sistemas de autotratamiento del ganado; al medio ambiente en general o a localizaciones específicas en las que las plagas pueden estar acechando, incluyendo productos almacenados, madera, enseres domésticos, locales domésticos o industriales, como pulverizadores, nieblas, polvos, humos, láminas de cera, lacas, gránulos o cebos, o en la alimentación controlada de vías de agua, pozos, embalses u otras reversas de agua corriente o estancada.

[0041] Los compuestos de fórmula (I) son especialmente útiles para el control de parásitos de animales cuando se aplican por vía oral, y en un aspecto adicional preferido de la invención, los compuestos de fórmula (I) se usan para el control de parásitos de animales mediante su aplicación oral. Los compuestos de fórmula (I) o sales de los mismos pueden administrarse antes, durante o después de las comidas. Los compuestos de fórmula (I) o sales de los mismos pueden mezclarse con un vehículo y/o con alimentos.

El compuesto de fórmula (I) o una sal del mismo se administran por vía oral en una dosis al animal en un intervalo de dosis generalmente de 0,1 a 500 mg/kg del compuesto de fórmula (I) o la sal del mismo por kilogramo de peso corporal del animal (mg/kg).

La frecuencia de tratamiento del animal, preferiblemente el animal doméstico que se va a tratar con el compuesto de fórmula (I) o la sal del mismo, generalmente es de aproximadamente una vez a la semana a aproximadamente una vez al año, preferiblemente de una vez cada dos semana a una vez cada tres meses.

Los compuestos de la invención pueden administrarse más ventajosamente con otro material eficaz para los parásitos, como un endoparasiticida y/o un ectoparasiticida, y/o un endectoparasiticida. Por ejemplo, estos compuestos incluyen lactonas macrocíclicas, como avermectinas o milbemicinas, p. ej., ivermectina, piratel o un regulador del crecimiento de insectos como lufenurón o metopreno.

[0042] Los compuestos de fórmula (I) también pueden emplearse para controlar organismos dañinos en cosechas de plantas conocidos modificadas por ingeniería genética o plantas genéticamente modificadas todavía por desarrollar. Como norma, las plantas transgénicas se distinguen por sus propiedades especialmente ventajosas, por ejemplo, resistencias a agentes de protección de cosechas especiales, resistencias a enfermedades vegetales o patógenos de enfermedades vegetales, como insectos o microorganismos especiales, tales como hongos, bacterias o virus. Otras propiedades particulares se refieren, por ejemplo, al material recolectado con respecto a la cantidad, calidad, propiedades de almacenaje, composición y constituyentes específicos. Por tanto, las plantas transgénicas se reconocen donde aumenta el contenido de almidón, donde se altera la calidad de almidón o donde el material recolectado tiene una composición de ácidos grasos diferente.

[0043] Se prefiere el uso en cosechas transgénicas económicamente importantes de plantas útiles y ornamentales, por ejemplo, de cereales, como trigo, cebada, centeno, avena, mijo, arroz, mandioca y maíz, u otras cosechas de caña de azúcar, algodón, soja, colza, patatas, tomates, guisantes y otros tipos de vegetales.

[0044] Cuando se usan en cosechas transgénicas, en particular en aquellas que presentan resistencias a insectos, frecuentemente se observan efectos, además de los efectos frente a organismos peligrosos observados en otras cosechas, que son específicos de la aplicación en la cosecha transgénica en cuestión, por ejemplo, un

espectro alterado o específicamente amplio de plagas que pueden controlarse, o alteración de las tasas de aplicación que pueden emplearse para la aplicación.

5 **[0045]** Por tanto, la invención también se refiere al uso de compuestos de fórmula (I) para controlar organismos dañinos en plantas transgénicas cultivadas.

10 **[0046]** Según una característica adicional de la presente invención se proporciona una composición pesticida que comprende uno o más compuestos de la invención como se define anteriormente, en asociación con, y preferiblemente homogéneamente disperso en uno o más diluyentes o vehículos y/o agentes tensioactivos compatibles aceptables como pesticidas [es decir, diluyentes o vehículos y/o tensioactivos del tipo generalmente aceptado en la técnica por ser adecuados para su uso en composiciones pesticidas y que son compatibles con los compuestos de la invención].

15 En la práctica, los compuestos de la invención forman más frecuentemente parte de las composiciones. Estas composiciones pueden emplearse para controlar artrópodos, especialmente insectos y arácnidos, como ácaros, o helmintos, como nematodos de plantas. Las composiciones pueden ser de cualquier tipo conocido en la técnica adecuado para la aplicación a la plaga deseada en cualquier local o en áreas internas o externas. Estas composiciones contienen al menos un compuesto de la invención como principio activo en combinación o asociación con uno o más compuestos compatibles distintos que son, por ejemplo, vehículos o diluyentes sólidos o líquidos, adyuvantes, agentes tensioactivos o similares apropiados para el uso pretendido y que son aceptables desde un punto de vista agrónomo o médico. Estas composiciones, que pueden prepararse mediante cualquier forma conocida en la técnica, también forman parte de esta invención.

20 Los compuestos de la invención, en sus formulaciones comercialmente disponibles y en las formas de uso preparadas a partir de estas formulaciones pueden presentarse en mezclas con otras sustancias activas, como insecticidas, atrayentes, esterilizantes, acaricidas, nematocidas, fungicidas, sustancias reguladoras del crecimiento o herbicidas.

[0047] Entre los pesticidas se incluyen, por ejemplo, ésteres fosfóricos, carbamatos, ésteres carboxílicos, formamidinas, compuestos de estaño y materiales producidos por microorganismos.

30 **[0048]** Los componentes preferidos en las mezclas son:

1. del grupo de los compuestos de fósforo:

acefato, azametifos, azinfos-etilo, azinfos-metilo, bromofos, bromofos-etilo, cadusafos (F-67825), cloretoxifos, clorfenvinfos, clormefos, clorpirifos, clorpirifos-metilo, demetón, demetón-S-metilo, demetón-S-metilsulfona, dialifos, 35 diazinón, diclorvos, dicrotofos, dimetoato, disulfotón, EPN, etión, etoprofos, etrimfos, famfur, fenamifos, fenitriofión, fensulfotión, fentiión, flupurazofos, forofos, formotión, fostiazato, heptenofos, isazofos, isotiato, isoxatiión, malatiión, metacrifos, metamidofos, metidatiión, salitiión, mevinfos, monocrotofos, naled, ometoato, oxidemetón-metilo, paratiión, paratiión-metilo, fentoato, forato, fosalona, fosfolán, fosfocarb (BAS-301), fosmet, fosamidón, foxim, pirimifos, pirimifos-etilo, pirimifos-metilo, profenofos, propafos, proetamfos, protiofos, piraclufos, piridapentiión, quinalfos, 40 sulprofos, temefos, terbufos, tebupirimfos, tetraclorvinfos, tiometón, triazofos, triclorfón y vamidotión;

2. del grupo de los carbamatos

alanicarb (OK135), aldicarb, metilcaramato de 2-sec-butifenilo (BPMC), carbarilo, carbofurano, carbosulfano, cloetocarb, benfuracarb, etiofencarb, furatiocarb, HCN-801, isoprocarb, metomil, (metil)carbamato de 5-metil-m-cumenilbutirilo, oxamilo, pirimicarb, propoxur, tiodicarb, tiofanox, 1-metilíto(etilidenamino)-N-metil-N- 45 (morfolinotio)carbamato (UC 51717), triazamato;

