

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 370 534**

51 Int. Cl.:
C07D 213/74 (2006.01) **A01N 43/90** (2006.01)
A01N 43/40 (2006.01)
A01N 43/42 (2006.01)
A01N 43/54 (2006.01)
A01N 43/56 (2006.01)
A01N 43/60 (2006.01)
A01N 43/78 (2006.01)
A01N 43/80 (2006.01)
A01N 43/836 (2006.01)
A01N 43/84 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Número de solicitud europea: **07767294 .7**
 96 Fecha de presentación: **20.06.2007**
 97 Número de publicación de la solicitud: **2030971**
 97 Fecha de publicación de la solicitud: **04.03.2009**

54 Título: **AGENTE PARA EL CONTROL DE PLAGAS QUE CONTIENE UN DERIVADO DE PIRIDIL-METANAMINA NOVEDOSO O UNA DE SUS SALES.**

30 Prioridad:
20.06.2006 JP 2006170283

45 Fecha de publicación de la mención BOPI:
19.12.2011

45 Fecha de la publicación del folleto de la patente:
19.12.2011

73 Titular/es:
**ISHIHARA SANGYO KAISHA, LTD.
3-15, EDOBORI 1-CHOME, NISHI-KU
OSAKA-SHI OSAKA 550-0002, JP**

72 Inventor/es:
**KIMURA, Hirohiko;
MORITA, Masayuki;
YAMAMOTO, Kazuhiro;
UEKI, Toshihiko;
AZUMA, Kumiko y
HAMAMOTO, Taku**

74 Agente: **Ungría López, Javier**

ES 2 370 534 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

Agente para el control de plagas que contiene un derivado de piridil-metanamina novedoso o una de sus sales.

5 **Campo Técnico**

La presente invención se refiere a un derivado de piridil-metanamina novedoso o una de sus sales, y un plaguicida que lo contiene como ingrediente activo.

10 **Técnica Anterior**

Los Documentos de Patente 1 a 3 describen derivados de piridina que tienen estructuras químicas específicas respectivamente. Sin embargo, el compuesto descrito en el Documento de Patente 1 y el compuesto descrito en el Documento de Patente 2 difieren del derivado de piridil-metanamina de la presente invención en el radical R⁴ y el radical R⁵ en la fórmula (I) anteriormente mencionada, respectivamente. Mientras que, el Documento de Patente 3 no describe específicamente el derivado de piridil-metanamina de la presente invención. Además, los compuestos descritos en los Documentos de Patente 1 a 3 son todos compuestos para usos médicos o farmacéuticos y no compuestos para plaguicidas.

20 El Documento de Patente 4 se refiere a triclorometilbenzilaminas artropodocidas. El Documento de Patente 5 se refiere compuestos heterocíclicos sustituidos con nitro, procedimientos para su preparación, y su uso como insecticidas.

25 El Documento No de Patente 1 describe N-(2-piridilmetil)-3,5,6-tricloro-4-(trifluorometil)-2-piridilamina que es un compuesto contenido en la fórmula (I) anteriormente mencionada, pero no describe un plaguicida que contenga tal compuesto como ingrediente activo.

Documento de Patente 1: WO 01/62233

Documento de Patente 2: WO 02/66470

Documento de Patente 3: WO 04/91518

30 Documento de Patente 4: WO 91/12228

Documento de Patente 5: JP 3-197460 A

Documento de No de Patente 1: Chemistry Express 7, 473-476 (1992)

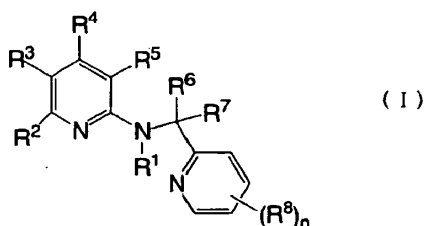
35 **Descripción de la Invención****Problemas a Ser Resueltos por la Invención**

40 Durante muchos años, se han utilizado muchos plaguicidas, pero muchos de ellos tienen diversos problemas tales como que los efectos son inadecuados, su uso queda restringido a medida que las plagas adquieren resistencia, etc. Por lo tanto, se desea desarrollar un plaguicida novedoso sustancialmente libre de tales problemas, por ejemplo, un plaguicida capaz de controlar diversas plagas que crean problemas en los campos agrícolas y hortícolas o un plaguicida capaz de controlar plagas parásitas en animales.

45 **Medios Para Resolver los Problemas**

Los autores de la presente invención han llevado a cabo diversos estudios sobre el derivado de piridil-metanamina en un esfuerzo para encontrar un plaguicida superior. Como resultado, han encontrado que un derivado de piridil-metanamina novedoso tiene un efecto plaguicida extremadamente alto contra plagas a una dosis baja y al mismo tiempo es seguro para las plantas de cultivo, el enemigo natural de las plagas, o mamíferos, y han completado la presente invención.

50 Es decir, la presente invención se refiere a un derivado de piridil-metanamina representado por la fórmula (I) o su sal:



55 donde R¹ es hidrógeno, alquilo que puede estar sustituido con R^b, alqueniilo que puede estar sustituido con R^b, alquinilo que puede estar sustituido con R^b, arilo, ciano, N=CHR^c, OR^c, S(O)_pR^c, COSR^c, COOR^c, COR^c, o un grupo heterocíclico que puede estar sustituido con alquilo o haloalquilo; cada uno de R² y R³ que son independientes entre sí, es hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, alquilo que puede estar sustituido con R⁸, cicloalquilo, alqueniilo, alquinilo,

arilo, un grupo heterocíclico, NR^aR^c , OR^a , SR^a , COR^a , COOR^a , CONR^aR^c , $\text{CH}=\text{NOR}^a$, SO_2R^a o SOR^a ; R^4 es trifluorometilo o clorodifluorometilo; R^5 es hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, alquilo que puede estar sustituido con R^8 , alquenilo que puede estar sustituido con R^8 , alquinilo que puede estar sustituido con R^8 , OR^a , SR^a , NR^aR^c , COOR^a o COR^a ; cada uno de R^6 y R^7 que son independientes entre sí, es hidrógeno, ciano, alquilo, haloalquilo o cicloalquilo, o R^6 y R^7 pueden formar juntos cicloalquilo C3-C6 que puede estar sustituido con halógeno; R^8 es alquilo, cicloalquilo, alcoxialquilo, alcoxialcoxialquilo, hidroxialquilo, halógeno, haloalquilo, ciano, nitro, arilo que puede estar sustituido con halógeno, un grupo heterocíclico que puede estar sustituido con halógeno, oxi heterocíclico que puede estar sustituido con halógeno, CONR^aR^c , COR^c , COOR^c , NR^aR^c o OR^a ; R^a es hidrógeno, alquilo, cicloalquilo, haloalquilo o alquilo heterocíclico; R^b es halógeno, arilo que puede estar sustituido con R^8 , un grupo heterocíclico que puede estar sustituido con R^8 , oxi heterocíclico que puede estar sustituido con R^8 , tio heterocíclico que puede estar sustituido con R^8 , ciano, NR^aR^c , NHCOOR^a , COR^c , COOR^c , CONR^aR^c , alcoxialcoxi, OR^a o $\text{S}(\text{O})_p\text{R}^a$; R^c es hidrógeno, alquilo, haloalquilo, cicloalquilo, alcoxialquilo, hidroxialquilo, arilo que puede estar sustituido con halógeno, o un grupo heterocíclico que puede estar sustituido con haloalquilo; n es un número entero de 0 a 4, p es un número entero de 0 a 2, en el radical NR^aR^c en cada uno de los sustituyentes anteriores, R^a y R^c pueden formar juntos un anillo heterocíclico de 5 o 6 miembros junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos como se define en la reivindicación 1. La presente invención también se refiere a un método para producir un derivado de piridil-metanamina o su sal, como se define en la reivindicación 5; un plaguicida que comprende, como ingrediente activo, un derivado de piridil-metanamina o su sal, como se define en la reivindicación 6; y el uso de una piridil-metanamina para controlar una plaga, como se define en la reivindicación 10.

Efectos de la Invención

Un plaguicida que contiene el derivado de piridil-metanamina de la fórmula (I) anterior como ingrediente activo, tiene un efecto plaguicida muy alto contra las plagas a una dosis baja.

Mejor Modo de Llevar a Cabo la Invención

En cuanto al halógeno o al halógeno como sustituyente en la fórmula (I), se pueden mencionar un átomo de flúor, cloro, bromo o yodo. El número de halógenos como sustituyentes puede ser 1 o más, y si fuera más, los halógenos respectivos pueden ser iguales o diferentes. Además, las posiciones para la sustitución de tales halógenos pueden ser posiciones cualesquiera:

El alquilo o el radical alquilo en el alcoxi en la fórmula (I) puede ser lineal o ramificado. En cuanto a su ejemplo específico, se puede mencionar alquilo C1-C6 tal como metilo, etilo, propilo, isopropilo, butilo, terc-butilo, pentilo o hexilo.

En cuanto al cicloalquilo en la fórmula (I), se puede mencionar, por ejemplo, cicloalquilo C3-C6 tal como ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo o ciclohexilo.

El alquenilo en la fórmula (I) puede ser lineal o ramificado. En cuanto a su ejemplo específico, se puede mencionar alquenilo tal como vinilo, 1-propenilo, alilo, isopropenilo, 1-butenilo, 1,3-butadienilo o 1-hexenilo.

El alquinilo en la fórmula (I) puede ser lineal o ramificado. En cuanto a su ejemplo específico, se puede mencionar alquinilo C2-C6 tal como etinilo, 2-butenilo, 2-pentinilo, 3-metil-1-butenilo, 2-penten-4-inilo o 3-hexinilo.

En cuanto al arilo en la fórmula (I), se puede mencionar, por ejemplo, arilo C6-C10 tal como fenilo o naftilo.

El grupo heterocíclico o un radical heterocíclico en el alquilo heterocíclico, el oxi heterocíclico o el tio heterocíclico en la fórmula (I) incluye un grupo heterocíclico fusionado además de un grupo heterocíclico monocíclico. El grupo heterocíclico monocíclico puede ser, por ejemplo, un grupo heterocíclico de 3 miembros tal como oxirano; un grupo heterocíclico de 5 miembros tal como furilo, tetrahydrofurilo, tienilo, pirrolilo, pirrolinilo, pirrolidinilo, dioxolanilo, oxazolilo, isoxazolilo, dihidroisoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, imidazolilo, imidazolinilo, imidazolidinilo, pirazolilo, pirazolinilo, pirazolidinilo, triazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, tetrazolilo, 1,3-dioxolanilo, 1,3-oxatolanilo o 1,3-oxatolanil-3-óxido; o un grupo heterocíclico de 6 miembros tal como piranilo, piridilo, piperidinilo, dioxanilo, oxazinilo, morfolinilo, tiazinilo, piridazinilo, pirimidinilo, pirazinilo, piperazinilo, triazinilo, 1,3-dioxanilo, tetrahidropiranilo, 2H-1,4-oxatienilo o 1,3-ditioranilo. Entre tales grupos heterocíclicos monocíclicos, se prefiere un grupo heterocíclico monocíclico de 5 o 6 miembros que contiene de 1 a 4 átomos de al menos un tipo seleccionado del grupo que consiste en O, S y N. El grupo heterocíclico fusionado puede ser, por ejemplo, benzofuranilo, isobenzofuranilo, dihidrobenzofuranilo, dihidroisobenzofuranilo, benzotienilo, isobenzotienilo, dihidrobenzotienilo, dihidroisobenzotienilo, tetrahydrobenzotienilo, indolilo, isoindolilo, benzoxazolilo, benzotiazolilo, indazolilo, benzimidazolilo, benzodioxolanilo, benzodioxanilo, cromenilo, cromanilo, isocromanilo, cromonilo, cromanonilo, quinolilo, isoquinolilo, cinnolinilo, ftalazinilo, quinazolinilo, quinoxalinilo, indolizínilo, quinolizínilo, imidazopiridilo, naftiridinilo, pteridinilo, dihidrobenzoxazinilo, dihidrobenzoxazinonilo, dihidrobenzoxazinonilo, benzotioxanilo o imidazopiridinilo. Entre tales grupos heterocíclicos fusionados, se prefiere un grupo heterocíclico fusionado de 8 a 10 miembros que contiene de 1 a 4 átomos de al menos un tipo seleccionado del grupo que consiste en O, S y N.