3. del grupo de los ésteres carboxílicos

acrinatrina, aletrina, alfametrina, 5-bencil-2-furilmetil-(E)-(1R)-cis-2,2-dimetil-3-(2-oxotiolan-3-ilidenmetil)ciclopropanocarboxilato, beta-ciflutrina, alfa-cipermetrina, beta-cipermetrina, bioaletrina, bioaletrin((S)-ciclopentilisomero), bioresmetrina, bifentrina, (1RS)-trans-3-(4-terc-butilfenil)-2,2-dimetilciclopropanocarboxilato de (RS)-1-ciano-1-(6-fenoxi-2-piridil)metilo (NCI 85193), cicloprotrina, ciflutrina, cihalotrina, cititrina, cipermetrina, cifenotrina, deltametrina, empentrina, esfenvalerato, fenflutrina, fenpropatrina, fenvalerato, flucitrinato, flumetrina, flualinato (isómero D), imiprotrina (S-41311), lambda-cihalotrina, permetrina, fenotrina (isómero R) praletrina, 55 piretrinas (productos naturales), resmetrina, teflutrina, tetrametrina, teta-cipermetrina, tralometrina, transflutrina, zeta-cipermetrina (F-56701);

4. del grupo de las amidinas

amitraz, clordimeform;

5. del grupo de los compuesto de estaño
cixexatina, óxido de fenbutatina

- 5 6. otros
abamectina, ABG-9008, acetamiprida, acequinocilo, *Anagrapha falcitera*, AKD-1022, AKD-3059, ANS-118, azadirachtina, *Bacillus thuringiensis*, *Beauveria bassiana*, bensultap, bifenazato, binapacril, BJI-932, bromopropilato, BTG-504, BTG-505, buprofezina, camfeclor, cartap, clorobenzilato, clorfenapir, clorfluzazurona, 2-(4-clorofenil)-4,5-difeniltiofeno (UBI-T 930), clorfentezina; clorproxifeno, cromafenozida, clotianidina, ciclopropanocarboxilato de 2-naftilmetilo (Ro12-0470), ciromazina, diacloden (tiametoxam), diafentiurona, DBI-3204, 2-cloro-N-(3,5-dicloro-4-(1,1,2,3,3,3-hexafluoro-1-propiloxi)fenil)carbamoil)-2-carboximidato de etilo, DDT, dicofol, diflubenzurona, N-(2,3-dihidro-3-metil-1,3-tiazol-2-iliden)-2,4-xilidino, dihidroximetildihidroxipirrolidina, dinobutona, dinocap, diofenolano, benzoato de emamectina, endosulfan, etiprol (sulfetiprol), etofenprox, etoxazol, fenazaquina, fenoxicarb, fipronilo, fluazurona, flumita (flufenzina, SZI-121), éter de 2-fluoro-5-(4-(4-etoxifenil)-4-metil-1-pentil)difenilo (MTI 800), virus de la granulosis y polihedrosis nuclear, fenpiroximato, fenticarb, fluacripurima, flubenzimina, flubrocato, fluciclozurona, flufenoxurona, flufenzina, flufenprox, fluproxifeno, gamma-HCH, halfenozida, halofenprox, hexaflumurona (DE_473), hexitiazox, HOI-9004, hidrametilnona (AC 217300), IKI-220, indoxacarb, ivermectina, L-14165, imidacloprida, indoxacarb (DPX-MP062), kanemita (AKD-2023), lufenurón, M-020, M-020, metoxifenozida, milbemectina, NC-196, neemgard, nidinoterfurano, nitenpiram, 2-nitrometil-4,5-dihidro-6H-tiazina (DS 52618), 2-nitrometil-3,4-dihidrotiazol (SD 35651), 2-nitrometilen-1,2-tiazinan-3-ilcarbomaldehido (WL 108477), novalurón, piridarilo, propargita, protrifenbuto, pimetozina, piridabeno, porimidifeno, piriproxifeno, N-196, NC-1111, NNI-9768, novalurón (MCW-275), OK-9701, OK-9601, OK-9602, OK-9802, R-195, RH-0345, RH-2485, RYI-210, S-1283, S-1833, SI-8601, silafluofeno, silomadina (CG-177), espinosad, espirodiclofeno, SU-9118, tebufenozida, tebufenpirad, teflubenzurón, tetradifona, tetrasul, tiacloprida, tiociclam, tiamethoxam, tolfenpirad, triazamato, trietoxispinosina A, triflumurón, verbutina, vertalec (Mykotal), YI-5301.

[0049] Los compuestos mencionados anteriormente para combinaciones son sustancias activas conocidas, muchas de las cuales se describen en Ch.R Worthing, S.B. Walker, The Pesticide Manual, 12ª Edición, British Crop Protection Council, Farnham 2000.

- 30 **[0050]** Las dosis utilizadas eficaces de los compuestos empleados en la invención pueden variar entre límites amplios, dependiendo especialmente de la naturaleza de la plaga que se van a eliminar o del grado de infestación, por ejemplo, de las cosechas con estas plagas. En general, las composiciones según la invención normalmente contienen de aproximadamente el 0,05 a aproximadamente el 95% (en peso) de uno o más principios activos según la invención, aproximadamente del 1 a aproximadamente el 95% de uno o más vehículos sólidos o líquidos y, opcionalmente, aproximadamente del 0,1 a aproximadamente el 50% de uno o más componentes distintos compatibles, como agentes tensioactivos o similares. En la explicación siguiente, el término "vehículo" indica un ingrediente orgánico o inorgánico, natural o sintético, con el que se combina el principio activo para facilitar su aplicación, por ejemplo, a la planta, a las semillas o al suelo. Por tanto, este vehículo es generalmente inerte y puede ser aceptable (por ejemplo, aceptable desde un punto de vista agronómico, especialmente para la planta tratada). El vehículo puede ser un sólido, por ejemplo, arcillas, silicatos naturales o sintéticos, sílices, resinas, ceras, fertilizantes sólidos (por ejemplo, sales de amonio), minerales naturales triturados, como caolinas, arcillas, talco, caliza, cuarzo, attapulgita, montmorillonita, bentonitas o tierras de diatomeas, o minerales sintéticos triturados, como sílice, alúmina o silicatos, especialmente silicatos de aluminio o magnesio. Como vehículos sólidos para gránulos son adecuados los siguientes: rocas naturales trituradas o fraccionados como calcita, mármol, piedra pómez, sepiolita y dolomita; gránulos sintéticos de harinas inorgánicas u orgánicas; gránulos de material orgánico como serrín, corteza de coco, carozos de maíz, peladuras de maíz o tallos de tabaco; tierra de infusorios, fosfato tricálcico, corcho en polvo o negro de humo absorbente; polímeros solubles en agua, resinas, ceras o fertilizantes sólidos. Estas composiciones sólidas pueden, si se desea, contener uno o más agentes humectantes, dispersantes, emulsionantes o colorantes que, cuando son sólidos, también pueden servir como diluyentes. El vehículo también puede ser un líquido, por ejemplo: agua; alcoholes, especialmente butanol o glicol, así como sus éteres o ésteres, especialmente acetato de metilglicol; cetonas, especialmente acetona, ciclohexanona, metiletilcetona, metilisobutilcetona o isoforona; fracciones de petróleo como hidrocarburos parafínicos o aromáticos, especialmente xilenos o alquilnaftalenos; aceites minerales o vegetales; hidrocarburos alifáticos clorados, especialmente tricloroetano o cloruro de metileno; hidrocarburos aromáticos clorados, especialmente clorobenzenos; solventes solubles en agua o fuertemente polares, como dimetilformamida, dimetilsulfóxido o N-metilpirrolidona; gases licuados; o similares o una mezcla de los mismos. El agente tensioactivo puede ser un agente emulsionante, agente dispersante o agente humectante de tipo iónico o no iónico, o una mezcla de estos agentes tensioactivos. Entre estos se encuentran, por ejemplo, sales de ácidos poliacrílicos, sales de ácidos lignosulfónicos, sales de

ácidos fenolsulfónicos o naftalensulfónicos, policondensados de óxido de etileno con alcoholes grasos, ácidos grasos, ésteres grasos o aminas grasas, fenoles sustituidos (especialmente alquilfenoles o arilfenoles), sales de ésteres de ácido sulfosuccínico, derivados de taurina (especialmente alquiltauratos), ésteres fosfóricos de alcoholes o policondensados de óxido de etileno con fenoles, ésteres de ácidos grasos con polioles, o derivados funcionales de sulfato, sulfonato o fosfato de los compuestos anteriores.