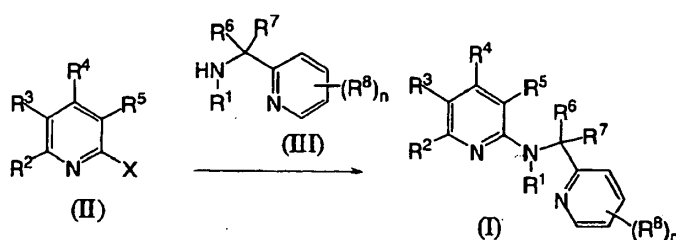
En el radical NR^aR^c en cada uno de los sustituyentes en la fórmula (I), R^a y R^c pueden formar juntos un anillo heterocíclico de 5 o 6 miembros junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos. Tal anillo heterocíclico de 5 o 6 miembros puede contener por añadidura, además del átomo de nitrógeno al que están unidos R^a y R^c , al menos un heteroátomo. Tal anillo heterocíclico puede ser, por ejemplo, pirrolidinilo, pirazolidinilo, piperazinilo o morfolinilo. Además, el cicloalquilo C3-C6 que está formado por R^6 y R^7 en la fórmula (I) puede ser un cicloalquilo tal como ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo o ciclohexilo, que puede estar sustituido con un átomo de halógeno.

La sal del derivado de piridil-metanamina representado por la fórmula (I) anterior incluye todas las clases con tal que sea aceptable desde el punto de vista agrícola. Por ejemplo, se pueden mencionar una sal de metal alcalino tal como una sal de sodio o una sal de potasio; una sal de metal alcalinotérreo tal como una sal de magnesio o una sal de calcio; una sal de amonio tal como una sal de dimetilamonio o una sal de trietilamonio; una sal de ácido inorgánico tal como un hidrocloruro, un perclorato, un sulfato o un nitrato; o una sal orgánica tal como un acetato o un metanosulfonato.

El derivado de piridil-metanamina representado por la fórmula (I) anterior puede tener isómeros ópticos o isómeros geométricos, y tales isómeros y las mezclas de los mismos están incluidos ambos en la presente invención. En la presente descripción, los isómeros se describen en forma de mezclas, a no ser que se especifique lo contrario. Además, en la presente invención, se pueden incluir varios isómeros distintos de los mencionados anteriormente, dentro del alcance del conocimiento normal en este campo técnico. Además, dependiendo del tipo de tal isómero, la estructura química puede ser diferente de la fórmula (I) anteriormente mencionada, pero resulta obvio para un experto en la técnica que tal estructura está en relación isomérica y de este modo encaja dentro del alcance de la presente invención.

El derivado de piridil-metanamina representado por la fórmula (I) anterior o una de sus sales se pueden producir por medio de los siguientes procedimientos de producción [1] a [10] y de acuerdo con un método habitual para la producción de una sal.

PROCEDIMIENTO DE PRODUCCIÓN [1]



R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 y n se definen como antes; y X es halógeno, y el halógeno puede ser un átomo de flúor, cloro, bromo o yodo.

La reacción para el procedimiento de producción [1] se puede llevar a cabo en presencia de un disolvente.

El disolvente puede ser cualquier disolvente con tal que sea inerte para la reacción. Por ejemplo, puede ser un alcohol tal como metanol, etanol, propanol o butanol; un hidrocarburo aromático tal como benceno, tolueno o xileno; un hidrocarburo alifático tal como pentano, hexano, heptano, éter de petróleo, ligroína o benzina de petróleo; un éter tal como éter dietílico, éter dipropílico, éter dibutílico, tetrahidrofurano o dioxano; un éster tal como acetato de metilo o acetato de etilo; un nitrilo tal como acetonitrilo o propionitrilo; un amiduro de ácido tal como dimetilformamida o dimetilacetamida; un sulfóxido tal como dimetilsulfóxido; una sulfona tal como sulfolano; un amiduro de ácido fosfórico tal como hexametilfosforamida; un hidrocarburo halogenado tal como cloroformo, diclorometano, tetracloruro de carbono o 1,2-dicloroetano; o una mezcla disolvente de los mismos.

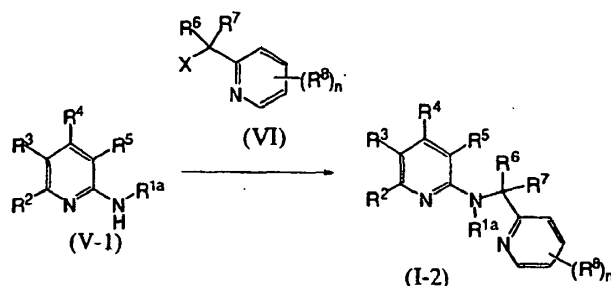
En la reacción para el procedimiento de producción [1], con el fin de llevar a cabo la reacción eficazmente, la reacción se puede llevar a cabo en presencia de una base, según requiera el caso. Tal base puede ser, por ejemplo, una base orgánica tal como trietilamina o piridina; un hidróxido de metal alcalino tal como hidróxido de sodio o hidróxido de potasio; un carbonato de metal alcalino tal como carbonato de litio, carbonato de sodio o carbonato de potasio; un hidrogenocarbonato de metal alcalino tal como hidrogenocarbonato de litio, hidrogenocarbonato de sodio o hidrogenocarbonato de potasio; un hidruro de metal alcalino tal como hidruro de litio, hidruro de sodio o hidruro de potasio; o un alcóxido de metal alcalino tal como metóxido de sodio, etóxido de sodio o terc-butóxido de potasio.

En la reacción para el procedimiento de producción [1], el compuesto de la fórmula (III) se puede utilizar en una proporción de 0,8 a 5 equivalentes, preferiblemente de 1 a 2,5 equivalentes, con respecto a 1 mol del compuesto de la fórmula (II),

La reacción para el procedimiento de producción [1] se lleva a cabo usualmente a una temperatura de reacción de 0 a 150°C, preferiblemente de 0 a 100°C. El tiempo de reacción es usualmente de 0,5 a 100 horas.

Se pueden combinar mutuamente de manera adecuada diversas condiciones de reacción en el procedimiento de producción [1]. Además, entre estas condiciones de reacción, existen condiciones de reacción de intervalos usuales y condiciones de reacción de intervalos preferidos, y se pueden seleccionar y combinar también mutuamente de manera adecuada.

PROCEDIMIENTO DE PRODUCCIÓN [2]



R^{1a} es alquilo que puede estar sustituido con R^b , alquenilo que puede estar sustituido con R^b , alquinilo que puede estar sustituido con R^b , arilo, un grupo heterocíclico que puede estar sustituido con alquilo o haloalquilo, $N=CHR^c$, OR^c , $S(O)_pR^c$, $COSR^c$, $COOR^c$ o COR^c , y R^b , R^c , p , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^9 , n y X se definen como antes.

La reacción para el procedimiento de producción [2] se puede llevar a cabo en presencia de una base y un disolvente.

La base puede ser, por ejemplo, un hidruro de metal alcalino tal como hidruro de sodio o hidruro de potasio; un hidróxido de metal alcalino tal como hidróxido de sodio o hidróxido de potasio; un metal alcalino tal como sodio o potasio; un alcóxido de metal alcalino tal como metóxido de sodio, etóxido de sodio o terc-butóxido de potasio; un carbonato de metal alcalino tal como carbonato de sodio o carbonato de potasio; un hidrogenocarbonato de metal alcalino tal como hidrogenocarbonato de sodio o hidrogenocarbonato de potasio; o una base orgánica tal como trietilamina o piridina. La base se puede utilizar en una cantidad de 1 a 3 equivalentes, preferiblemente de 1 a 1,5 equivalentes, con respecto al compuesto de la fórmula (V-1),

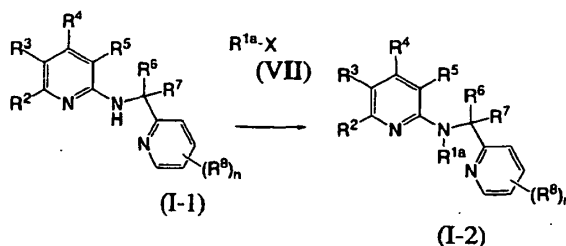
El disolvente puede ser cualquier disolvente con tal que sea inerte para la reacción, y puede ser, por ejemplo, un alcohol tal como metanol, etanol, propanol o butanol; un hidrocarburo aromático tal como benceno, tolueno o xileno; un hidrocarburo alifático tal como pentano, hexano, heptano, éter de petróleo, ligroína o benzina de petróleo; un éter tal como éter dietílico, éter dipropílico, éter dibutílico, tetrahydrofurano o dioxano; un éster tal como acetato de metilo o acetato de etilo; un nitrilo tal como acetonitrilo o propionitrilo; un amiduro de ácido tal como dimetilformamida o dimetilacetamida; un sulfóxido tal como dimetilsulfóxido; una sulfona tal como sulfolano; un amiduro de ácido fosfórico tal como hexametilisforamida; un hidrocarburo halogenado tal como cloroformo, diclorometano, tetracloruro de carbono o 1,2-dicloroetano; o una mezcla disolvente de los mismos.

En la reacción para el procedimiento de producción [2], el compuesto de la fórmula (VI) se puede utilizar en una proporción de 0,8 a 2 equivalentes con respecto a 1 mol del compuesto de la fórmula (V-1),

La reacción para el procedimiento de producción [2] se lleva a cabo usualmente a una temperatura de 0 a 100°C, preferiblemente de 0 a 50°C. El tiempo de reacción es usualmente de 0,5 a 24 horas, preferiblemente de 0,5 a 5 horas.

Se pueden combinar mutuamente de manera adecuada diversas condiciones de reacción en el procedimiento de producción [2]. Además, entre estas diferentes condiciones de reacción, existen condiciones de reacción de intervalos usuales y condiciones de reacción de intervalos preferidos, y se pueden seleccionar y combinar también mutuamente de manera adecuada.

PROCEDIMIENTO DE PRODUCCIÓN [3]



R^{1a} , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , n y X se definen como antes.

- 5 La reacción para el procedimiento de producción [3] se puede llevar a cabo en presencia de una base y un disolvente.

La base puede ser, por ejemplo, un hidruro de metal alcalino tal como hidruro de sodio o hidruro de potasio; un hidróxido de metal alcalino tal como hidróxido de sodio o hidróxido de potasio; un metal alcalino tal como sodio o potasio; un alcóxido de metal alcalino tal como metóxido de sodio, etóxido de sodio o terc-butóxido de potasio; un carbonato de metal alcalino tal como carbonato de sodio o carbonato de potasio; un hidrogenocarbonato de metal alcalino tal como hidrogenocarbonato de sodio o hidrogenocarbonato de potasio; o una base orgánica tal como trietilamina o piridina. La base se puede utilizar en una cantidad de 1 a 3 equivalentes, preferiblemente de 1 a 1,5 equivalentes, con respecto al compuesto de la fórmula (I-1),

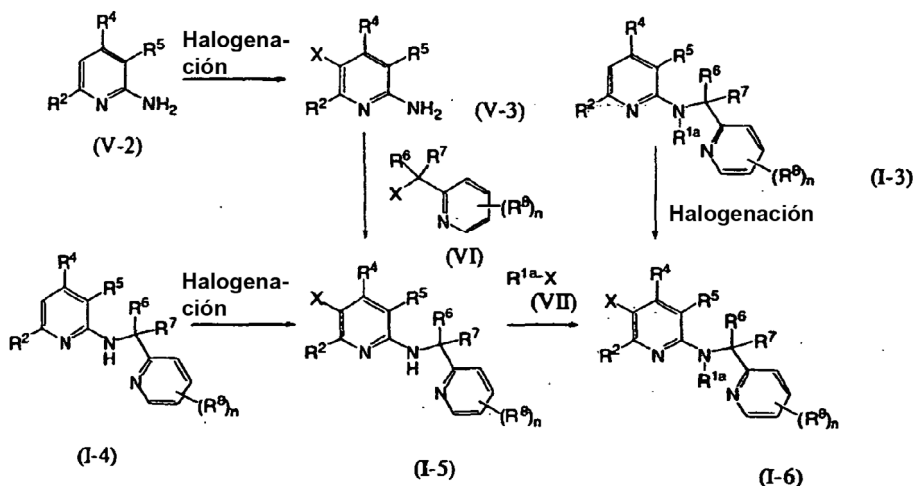
15 El disolvente puede ser cualquier disolvente con tal que sea inerte para la reacción, y puede ser, por ejemplo, un alcohol tal como metanol, etanol, propanol o butanol; un hidrocarburo aromático tal como benceno, tolueno o xileno; un hidrocarburo alifático tal como pentano, hexano, heptano, éter de petróleo, ligroína o benzina de petróleo; un éter tal como éter dietílico, éter dipropílico, éter dibutílico, tetrahydrofurano o dioxano; un éster tal como acetato de metilo o acetato de etilo; un nitrilo tal como acetonitrilo o propionitrilo; un amido de ácido tal como dimetilformamida o dimetilacetamida; un sulfóxido tal como dimetilsulfóxido; una sulfona tal como sulfolano; un amido de ácido fosfórico tal como hexametilsforamida; un hidrocarburo halogenado tal como cloroformo, diclorometano, tetracloruro de carbono o 1,2-dicloroetano; o una mezcla disolvente de los mismos.