5 La presencia de al menos un agente tensioactivo es, generalmente, esencial cuando el principio activo y/o el vehículo inerte son sólo ligeramente solubles en agua o no son solubles en agua, y el agente vehículo de la composición para su aplicación es agua. Las composiciones de la invención pueden contener además otros aditivos como adhesivos o colorantes. En las formulaciones pueden usarse adhesivos como carboximetilcelulosa o polímeros naturales o sintéticos en forma de polvos, gránulos o retículas, como goma arábiga, polivinilalcohol o polivinilacetato, fosfolípidos naturales, como cefalinas o lecitinas, o fosfolípidos sintéticos. Es posible utilizar colorantes como pigmentos inorgánicos, por ejemplo: óxidos de hierro, óxidos de titanio o azul de Prusia; materiales colorantes orgánicos, como colorantes de alizarina, colorantes azo o colorantes de metal ftalocianina u oligoelementos como sales de hierro, magnesio, boro, cobre, cobalto, molibdeno o cinc. Para su aplicación agrícola, los compuestos de la invención están, por tanto, generalmente en forma de composiciones, las cuales están en diversas formas sólidas o líquidas.

10 Las formas sólidas de composiciones que pueden usarse son talco en polvo (con un contenido del compuesto de la invención que va hasta el 80%), polvos o gránulos humectantes (incluyendo gránulos dispersables en agua), especialmente aquellos obtenidos mediante extrusión, compactación, impregnación de un vehículo granular, o granulación inicial a partir de un polvo (estando el contenido del compuesto de la invención, en estos polvos o gránulos humectantes, entre aproximadamente el 0,5 y aproximadamente el 80%). Pueden usarse composiciones homogéneas u heterogéneas sólidas que contienen uno o más compuestos de la invención, por ejemplo gránulos, pastillas, aglomerados o cápsulas para aguas estancadas o corrientes durante un periodo de tiempo. Puede lograrse un efecto similar usando concentrados dispersables en el riego por goteo o en alimentadores intermitentes de agua como se describe en este documento. Entre las composiciones líquidas se incluye, por ejemplo soluciones acuosas o no acuosas o suspensiones (como concentrados emulsionables, emulsiones, fluidos, dispersiones o soluciones) o aerosoles. Las composiciones líquidas también incluyen, en especial, concentrados emulsionables, dispersiones, emulsiones, fluidos, aerosoles, polvos humectantes (o polvo para dispersión), fluidos secos o pastas como formas de composiciones que son líquidas o pretenden formar composiciones líquidas cuando se aplican, por ejemplo, como pulverizadores acuosos (incluyendo volumen bajo o ultrabajo) o como neblina o aerosoles.

20 Las composiciones líquidas, por ejemplo, en forma de concentrados emulsionables o solubles comprenden más frecuentemente de aproximadamente el 5 a aproximadamente el 80% en peso del principio activo, mientras que las emulsiones o soluciones que están listas para su aplicación contienen, en este caso, de aproximadamente el 0,01 a aproximadamente el 20% del principio activo. Además del solvente, los concentrados emulsionables o solubles pueden contener, cuando es necesario, de aproximadamente el 2 a aproximadamente el 50% de aditivos adecuados, como estabilizantes, tensioactivos, agentes de penetración, inhibidores de corrosión, colorantes o adhesivos. Pueden obtenerse emulsiones de cualquier concentración requerida, que sean adecuadas especialmente para su aplicación, por ejemplo, a plantas, a partir de estos concentrados mediante dilución con agua. Estas composiciones se incluyen dentro del alcance de las composiciones que pueden ser empleadas en la presente invención. Las emulsiones pueden estar en forma de tipo agua en aceite o aceite el agua y puede tener una consistencia espesa.

25 Las composiciones líquidas de esta invención pueden usarse, además de su uso agrícola normal, por ejemplo, en aplicaciones para tratar sustratos o sitios infestados o expuestos a infestación por artrópodos (u otras plagas controladas por compuestos de esta invención) incluyendo locales, áreas de almacenamiento o procesado externas o internas, recipientes, equipos o aguas estancada o corriente.

30 **[0051]** Todas estas dispersiones o emulsiones acuosas o mezclas para pulverización pueden aplicarse, por ejemplo, a las cosechas mediante cualquier sistema adecuado, sobre todo mediante pulverización, a tasas que generalmente son del orden de aproximadamente 100 a aproximadamente 1.200 litros de mezcla pulverizada, por hectárea, aunque puede ser mayor o menor (p. ej., volumen pequeño o ultrapequeño) dependiendo de la necesidad o de la técnica de aplicación. El compuesto o composiciones según la invención se aplican convenientemente a la vegetación y, en particular, a las raíces u hojas que tienen las plagas que se quieren eliminar. Otro procedimiento de aplicación de los compuestos o composiciones según la invención es mediante quimigación, es decir, la adición de una formulación que contiene el principio activo al agua de riego. Este riego puede ser riego por aspersión para pesticidas foliares o puede ser riego a nivel del suelo o riego subterráneo para pesticidas de suelo o sistémicos.

35 Las suspensiones concentradas, que pueden aplicarse mediante pulverización, se preparan así para producir un producto líquido estable que no se asiente (finamente triturado) y que normalmente contiene de aproximadamente el 10 a aproximadamente el 75% en peso del principio activo, de aproximadamente el 0,5 a aproximadamente el 30% de agentes tensioactivos, de aproximadamente el 0,1 a aproximadamente el 10% de agentes tixotrópicos; de

aproximadamente el 0 a aproximadamente el 30% de aditivos adecuados, como agentes antiespumantes, inhibidores de la corrosión, estabilizantes, agentes de penetración, adhesivos y, como vehículo, agua o un líquido orgánico en el que el principio activo es poco soluble o insoluble. Algunos sólidos orgánicos o sales inorgánicas pueden disolverse en el vehículo para ayudar a prevenir el asentamiento o actuar como anticongelantes para el

- 5
 Los polvos humectantes (o polvo para pulverización) normalmente se preparan de modo que contienen de aproximadamente el 10 a aproximadamente el 80% en peso del principio activo, de aproximadamente el 20 a aproximadamente el 90% de un vehículo sólido, de aproximadamente el 0 a aproximadamente el 5% de un agente humectante, de aproximadamente el 3 a aproximadamente el 10% de un agente dispersante y, cuando sea
 10 necesario, de aproximadamente el 0 a aproximadamente el 80% de uno o más estabilizantes y/u otros aditivos, como agentes de penetración, adhesivos, agentes antiaglomerantes, colorantes o similares. Para obtener estos polvos humectantes, el principio activo se mezcla bien en un mezclador adecuado con sustancias adicionales que pueden estar impregnadas en la carga porosa y se muele usando un molinillo u otro sistema de molido adecuado. Esto produce polvos humectantes, cuya humectabilidad y capacidad para formar suspensiones son ventajosas.
 15 Pueden suspenderse en agua para obtener cualquier concentración deseada y esta suspensión puede emplearse de forma muy ventajosa en particular para su aplicación al follaje de la planta.

[0052] Los "gránulos dispersables en agua (DA)" (gránulos que se dispersan fácilmente en agua) tienen composiciones que están sustancialmente próximas a las que los polvos humectantes. Pueden prepararse mediante
 20 la granulación de las formulaciones descritas para los polvos humectantes, bien por una vía húmeda (poniendo en contacto el principio activo finamente dividido con la carga inerte y un poco de agua, p. ej. del 1 al 20% en peso, o con una solución acuosa de un agente dispersante o aglutinante, seguido del secado y análisis) o mediante una vía seca (compactado seguido de molido y análisis).