- 25 En la reacción para el procedimiento de producción [3], el compuesto de la fórmula (VII) se puede utilizar en una proporción de 0,8 a 2 equivalentes con respecto a 1 mol del compuesto de la fórmula (I-1),

La reacción para el procedimiento de producción [3] se lleva a cabo a una temperatura de reacción usualmente de 0 a 100°C, preferiblemente de 0 a 50°C. El tiempo de reacción es usualmente de 0,5 a 24 horas, preferiblemente de 0,5 a 5 horas.

35 Se pueden combinar mutuamente de manera adecuada diversas condiciones de reacción en el procedimiento de producción [3]. Además, entre estas condiciones de reacción, existen condiciones de reacción de intervalos usuales y condiciones de reacción de intervalos preferidos, pero se pueden seleccionar y combinar también mutuamente de manera adecuada.

PROCEDIMIENTO DE PRODUCCIÓN [4]



5 R^{1a} , R^2 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , n y x se definen como antes.

La reacción de halogenación en el procedimiento de producción [4] se puede llevar a cabo en presencia de un disolvente por medio del uso de un agente halogenante.

10 El agente halogenante puede ser, por ejemplo, cloro, bromo, yodo, N-clorosuccinimida, N-bromosuccinimida o N-yodosuccinimida. El agente halogenante se puede utilizar en una cantidad de 1 a 2 equivalentes, preferiblemente de 1 a 1,5 equivalentes, con respecto a 1 mol de cada uno de los compuestos de fórmulas (V-2), (I-3) y (I-4),

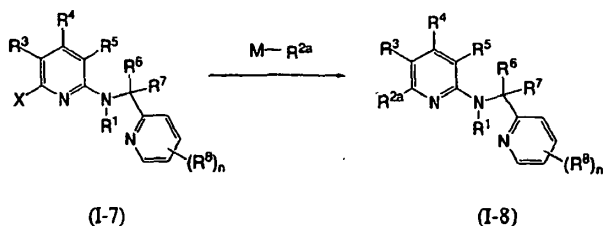
15 El disolvente puede ser cualquier disolvente con tal que sea inerte para la reacción, y puede ser, por ejemplo, un amidiuro de ácido tal como dimetilformamida o dimetilacetamida; un nitrilo tal como acetonitrilo, propionitrilo o acrilonitrilo; un hidrocarburo halogenado tal como cloroformo, diclorometano, tetracloruro de carbono o 1,2-dicloroetano; un hidrocarburo aromático tal como benceno, tolueno o xileno; un éster tal como acetato de metilo o acetato de etilo; un ácido orgánico tal como ácido acético; o una mezcla disolvente de los mismos.

20 La reacción de halogenación reacción se lleva a cabo usualmente a una temperatura de reacción de 0 a 150°C, preferiblemente de 20 a 100°C. El tiempo de reacción es usualmente de 0,5 a 24 horas, preferiblemente de 0,5 a 12 horas.

25 La reacción del compuesto de la fórmula (V-3) con el compuesto de la fórmula (VI) en el procedimiento de producción [4] se puede llevar a cabo de la misma manera que en el método del anterior procedimiento de producción [2].

30 La reacción del compuesto de la fórmula (I-5) con el compuesto de la fórmula (VII) en el procedimiento de producción [4], se puede llevar a cabo en de la misma manera que en el método del procedimiento de producción anterior [3].

PROCEDIMIENTO DE PRODUCCIÓN [5]



35 R^1 , R^3 , R^4 , R^5 , R^7 , R^8 , n y X se definen como antes; R^{2a} es alquilo que puede estar sustituido con R^8 , cicloalquilo, alqueniilo, alquiniilo, arilo o un grupo heterocíclico; y M es un grupo eliminable para generar R^{2a} , tal como cobre, boro, cinc, magnesio, litio, estaño o silicio.

La reacción para el procedimiento de producción [5] se puede llevar a cabo por medio de la utilización de un compuesto representado por la fórmula $M-R^{2a}$, en presencia de una base.

El compuesto representado por la fórmula $M-R^{2a}$ puede ser, por ejemplo, un compuesto de cobre orgánico, un compuesto de boro orgánico, un compuesto de cinc orgánico, un compuesto de magnesio orgánico, un compuesto de litio orgánico, un compuesto de estaño orgánico o un compuesto de silicio orgánico. Tal compuesto se puede utilizar en una cantidad de 1 a 3 equivalentes, preferiblemente de 1 a 1,5 equivalentes, con respecto a 1 mol del compuesto de la fórmula (1-7),

La base puede ser, por ejemplo, un hidruro de metal alcalino tal como hidruro de sodio o hidruro de potasio; un hidróxido de metal alcalino tal como hidróxido de sodio o hidróxido de potasio; un alcóxido de metal alcalino tal como metóxido de sodio, etóxido de sodio o terc-butóxido de potasio; un carbonato de metal alcalino tal como carbonato de sodio, carbonato de potasio; un hidrogenocarbonato de metal alcalino tal como hidrogenocarbonato de sodio o hidrogenocarbonato de potasio; o una base orgánica tal como trietilamina o piridina.

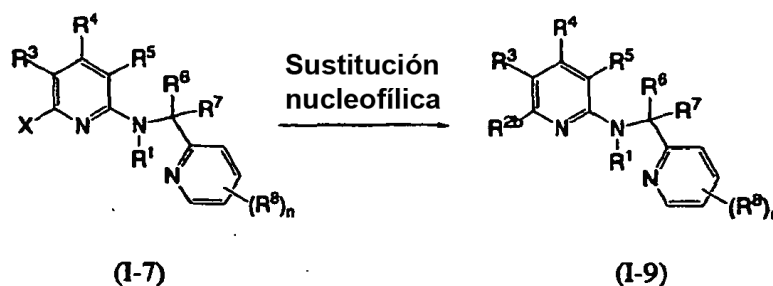
Para la reacción para el procedimiento de producción [5], con el fin de llevar a cabo la reacción eficazmente, es posible emplear un catalizador tal como un compuesto de paladio o un compuesto de níquel, según requiera el caso.

La reacción para el procedimiento de producción [5] se puede llevar a cabo en presencia de un disolvente, según requiera el caso. El disolvente puede ser cualquier disolvente con tal que sea inerte para la reacción, y puede ser, por ejemplo, un alcohol tal como metanol, etanol, propanol o butanol; una cetona tal como acetona, metil etil cetona, dimetil cetona, dietil cetona o metil isobutil cetona; un hidrocarburo aromático tal como benceno, tolueno o xileno; un hidrocarburo alifático tal como pentano, hexano, heptano, éter de petróleo, ligroína o benzina de petróleo; un éter tal como éter dietílico, éter dipropílico, éter dibutílico, tetrahydrofurano o dioxano; un éster tal como acetato de metilo o acetato de etilo; un nitrilo tal como acetonitrilo o propionitrilo; un amido de ácido tal como dimetilformamida o dimetilacetamida; un sulfóxido tal como dimetilsulfóxido; una sulfona tal como sulfolano; un amido de ácido fosfórico tal como hexametilsforamida; un hidrocarburo halogenado tal como cloroformo, diclorometano, tetracloruro de carbono o 1,2-dicloroetano; agua; o una mezcla disolvente de los mismos.

La reacción para el procedimiento de producción [5] se lleva a cabo a una temperatura de reacción usualmente de 0 a 200°C, preferiblemente de 20 a 120°C. El tiempo de reacción es usualmente de 0,5 a 24 horas.

Se pueden combinar mutuamente de manera adecuada diversas condiciones de reacción en el procedimiento de producción [5]. Además, entre tales diversas condiciones de reacción, existen condiciones de reacción de intervalos usuales y condiciones de reacción de intervalos preferidos, pero se pueden seleccionar y combinar también mutuamente de manera adecuada.

PROCEDIMIENTO DE PRODUCCIÓN [6]



R^1 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , n y X se definen como antes, y R^{2b} es NR^aR^c , OR^a o SR^a .

La reacción de sustitución nucleofílica para el procedimiento de producción [6] se puede llevar a cabo en presencia de un disolvente por medio del uso de reactivo nucleofílico.

El reactivo nucleofílico puede ser, por ejemplo, un alcóxido de metal alcalino tal como metóxido de sodio o etóxido de sodio; un mercapturo de metal alcalino tal como metilmercaptano sódico; o una amina primaria o secundaria tal como metilamina, dimetilamina o piperidina. Tal reactivo nucleofílico se puede utilizar en una cantidad de 1 a 5 equivalentes, preferiblemente de 1 a 3 equivalentes, con respecto a 1 mol del compuesto de la fórmula (1-7),

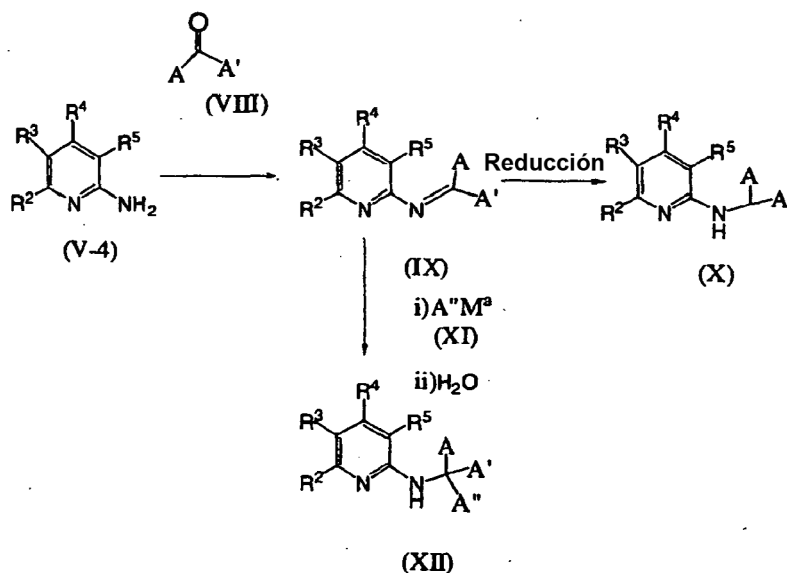
El disolvente puede ser cualquier disolvente con tal que sea inerte para la reacción, y puede ser, por ejemplo, un alcohol tal como metanol, etanol, propanol o butanol; una cetona tal como acetona, metil etil cetona, dimetilcetona, dietilcetona o metil isobutil cetona; un hidrocarburo aromático tal como benceno, tolueno o xileno; un hidrocarburo

alifático tal como pentano, hexano, heptano, éter de petróleo, ligroína o benzina de petróleo; un éter tal como éter dietílico, éter dipropílico, éter dibutílico, tetrahidrofurano o dioxano; un éster tal como acetato de metilo o acetato de etilo; un nitrilo tal como acetonitrilo o propionitrilo; un amiduro de ácido tal como dimetilformamida o dimetilacetamida; un sulfóxido tal como dimetilsulfóxido; una sulfona tal como sulfolano; un amiduro de ácido fosfórico tal como hexametilsforamida; un hidrocarburo halogenado tal como cloroformo, diclorometano, tetracloruro de carbono o 1,2-dicloroetano; agua; o una mezcla disolvente de los mismos.