- 25 Las tasas y concentraciones de las composiciones formuladas pueden variar según el procedimiento de aplicación, la naturaleza de las composiciones o el uso de las mismas. Hablando en general, las composiciones para la aplicación al control de plagas de artrópodos o nematodos de plantas normalmente contienen de aproximadamente el 0,00001% a aproximadamente el 95%; más especialmente de aproximadamente el 0,0005% en peso a aproximadamente el 50% en peso de uno o más compuestos de la invención, o de los principios activos totales (es
 30 decir, los compuestos de la invención, junto con otras sustancias tóxicas para artrópodos o nematodos de plantas, sinergistas, oligoelementos o estabilizantes). Las composiciones actuales empleadas y sus tasas de aplicación se seleccionarán para lograr los efectos deseados por el agricultor, productor ganadero, médico o veterinario, operario de control de plagas u otra persona experta en la materia.

- Las composiciones sólidas o líquidas para aplicación tópica a los animales, maderas, productos almacenados o enseres domésticos normalmente contienen de aproximadamente el 0,00005% a aproximadamente el 90%, más en particular, de aproximadamente el 0,001% a aproximadamente el 10% en peso de uno o más compuestos de la
 35 invención. Para su administración a animales por vía oral o parenteral, incluyendo composiciones sólidas o líquidas de forma percutánea, estas normalmente contienen de aproximadamente el 0,1% a aproximadamente el 90% en peso de uno o más compuestos de la invención. Los piensos medicados normalmente contienen de aproximadamente el 0,001 % a aproximadamente el 3% en peso de uno o más compuestos de la invención. Los
 40 concentrados o suplementos que se mezclan con los piensos normalmente contienen de aproximadamente el 5% a aproximadamente el 90%, preferiblemente de aproximadamente el 5% a aproximadamente el 50%, en peso de uno o más compuestos de la invención. Las piedras de sal mineral normalmente contienen de aproximadamente el 0,1% a aproximadamente el 10% en peso de uno o más compuestos de fórmula (I) o sales aceptables como pesticidas de los mismos.

- 45 Las composiciones líquidas o en polvo para aplicación a ganados, mercancías, locales o áreas externas contienen de aproximadamente el 0,0001% a aproximadamente el 15%, más especialmente, de aproximadamente el 0,005% a aproximadamente el 2,0% en peso de uno o más compuestos de la invención. Las concentraciones adecuadas en aguas tratadas están entre aproximadamente 0,0001 ppm y aproximadamente 20 ppm, más en particular, de aproximadamente 0,001 ppm a aproximadamente 5,0 ppm de uno o más compuestos de la invención, y pueden
 50 usarse terapéuticamente en piscicultura con tiempos de exposición apropiados. Los cebos comestibles pueden contener de aproximadamente el 0,01% a aproximadamente el 5%, preferiblemente de aproximadamente el 0,01% a aproximadamente el 1,0%, en peso, de uno o más compuestos de la invención.

- 55 Cuando se administran a vertebrados por vía parenteral, oral o percutánea, o por otro sistema, la dosis de compuestos de la invención dependerá de la especie, edad o salud del vertebrado y de la naturaleza y grado de sus actual o posible infestación por plagas de artrópodos o helmintos. Una dosis única de aproximadamente 0,1 a aproximadamente 100 mg, preferiblemente de 2,0 a aproximadamente 20,0 mg por kg de peso corporal del animal o dosis de aproximadamente 0,01 a aproximadamente 20,0 mg, preferiblemente de aproximadamente 0,1 a aproximadamente 5,0 mg por kg de peso corporal del animal al día, para medicación mantenida, es generalmente adecuada para administración oral o parenteral. Para el uso de las formulaciones o dispositivos de liberación

mantenida, pueden combinarse las dosis diarias durante periodos de meses y administrarse a los animales en una única ocasión.

Los siguientes EJEMPLOS 2A-2M de composición ilustran composiciones para su uso frente a artrópodos, especialmente ácaros o insectos, o nematodos de plantas, que comprenden como principio activo compuestos de la invención, como los descritos en los ejemplos preparatorios. Las composiciones descritas en los EJEMPLOS 2A-2M puede diluirse cada uno para obtener una composición pulverizable a concentraciones adecuadas para su uso en el campo. Las descripciones químicas genéricas de los componentes (para todos los cuales los porcentajes siguientes están en porcentaje en peso), usadas en los EJEMPLOS 2A-2M de composición recogidos a continuación, son las siguientes:

10

Nombre comercial	Descripción química
Etilán BCP	Óxido de nonilfenoetileno condensado
Soprofor BSU	Óxido de tristirilfenoetileno condensado
Arilán CA	Una solución al 70% p/v de dodecilbencensulfonato cálcico
Solvesso 150	Solvente aromático C ₁₀ débil
Arilán S	Dodecilbencensulfonato sódico
Darván NO ₂	Lignosulfonato sódico
Celita PF	Vehículo de silicato magnético sintético
Sopropón T36	Sales sódicas de ácidos policarboxílicos
Rodigel 23	Goma de xantano polisacárido
Bentona 38	Derivado orgánico de montmorillonita de magnesio
Aerosil	Dióxido de silicio microfino

EJEMPLO 2A

15

[0053] Se prepara un concentrado soluble en agua con la composición siguiente:

Principio activo	7%
Etilán BCP	10%
N-metilpirrolidona	83%

[0054] A una solución de Etilán BCP disuelto en una porción de N-metilpirrolidona se le añade el principio activo con calentamiento y agitación hasta su disolución. La solución resultante se ajusta a volumen con el resto del disolvente.

20

EJEMPLO 2B

[0055] Se prepara un concentrado emulsionable (CE) con la composición siguiente:

25

Principio activo	25% (máx.)
Soprofor BSU	10%
Arilán CA	5%
N-metilpirrolidona	50%
Solvesso 150	10%

[0056] Los tres primeros componentes se disuelven en N-metilpirrolidona y, a continuación, se añade a estos el Solvesso 150 para obtener el volumen final.

30 EXAMPLE 2C

[0057] Se prepara un polvo humectante (PH) con la composición siguiente:

Principio activo	40,00%
Arilán S	2%
Darván NO ₂	5%
Celita PF	53%

[0058] Los componentes se mezclan y trituran en un molino de martillos hasta conseguir un polvo con un tamaño de partícula de menos de 50 micras.

EJEMPLO 2D

5

[0059] Se prepara una formulación fluida acuosa con la composición siguiente:

Principio activo	40,00%
Etilán BCP	1,00%
Sopropón T36	0,20%
Etilénglicol	5,00%
Rodigel 230	0,15%
Agua	53,65%

10 **[0060]** Los ingredientes se mezclan intrínsecamente y se muelen en un molino de vidrio hasta que se obtiene un tamaño medio de partículas de menos de 3 micras.

EJEMPLO 2E

15

[0061] Se prepara un concentrado en suspensión emulsionable con la composición siguiente:

Principio activo	30,0%
Etilán BCP	10,0%
Bentona 38	0,5%
Solvesso 150	59,5%

[0062] Los ingredientes se mezclan intrínsecamente y se muelen en un molino de vidrio hasta que se obtiene un tamaño medio de partículas de menos de 3 micras.

20 **EJEMPLO 2F**

[0063] Se prepara un granulado dispersable en agua con la composición siguiente:

Principio activo	30%
Darván N° 2	15%
Arilán S	8%
Celita PF	47%

25 **[0064]** Los componentes se mezclan, micronizan en un molino de chorro y, a continuación, se granula en un granulador rotatorio pulverizando con agua (hasta el 10%). Los gránulos resultantes se secan en un secador de lecho fluido para eliminar el exceso de agua.

EJEMPLO 2G

30

[0065] Se prepara un talco en polvo con la composición siguiente:

Principio activo	1 a 10%
Polvo de talco superfino	99 a 90%

35 **[0066]** Los componentes se mezclan intrínsecamente y se muelen adicionalmente si es necesario para lograr un polvo fino. Este polvo puede aplicarse a un locus de infestación de artrópodos, por ejemplo, escoriales, productos almacenados, enseres domésticos o animales infestados, o en riesgo de infestación, por artrópodos para controlar los artrópodos mediante ingestión oral. Entre los sistemas adecuados para la distribución del talco en polvo al locus de infestación por artrópodos se incluyen ventiladores, agitador manual y dispositivos para autotratamiento del ganado.

40

EJEMPLO 2H

[0067] Se prepara un cebo comestible con la composición siguiente:

Principio activo	0,1 a 1,0%
Harina de trigo	80%
	(continua)
Melaza	19,9 a 19%

5 **[0068]** Los componentes se mezclan intrínsecamente y se les da la forma necesaria de cebo. Este cebo comestible puede distribuirse en un locus, por ejemplo en locales domésticos o industriales, p. ej. cocinas, hospitales o almacenes o zonas externas infestados por artrópodos, por ejemplo, hormigas, langostas, cucarachas o moscas, para controlar los artrópodos mediante ingestión oral.

EJEMPLO 2I

10 **[0069]** Se prepara una formulación en solución con la composición siguiente:

Principio activo	15%
Dimetilsulfóxido	85%

15 **[0070]** El principio activo se disuelve en dimetilsulfóxido mezclando y/o calentando si es necesario. Esta solución puede aplicarse por vía percutánea como una aplicación que se vierte sobre los animales domésticos infestados por artrópodos o, tras la esterilización mediante filtración a través de una membrana de politetrafluoroetileno (tamaño de poro 0,22 micrómetros), mediante inyección parenteral, a una tasa de aplicación de 1,2 a 12 ml de solución por 100 kg de peso corporal del animal.

EJEMPLO 2J

20 **[0071]** Se prepara un polvo humectante con la composición siguiente:

Principio activo	50%
Etilán BCP	5%
Aerosil	5%
Celita PF	40%

25 **[0072]** El Etilán BCP se absorbe al Aerosil que a continuación se mezcla con los otros componentes y se muele en un molino de martillos para obtener un polvo humectante, que puede diluirse con agua a una concentración del 0,001% al 2% en peso del compuesto activo y se aplica a un locus de infestación para artrópodos, por ejemplo, larvas de dípteros o nematodos de plantas, mediante pulverización, o a animales domésticos infestados por artrópodos, o en riesgo de infección, mediante pulverización o inmersión, o mediante administración oral en el agua potable, para el control de los artrópodos.

EJEMPLO 2K

35 **[0073]** Se forma una composición en bolo de liberación lenta a partir de gránulos que contiene los siguientes componentes en porcentaje variables (similar a los descritos para las composiciones previas) dependiendo de la necesidad:

- Principio activo
- Agente de densidad
- Agente de liberación lenta
- Aglutinante

40 **[0074]** Los componentes mezclados intrínsecamente se disponen en forma de gránulos que se comprimen en forma de bolo con una gravedad específica de 2 o superior. Este puede administrarse por vía oral a animales domésticos rumiantes para la retención en el retículo-rumen proporcionando una liberación lenta continua del compuesto activo a lo largo de un periodo de tiempo extenso para controlar la infestación por artrópodos de animales domésticos rumiantes.

EJEMPLO 2L

[0075] Una composición de liberación lenta en forma de gránulos, pastillas, aglomerados o similares puede prepararse con las siguientes composiciones:

Principio activo	0,5 a 25%
Polivinilcloruro	75 a 99,5%
Ftalato de dioctilo (plastificante)	

5 **[0076]** Los componentes se muelen y, a continuación, se les confiere la forma adecuada para la extrusión de masas fundidas o moldeado. Estas composiciones son útiles, por ejemplo, para su adición a agua estancada o para la fabricación de collares o marcas auriculares que se colocan en animales domésticos para controlar plagas mediante la liberación lenta.

10 EJEMPLO 2M

[0077] Se prepara un granulado dispersable en agua con la composición siguiente:

Principio activo	85% (máx.)
Polivinilpirrolidona	5%
Arcilla attapulgita	6%
Dodecil sulfato sódico	2%
Glicerina	2%

15

[0078] Los componentes se mezclan en forma de pasta al 45% con agua y se muelen en húmedo hasta un tamaño de partícula de 4 micras, a continuación se seca por pulverización para eliminar el agua.

Procedimientos para utilizar el pesticida

20

[0079] Los procedimientos de prueba representativos siguientes, usando los compuestos de la invención, se realizaron para determinar la actividad parasitocida y pesticida de los compuestos de la invención.

PROCEDIMIENTO A: procedimiento de análisis para comprobar la sistemicidad de compuestos frente a *Ctenocephalides felis* (pulga del gato)

25

[0080] Se rellenó un recipiente de ensayo con 10 adultos de *Ctenocephalides felis*. Se cerró un cilindro de vidrio por uno de sus extremos con parafilm y se colocó sobre el recipiente de ensayo. A continuación, la solución compuesta de prueba se pipeteó dentro de sangre de bovino y se añadió al cilindro de vidrio. Las *Ctenocephalides felis* tratadas se mantuvieron en esta prueba de perro artificial (sangre a 37°C, humedad relativa del 40-60%; *Ctenocephalides felis* a 20-22°C, humedad relativa del 40-60%) y la evaluación se realizó a las 24 y 48 horas tras la aplicación.

30

Los compuestos activos ofrecían al menos un control del 90% de *Ctenocephalides felis* a una concentración de prueba de 5 ppm o menos.

35

PROCEDIMIENTO B: análisis de *Diabrotica undecimpunctata* (gusano de la raíz del maíz)

[0081] Dos días después de la aplicación, las semillas de maíz se mojaron en agua en condiciones templadas para permitir una germinación rápida. Un día después de la aplicación, los huevos de *Diabrotica undecimpunctata* se transfirieron a un papel y medio de filtro japonés colocado en una placa de Petri de plástico. Después, se colocó una semilla de maíz germinada sobre una almohadilla húmeda junto al papel de filtro. Se pipetearon con cuidado tres gotas de 200 microlitros de solución compuesta de ensayo sobre el huevo. El resto de la solución se colocó sobre el maíz y, a continuación, se cerró la placa de Petri. Los huevos tratados en las placas de Petri se mantuvieron en una cámara climática durante 6 días. La eficacia del compuesto (porcentaje de huevos y/o larvas muertas en comparación con el control sin tratar) se evaluó 6 días después de la aplicación usando un microscopio binocular.

40

45

Los compuestos activos ofrecían al menos un control del 90% de *Diabrotica undecimpunctata* a una concentración de prueba de 10 ppm.

50 PROCEDIMIENTO C: Análisis de *Nephotettis cinciceps* (saltahojas del arroz)

[0082] Las hojas de 12 plantas de arroz con una longitud de tallo de 8 cm se sumergieron durante 5 segundos en una solución acuosa del compuesto de prueba formulado. Después de que la solución se haya escurrido, las plantas de arroz tratadas de este modo se colocaron en una placa de Petri y se poblaron con aproximadamente 20 larvas (estadio L3) de *Nephotettix cincticeps*. La placa de Petri se cerró y, a continuación, se mantuvo en una cámara climática (16 horas de ciclo día/noche, 25°C, humedad relativa del 40-60%). Tras 6 días de almacenamiento, se determinó el porcentaje de mortalidad de larvas de saltahojas. Los compuestos activos ofrecían al menos una mortalidad del 98% de larvas de *Nephotettix cincticeps* a una concentración de prueba de 100 ppm.

10 PROCEDIMIENTO D: procedimiento de análisis para comprobar la actividad de contacto frente a *Ctenocephalides felis* (pulga del gato)

[0083] Las soluciones de los compuestos de prueba se colocaron sobre el papel de filtro, se secaron, el papel de filtro se colocó dentro de tubos de ensayo y se infestó con 10 individuos adultos de *Ctenocephalides felis*. Las *Ctenocephalides felis* tratados se dejaron en una cámara climática (26°C, HR del 80%) y el porcentaje de eficacia se evaluó a las 24 horas y 48 horas tras la aplicación en comparación con el control sin tratar. Los compuestos activos ofrecían al menos un control del 70% de *Ctenocephalides felis* a una concentración de prueba de 1.000 ppm.