La reacción de sustitución nucleofílica para el procedimiento de producción [6] se lleva a cabo a una temperatura de reacción usualmente de 0 a 200°C, preferiblemente de 0 a 100°C. El tiempo de reacción es usualmente de 0,5 a 24 horas.

Se pueden combinar mutuamente de manera adecuada diversas condiciones de reacción en el procedimiento de producción [6]. Además, entre tales diversas condiciones de reacción, existen las condiciones de reacción de intervalos usuales y las condiciones de reacción de intervalos preferidos, pero se pueden seleccionar y combinar también mutuamente de manera adecuada.

PROCEDIMIENTO DE PRODUCCIÓN [7]



Cada uno de A y A' que son independientes entre sí, es hidrógeno, ciano, alquilo, haloalquilo, cicloalquilo, arilo o un grupo heterocíclico que puede estar sustituido con R⁸; A'' es alquilo, alqueniilo, haloalquilo, cicloalquilo o ciano; M^a es un haluro de magnesio, un metal o un grupo eliminable para generar CN⁻; y R², R³, R⁴, R⁵ y R⁸ se definen como antes.

El compuesto de la fórmula (IX) se puede producir sometiendo el compuesto de la fórmula (V-4) y el compuesto de la fórmula (VIII) a una reacción de condensación en un disolvente.

El disolvente puede ser cualquier disolvente con tal que sea inerte para la reacción, y puede ser, por ejemplo, un alcohol tal como metanol, etanol, propanol o butanol; un hidrocarburo aromático tal como benceno, tolueno o xileno; un hidrocarburo alifático tal como pentano, hexano, heptano, éter de petróleo, ligroína o benzina de petróleo; un éter tal como éter dietílico, éter dipropílico, éter dibutílico, tetrahidrofurano o dioxano; un éster tal como acetato de etilo o acetato de metilo; un amiduro de ácido tal como dimetilformamida o dimetilacetamida; un sulfóxido tal como dimetilsulfóxido; una sulfona tal como sulfolano; un amiduro de ácido fosfórico tal como hexametilsforamida; un hidrocarburo halogenado tal como cloroformo, diclorometano, tetracloruro de carbono o 1,2-dicloroetano; o una mezcla disolvente de los mismos.

Con el fin de llevar a cabo la reacción de condensación anterior eficazmente, se puede utilizar un catalizador ácido según requiera el caso. El catalizador ácido puede ser, por ejemplo, un ácido inorgánico tal como ácido clorhídrico o ácido sulfúrico; o un ácido orgánico tal como ácido acético, ácido canforsulfónico, ácido p-toluenosulfónico o p-toluenosulfonato de piridinio.

En la reacción de condensación, el compuesto de la fórmula (VIII) se puede utilizar en una proporción de 1 a 2 equivalentes, preferiblemente de 1,2 a 1,5 equivalentes, con respecto a 1 mol del compuesto de la fórmula (V-4),

La reacción de condensación se lleva a cabo a una temperatura de reacción usualmente de 0 a 150°C, preferiblemente de 50 a 100°C. El tiempo de reacción es usualmente de 5 a 100 horas.

5 Para la reacción de condensación se pueden combinar mutuamente de manera adecuada diversas condiciones. Además, entre tales diversas condiciones de reacción, existen condiciones de reacción de intervalos usuales y condiciones de reacción de intervalos preferidos, pero se pueden seleccionar y combinar también mutuamente de manera adecuada.

10 El compuesto de la fórmula (X) se puede producir haciendo reaccionar un compuesto de la fórmula (IX) con un agente reductor en un disolvente.

15 El agente reductor puede ser, por ejemplo, un hidruro metálico tal como hidruro de litio y aluminio, borohidruro de sodio, cianoborohidruro de sodio; o un hidrosilano tal como trietilsilano o triclorosilano. Además, también es posible seleccionar un método para emplear formiato de amonio como agente reductor en una reducción catalítica o una reacción de Leuckart-Wallach.

20 El disolvente puede ser cualquier disolvente con tal que sea inerte para la reacción, y puede ser, por ejemplo, un alcohol tal como metanol, etanol, propanol o butanol; un hidrocarburo aromático tal como benceno, tolueno o xileno; un hidrocarburo alifático tal como pentano, hexano, heptano, éter de petróleo, ligroína o benzina de petróleo; un éter tal como éter dietílico, éter dipropílico, éter dibutílico, tetrahidrofurano o dioxano; un amido de ácido tal como dimetilformamida o dimetilacetamida; un sulfóxido tal como dimetilsulfóxido; una sulfona tal como sulfolano; un amido de ácido fosfórico tal como hexametilfosforamida; un éster tal como acetato de etilo o acetato de metilo; un hidrocarburo halogenado tal como cloroformo, diclorometano, tetracloruro de carbono o 1,2-dicloroetano; o una mezcla disolvente de los mismos.

25 La reacción de reducción anterior se lleva a cabo usualmente a una temperatura de reacción de 0 a 100°C, preferiblemente de 0 a 40°C. El tiempo de reacción es usualmente de 1 a 40 horas.

30 Para la reacción de reducción se pueden combinar mutuamente de manera adecuada diversas condiciones. Además, entre tales diversas condiciones de reacción, existen condiciones de reacción de intervalos usuales y condiciones de reacción de intervalos preferidos, y se pueden seleccionar y combinar también mutuamente de manera adecuada.

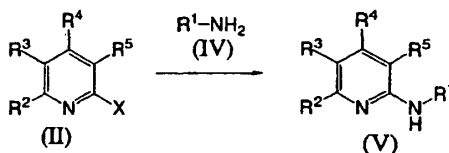
35 El compuesto de la fórmula (XII) se puede producir haciendo reaccionar el compuesto de la fórmula (IX) con el compuesto de la fórmula (XI) en un disolvente, seguido de hidrólisis por medio de un método usual.