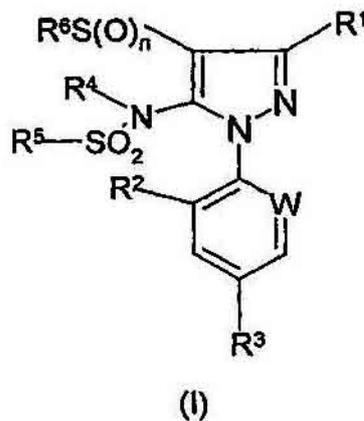
20 PROCEDIMIENTO E: procedimiento de análisis para comprobar la actividad de contacto frente a *Rhipicephalus sanguineus* (garrapata del perro)

[0084] Las soluciones de los compuestos del ensayo se colocaron sobre papel de filtro, se secaron, el papel se colocó en tubos de ensayo y se infestó con 20-30 larvas (L1) de *Rhipicephalus sanguineus* y los tubos se cerraron con una pinza. Las *Rhipicephalus sanguineus* tratadas se dejaron en una cámara climática (25°C, HR del 90%) y el porcentaje de eficacia se evaluó a las 24 horas tras la aplicación en comparación con el control sin tratar. Los compuestos activos ofrecían al menos un control del 70% de *Rhipicephalus sanguineus* a una concentración de prueba de 100 ppm.

30 **[0085]** Los siguientes números de compuestos eran activos en uno o más de los compuestos anteriores: 1-1, 1-2, 1-16, 1-44, 1-72, 1-85, 1-87, 1-90, 1-93, 1-94, 1-95, 1-96, 1-97, 1-116, 1-114, 1-115, 1-117, 1-118, 1-119; 1-120, 1-121, 1-122, 1-123, 1-124, 1-125, 1-126, 2-2, 2-16, 2-30, 2-45, 2-48, 2-51, 2-57, 2-58, 2-74, 2-80, 2-86, 2-92, 2-94, 2-109, 2-115, 2-121, 2-127, 2-128, 2-129, 2-144, 2-148, 2-149, 2-150, 2-151, 4-32, 4-33, 4-34, 4-35, 5-1, 5-9, 5-15, 5-16, 5-22, 5-30, 5-32, 5-36, 5-38, 5-40, 5-42, 5-46, 5-47, 5-48, 5-54, 5-60, 5-61, 5-75, 5-77, 5-81, 5-83, 5-86, 5-87, 5-88, 5-89, 5-150, 5-151 y 7-32.

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto de fórmula (I):



- 5 en el que:
 R¹ es alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆), CN, C(S)NH₂ u halógeno;
 W es N, C-CH₃ o C-halógeno;
 R² es H, CH₃ o halógeno;
 R³ es halo, alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆), S(O)_p-(C₁-C₆)-haloalquilo o SF₅;
- 10 R⁴ es H, alqueno (C₂-C₆), haloalqueno (C₂-C₆), alquino (C₂-C₆), haloalquino (C₂-C₆), cicloalquilo (C₃-C₇), -CO₂-(C₁-C₆)-alquilo, -CO₂-(C₃-C₇)-cicloalquilo, -CO₂-(C₁-C₄)-alquil-(C₃-C₇)-cicloalquilo, -CO₂-(C₃-C₆)-alqueno, -CO₂-(C₃-C₆)-alquino, -CO₂-(CH₂)_qR⁷, CONR⁸R⁹, -CO₂-(CH₂)_qR¹⁰, -(CH₂)_qR⁷, -(CH₂)_qR¹⁰, COR⁹, COCH₂NR⁸R⁹, -CO-(CH₂)_qR¹⁰; o alquilo (C₁-C₆) no sustituido o sustituido por uno o más radicales seleccionados entre el grupo
- 15 constituido por halógeno, alcoxi (C₁-C₆), haloalcoxi (C₁-C₆), cicloalquilo (C₃-C₇), S(O)_pR¹¹, CO₂-(C₁-C₆)-alquilo, -O(C=O)-(C₁-C₆)-alquilo, NR⁸R⁹, CONR⁸R⁹, SO₂NR⁸R⁹, OH, CN, NO₂, OR⁷, OR¹⁰, NR⁸COR¹² y NR⁸SO₂R¹¹;
 R⁵ es cicloalquilo (C₃-C₇), alqueno (C₂-C₆), haloalqueno (C₂-C₆), R¹³, R¹⁰, R¹⁷ o -CH=CH-R¹⁵; o es alquilo (C₁-C₁₅) sustituido o no sustituido por uno o más radicales seleccionados entre el grupo constituido por halógeno, alcoxi (C₁-C₆), haloalcoxi (C₁-C₆), alqueno (C₂-C₆), haloalqueno (C₂-C₆), alquino (C₂-C₆), haloalquino (C₂-C₆), cicloalquilo (C₃-C₇), S(O)_pR⁷, S(O)_pR¹⁰, S(O)_pR¹¹, CN, NO₂, OH, COR⁸, NR⁸COR¹², NR⁸SO₂R¹¹, CONR⁸R⁹, NR⁸R⁹, OR⁷, OR¹⁰, R¹³, R¹⁰ y CO₂R⁸, o un grupo metileno en el alquilo (C₁-C₆) sustituido o no sustituido se ha reemplazado por un grupo seleccionado entre -CO-, -O-, -S(O)_p-, -NR⁸-, -COO-, -OCO-, -CONR⁸-, -NR⁸CO-, -C(=NOR⁸)-, -C(=NR⁸R⁹)- y -C(=NR⁸)- siempre que el grupo sustituyente no se una directamente al grupo SO₂ en la fórmula (I);
 R⁶ y R¹¹ son independientemente cada uno alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆), alqueno (C₂-C₆), haloalqueno (C₂-C₆), alquino (C₂-C₆), haloalquino (C₂-C₆) o cicloalquilo (C₃-C₇);
 R⁷ es fenilo no sustituido o sustituido por uno o más radicales seleccionados entre el grupo constituido por halógeno, alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆), haloalcoxi (C₁-C₆), CN, NO₂, S(O)_pR¹¹ y NR⁸R¹²;
- 20 R⁸ es H, alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆), cicloalquilo (C₃-C₇), -(C₁-C₄)-alquil-(C₃-C₇)-cicloalquilo, -(CH₂)_qR⁷ o -(CH₂)_qR¹⁰;
- 30 R⁹ y R¹² son independientemente cada uno H, alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆), cicloalquilo (C₃-C₇) o -(C₁-C₄)-alquil-(C₃-C₇)-cicloalquilo; o
 R⁸ y R⁹ junto con el átomo de N unido forman un anillo saturado de cinco o seis átomos que opcionalmente contiene un heteroátomo adicional en el anillo que se selecciona entre O, S y N, estando el anillo no sustituido o sustituido por uno o más radicales seleccionados entre el grupo constituido por halógeno, alquilo (C₁-C₆) y haloalquilo (C₁-C₆);
- 35 R¹⁰ y R²⁰ son independientemente cada uno heterociclilo no sustituido o sustituido por uno o más radicales seleccionados entre el grupo constituido por halógeno, alquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄), S(O)_pR¹⁴, OH, OR⁷ y oxo;
 R¹³ es arilo no sustituido o sustituido por uno o más radicales seleccionados entre el grupo constituido por halógeno, alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆), haloalcoxi (C₁-C₆), CN, NO₂, S(O)_pR¹¹, SF₅, NR⁸R⁹, COR¹¹, COR⁷, CONR⁸R⁹, SO₂NR⁸R⁹, OH, OR⁷, R¹⁵, R¹⁶, OR¹⁶, SO₃H y alquilidenimino (C₁-C₆), CH=NOR¹⁴, S(O)_pR¹⁸, CO₂R¹⁹ y R²⁰;
- 40 R¹⁴ es alquilo (C₁-C₆) o haloalquilo (C₁-C₆);

- R^{15} es fenilo o naftilo cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos por uno o más radicales seleccionados entre el grupo constituido por halógeno, alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆) y alcoxi (C₁-C₆);
- R^{16} es un radical heteroaromático seleccionado entre el grupo constituido por piridilo, pirimidinilo, piridazinilo, pirazinilo, triazinilo, tienilo, tiazolilo, tiadiazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, furilo, pirrolilo, pirazolilo, imidazolilo y triazolilo, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos por uno o más radicales seleccionados entre el grupo constituido por halógeno, alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆) y alcoxi (C₁-C₆);
- R^{17} es un radical heteroaromático seleccionado entre el grupo constituido por piridilo, pirimidinilo, piridazinilo, pirazinilo, triazinilo, tienilo, tiazolilo, tiadiazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, furilo, pirrolilo, pirazolilo, imidazolilo y triazolilo, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos por uno o más radicales seleccionados entre el grupo constituido por halógeno, alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆) y alcoxi (C₁-C₆), y cuyo radical heteroaromático está sustituido por R^{15} , R^{16} u OR^{16} ;
- R^{18} es fenilo no sustituido o sustituido por uno o más radicales seleccionados entre el grupo constituido por halógeno, alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆) y alcoxi (C₁-C₆);
- R^{19} es alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆), R^{18} o -(C₁-C₆)-alquil-(C₁-C₃)-alcoxi;
- n, p y q son independientemente cada uno cero, uno o dos;
- cada heterociclilo en los radicales mencionados anteriormente es independientemente un radical heterocíclico que tiene de 3 a 6 átomos de anillo y 1, 2 ó 3 heteroátomos en el anillo, seleccionados entre el grupo constituido por N, O y S; y
- cada cicloalquilo C₃₋₇ en los radicales mencionados anteriormente está opcionalmente sustituido por halógeno o alquilo, o una sal aceptable como pesticida del mismo.
2. Un compuesto o una sal del mismo según la reivindicación 1 en el que:
- R^1 es alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆), CN, C(S)NH₂ u halógeno;
- W es N, C-CH₃ o C-halógeno;
- R^2 es H, CH₃ o halógeno;
- R^3 es halo, alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆), S(O)_p-(C₁-C₆)-haloalquilo o SF₅;
- R^4 es H, alquelinilo (C₂-C₆), haloalquelinilo (C₂-C₆), alquinilo (C₂-C₆), haloalquinilo (C₂-C₆), cicloalquilo (C₃-C₇), -CO₂-(C₁-C₆)-alquilo, -CO₂-(C₃-C₇)-cicloalquilo, -CO₂-(C₁-C₄)-alquilo-(C₃-C₇)-cicloalquilo, -CO₂-(C₃-C₆)-alquelinilo, -CO₂-(C₃-C₆)-alquinilo, -CO₂-(CH₂)_qR⁷, CONR⁸R⁹, -CO₂-(CH₂)_qR¹⁰, -(CH₂)_qR⁷, -(CH₂)_qR¹⁰, COR⁹, COCH₂NR⁸R⁹, -CO-(CH₂)_qR⁷ o -CO-(CH₂)_qR¹⁰; o alquilo (C₁-C₆) no sustituido o sustituido por uno o más radicales seleccionados entre el grupo constituido por halógeno, alcoxi (C₁-C₆), haloalcoxi (C₁-C₆), cicloalcoxi (C₃-C₇), S(O)_pR¹¹, CO₂-(C₁-C₆)-alquilo, -O(C=O)-(C₁-C₆)-alquilo, NR⁸R⁹, CONR⁸R⁹, SO₂NR⁸R⁹, OH, CN, NO₂, OR⁷, OR¹⁰, NR⁸COR¹² y NR⁸SO₂R¹¹;
- R^5 es cicloalquilo (C₃-C₇), alquelinilo (C₂-C₆), haloalquelinilo (C₂-C₆), R^{13} , R^{10} , R^{17} o -CH=CH- R^{15} ; o es alquilo (C₁-C₆) sustituido o no sustituido por uno o más radicales seleccionados entre el grupo constituido por halógeno, alcoxi (C₁-C₆), haloalcoxi (C₁-C₆), alquelinilo (C₂-C₆), haloalquelinilo (C₂-C₆), alquinilo (C₂-C₆), haloalquinilo (C₂-C₆), cicloalquilo (C₃-C₇), S(O)_pR⁷, S(O)_pR¹⁰, S(O)_pR¹¹, CN, NO₂, OH, COR⁸, NR⁸COR¹², NR⁸SO₂R¹¹, CONR⁸R⁹, NR⁸R⁹, OR⁷, OR¹⁰, R^{13} , R^{10} y CO₂R⁶, o un grupo metileno en el alquilo (C₁-C₆) sustituido o no sustituido se ha reemplazado por un grupo seleccionado entre -CO-, -O-, -S(O)_p-, -NR⁸-, -COO-, -OCO-, -CONR⁸-, -NR⁸CO-, -C(=NOR⁸)-, -C(=N-NR⁸R⁹)- y -C(=NR⁸)- siempre que el grupo sustituyente no se una directamente al grupo SO₂ en la fórmula (I);
- R^6 y R^{11} son independientemente cada uno alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆), alquelinilo (C₂-C₆), haloalquelinilo (C₂-C₆), alquinilo (C₂-C₆), haloalquinilo (C₂-C₆), alquelinilo (C₂-C₆), haloalquelinilo (C₂-C₆) o cicloalquilo (C₃-C₇);
- R^7 es fenilo no sustituido o sustituido por uno o más radicales seleccionados entre el grupo constituido por halógeno, alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆), haloalcoxi (C₁-C₆), CN, NO₂, S(O)_pR¹¹ y NR⁸R¹²;
- R^8 es H, alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆), cicloalquilo (C₃-C₇), -(C₁-C₄)-alquil-(C₃-C₇)-cicloalquilo, -(CH₂)_qR⁷ o -(CH₂)_qR¹⁰;
- R^9 y R^{12} son independientemente cada uno H, alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆), cicloalquilo (C₃-C₇) o -(C₁-C₄)-alquil-(C₃-C₇)-cicloalquilo; o
- R^8 y R^9 junto con el átomo de N unido forman un anillo saturado de cinco o seis átomos que opcionalmente contiene un heteroátomo adicional en el anillo que se selecciona entre O, S y N, estando el anillo no sustituido o sustituido por uno o más radicales seleccionados entre el grupo constituido por halógeno, alquilo (C₁-C₆) y haloalquilo (C₁-C₆);
- R^{10} es heterociclilo no sustituido o sustituido por uno o más radicales seleccionados entre el grupo constituido por halógeno, alquilo (C₁-C₄), haloalquilo (C₁-C₄), alcoxi (C₁-C₄), S(O)_pR¹⁴, OH, OR⁷ y oxo;
- R^{13} es arilo no sustituido o sustituido por uno o más radicales seleccionados entre el grupo constituido por halógeno, alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆), alcoxi (C₁-C₆), haloalcoxi (C₁-C₆), CN, NO₂, S(O)_pR¹¹, SF₅, NR⁸R⁹, COR¹¹, COR⁷, CONR⁸R⁹, SO₂NR⁸R⁹, OH, OR⁷, R^{15} , R^{16} , OR¹⁶, SO₃H y alquilidenimino (C₁-C₆);
- R^{14} es alquilo (C₁-C₆) o haloalquilo (C₁-C₆);
- R^{15} es fenilo o naftilo cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos por uno o más radicales seleccionados entre el grupo constituido por halógeno, alquilo (C₁-C₆), haloalquilo (C₁-C₆) y alcoxi (C₁-C₆);

- R^{16} es un radical heteroaromático seleccionado entre el grupo constituido por piridilo, pirimidinilo, piridazinilo, pirazinilo, triazinilo, tienilo, tiazolilo, tiadiazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, furilo, pirrolilo, pirazolilo, imidazolilo y triazolilo, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos por uno o más radicales seleccionados entre el grupo constituido por halógeno, alquilo (C_1-C_6), haloalquilo (C_1-C_6) y alcoxi (C_1-C_6);
- 5 R^{17} es un radical heteroaromático seleccionado entre el grupo constituido por piridilo, pirimidinilo, piridazinilo, pirazinilo, triazinilo, tienilo, tiazolilo, tiadiazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, furilo, pirrolilo, pirazolilo, imidazolilo y triazolilo, cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos por uno o más radicales seleccionados entre el grupo constituido por halógeno, alquilo (C_1-C_6), haloalquilo (C_1-C_6) y alcoxi (C_1-C_6), y cuyo radical heteroaromático está sustituido por R^{15} , R^{16} u OR^{16} ;
- 10 n, p y q son independientemente cada uno cero, uno o dos; y cada heterociclilo en los radicales mencionados anteriormente es independientemente un radical heterocíclico que tiene de 3 a 6 átomos de anillo y 1, 2 ó 3 heteroátomos en el anillo, seleccionados entre el grupo constituido por N, O y S.
- 15 3. Un compuesto o una sal del mismo según se reivindica en las reivindicaciones 1 ó 2 en el que R^1 es CN.
4. Un compuesto o una sal del mismo según se reivindica en las reivindicaciones 1, 2 ó 3 en el que W es C-Cl.
- 20 5. Un compuesto o una sal del mismo según se reivindica en una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4 en el que R^2 es cloro.
- 25 6. Un compuesto o una sal del mismo según se reivindica en una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5 en el que R^3 es CF_3 .
- 30 7. Un compuesto o una sal del mismo según se reivindica en una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 6 en el que R^4 es H, alqueno (C_3-C_6), alquino (C_3-C_6), cicloalquilo (C_3-C_7), $-CO_2-(C_1-C_6)$ -alquilo, $-(CH_2)_qR^7$ o $COCH_2NR^8R^9$; o alquilo (C_1-C_6) no sustituido o sustituido por uno o más radicales seleccionados entre el grupo constituido por halógeno, cicloalquilo (C_3-C_7) y $S(O)_pR^{11}$.
- 35 8. Un compuesto o una sal del mismo según se reivindica en una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 7 en el que R^5 es R^{13} o R^{10} ; o alquilo (C_1-C_6) no sustituido o sustituido por uno o más radicales seleccionados entre el grupo constituido por halógeno, R^{13} y R^{10} .
- 40 9. Un compuesto o una sal del mismo según se reivindica en una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 8 en el que R^6 es CF_3 .
10. Un compuesto o una sal del mismo según se reivindica en una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 9 en el que:
 R^1 es CN;
W es C-Cl;
 R^2 es cloro;
 R^3 es CF_3 ;
- 45 R^4 es H, alqueno (C_3-C_4), alquino (C_3-C_4), cicloalquilo (C_3-C_6), $-CO_2-(C_1-C_3)$ -alquilo, $-(CH_2)_qR^7$ o $COCH_2NR^8R^9$; o alquilo (C_1-C_4) no sustituido o sustituido por uno o más radicales seleccionados entre el grupo constituido por halógeno, cicloalquilo (C_3-C_6) y $S(O)_pR^{11}$;
 R^5 es R^{13} o R^{10} ; o alquilo (C_1-C_4) no sustituido o sustituido por uno o más radicales seleccionados entre el grupo constituido por halógeno, R^{13} y R^{10} ;
- 50 R^6 es CF_3 ;
 R^7 es fenilo no sustituido o sustituido por uno o más radicales seleccionados entre el grupo constituido por halógeno, alquilo (C_1-C_2), haloalquilo (C_1-C_2) y alcoxi (C_1-C_2);
 R^8 es H o alquilo (C_1-C_3);
 R^9 es H o alquilo (C_1-C_3);
- 55 R^{10} es heterociclilo no sustituido o sustituido por uno o más radicales seleccionados entre el grupo constituido por halógeno, alquilo (C_1-C_2), haloalquilo (C_1-C_2), alcoxi (C_1-C_2) y $S(O)_pR^{14}$;
 R^{11} y R^{14} son independientemente cada uno alquilo (C_1-C_2) o haloalquilo (C_1-C_2);
 R^{13} es fenilo no sustituido o sustituido por uno o más radicales seleccionados entre el grupo constituido por halógeno, alquilo (C_1-C_2), haloalquilo (C_1-C_2), alcoxi (C_1-C_2), haloalcoxi (C_1-C_2), CN, NO_2 , $S(O)_pR^{11}$ y NR^8R^9 ;

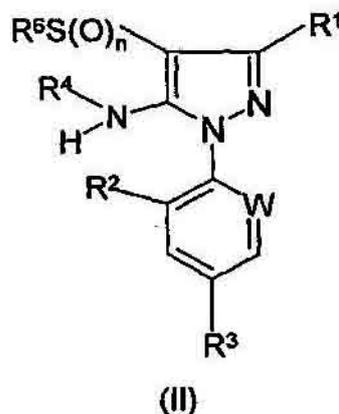
n y p son independientemente cada uno 0, 1 ó 2;

q es 0 o 1; y

5 cada heterociclilo en los radicales mencionados anteriormente es independientemente un radical heteroaromático seleccionado entre el grupo constituido por piridilo, pirimidinilo, piridazinilo, pirazinilo, triazinilo, tienilo, tiazolilo, tiadiazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, furilo, pirrolilo, pirazolilo, imidazolilo y triazolilo.

11. Un proceso para la preparación de un compuesto de fórmula (I) o una sal del mismo según se define en una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 10, cuyo proceso comprende:

10 a) en el que R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^6 , W y n son como se define en la reivindicación 1, que reacciona con un compuesto de fórmula (III):



en la que R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^6 , W y n son como se define en la reivindicación 1, con un compuesto de fórmula (III):



15

en la que R^5 es como se define en la reivindicación 1 y L^1 es un grupo saliente; o

b) en la que R^1 , R^2 , R^3 , R^5 , R^6 , W y n son como se define en la reivindicación 1 y R^4 es como se define en la reivindicación 1 con la exclusión de hidrógeno, la alquilación o acilación del compuesto correspondiente de fórmula (I) en la que R^4 es hidrógeno; o

20 c) en la que R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 y W son como se define en la reivindicación 1, y n es 1 ó 2, oxidando un compuesto correspondiente en el cual n es 0 ó 1; y

d) si se desea, convirtiendo un compuesto resultante de fórmula (I) en una sal aceptable como pesticida del mismo.

12. Una composición pesticida que comprende un compuesto de fórmula (I) o una sal aceptable como
25 pesticida del mismo según se define en una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 10, en asociación con un diluyente o vehículo aceptable como pesticida y/o un agente tensioactivo.

13. El uso de un compuesto de fórmula (I) o una sal del mismo según una cualquiera de las
30 reivindicaciones 1 a 10 o de una composición según la reivindicación 12, para la preparación de un medicamento veterinario.

14. Un compuesto de fórmula (I) o una sal del mismo para su uso en el control de parásitos de animales.

15. Un compuesto para su uso según la reivindicación 14 en el que el animal es un perro o un gato.
35

16. El uso no terapéutico de un compuesto de fórmula (I) o una sal del mismo según una cualquiera de las
reivindicaciones 1 a 10 o de una composición según la reivindicación 12 para el control de plagas.

17. Un procedimiento no terapéutico para el control de plagas en un locus que comprende la aplicación de
40 una cantidad eficaz de un compuesto de fórmula (I) o una sal del mismo según una cualquiera de las reivindicaciones 1 a 10 o de una composición según la reivindicación 12.