40 El compuesto de la fórmula (XI) puede ser, por ejemplo, cuando A" es alquilo, alqueno, haloalquilo o cicloalquilo, un reactivo de Grignard, tal como un haluro de alquilmagnesio tal como bromuro de metilmagnesio o cloruro de isopropilmagnesio, un haluro de alqueniilmagnesio tal como bromuro de alilmagnesio, un haluro de haloalquilmagnesio tal como bromuro de trifluorometilmagnesio, o un haluro de cicloalquilmagnesio tal como bromuro de ciclopropilmagnesio; un alquil litio tal como metil litio o butil litio; un alquilmagnesio o dialquilmagnesio tal como metilmagnesio, etilmagnesio o dietilmagnesio. Además, cuando A" es ciano, se puede mencionar, por ejemplo, un compuesto cianuro tal como cianuro de hidrógeno, cianuro de trimetilsililo o cianuro de tributilestano. El compuesto de la fórmula (XI) se puede utilizar en una proporción usualmente de 1 a 4 equivalentes, preferiblemente de 1,2 a 1,5 equivalentes, con respecto a 1 mol del compuesto de la fórmula (IX),

50 El disolvente puede ser cualquier disolvente con tal que sea inerte para la reacción, y puede ser, por ejemplo, un alcohol tal como metanol, etanol, propanol o butanol; un hidrocarburo aromático tal como benceno, tolueno o xileno; un hidrocarburo alifático tal como pentano, hexano, heptano, éter de petróleo, ligroína o benzina de petróleo; un éter tal como éter dietílico, éter dipropílico, éter dibutílico, tetrahidrofurano o dioxano; un amido de ácido fosfórico tal como hexametilfosforamida; un hidrocarburo halogenado tal como cloroformo, diclorometano, tetracloruro de carbono o 1,2-dicloroetano; y una mezcla disolvente de los mismos.

55 Esta reacción se lleva a cabo usualmente a una temperatura de reacción de 0 a 100°C, preferiblemente de 0 a 40°C. El tiempo de reacción es usualmente de 1 a 50 horas.

PROCEDIMIENTO DE PRODUCCIÓN [8]



60

R^1 , R^2 , R^3 , R^4 , R^5 y X se definen como antes.

La reacción para el procedimiento de producción [8] se puede llevar a cabo en presencia de un disolvente.

El disolvente puede ser, por ejemplo, un alcohol tal como metanol, etanol, propanol o butanol; un hidrocarburo aromático tal como benceno, tolueno o xileno; un hidrocarburo alifático tal como pentano, hexano, heptano, éter de petróleo, ligroína o benzina de petróleo; un éter tal como éter dietílico, éter dipropílico, éter dibutílico, tetrahidrofurano o dioxano; un éster tal como acetato de metilo o acetato de etilo; un nitrilo tal como acetonitrilo o propionitrilo; un amiduro de ácido tal como dimetilformamida o dimetilacetamida; un sulfóxido tal como dimetilsulfóxido; una sulfona tal como sulfolano; un amiduro de ácido fosfórico tal como hexametilfosforamida; un hidrocarburo halogenado tal como cloroformo, diclorometano, tetracloruro de carbono o 1,2-dicloroetano; o una mezcla disolvente de los mismos.

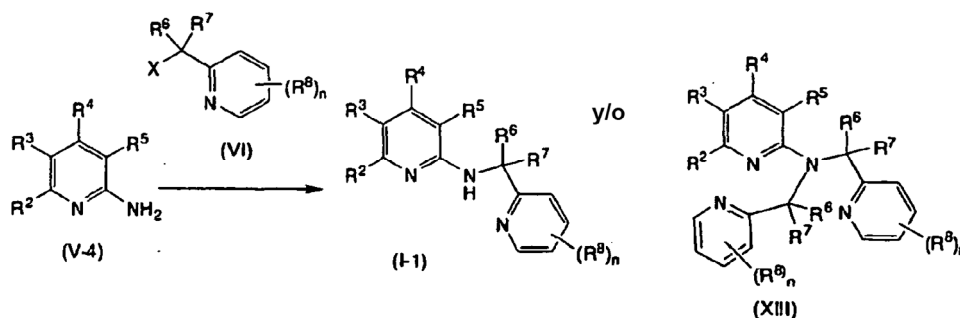
En la reacción para el procedimiento de producción [8], con el fin de llevar a cabo la reacción eficazmente, la reacción se puede llevar a cabo en presencia de una base, según requiera el caso. Tal base puede ser, por ejemplo, una base orgánica tal como trietilamina o piridina, un hidróxido de metal alcalino tal como hidróxido de sodio o hidróxido de potasio; un carbonato de metal alcalino tal como carbonato de litio, carbonato de sodio o carbonato de potasio; un hidrogenocarbonato de metal alcalino tal como hidrogenocarbonato de litio, hidrogenocarbonato de sodio, o hidrogenocarbonato de potasio; un hidruro de metal alcalino tal como hidruro de litio, hidruro de sodio o hidruro de potasio; o un alcóxido de metal alcalino tal como metóxido de sodio, etóxido de sodio o terc-butóxido de potasio.

En la reacción para el procedimiento de producción [8], el compuesto de la fórmula (IV) se puede utilizar en una proporción de 0,8 a 5 equivalentes, preferiblemente de 1 a 2,5 equivalentes con respecto a 1 mol del compuesto de la anterior fórmula (II),

La reacción para el procedimiento de producción [8] se lleva a cabo usualmente a una temperatura de reacción de 0 a 150°C, preferiblemente de 0 a 100°C. El tiempo de reacción es usualmente de 0,5 a 100 horas.

Se pueden combinar mutuamente de manera adecuada diversas condiciones de reacción en el procedimiento de producción [8]. Además, entre tales condiciones de reacción, existen condiciones de reacción de intervalos usuales y condiciones de reacción de intervalos preferidos, y se pueden seleccionar y combinar también mutuamente de manera adecuada.

PROCEDIMIENTO DE PRODUCCIÓN [9]



R^2 , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 , R^7 , R^8 , n y X se definen como antes.

La reacción para el procedimiento de producción [9] se puede llevar a cabo en presencia de una base y un disolvente.

La base puede ser, por ejemplo, un hidruro de metal alcalino tal como hidruro de sodio o hidruro de potasio; un hidróxido de metal alcalino tal como hidróxido de sodio o hidróxido de potasio; un metal alcalino tal como sodio o potasio; un alcóxido de metal alcalino tal como metóxido de sodio, etóxido de sodio o terc-butóxido de potasio; un carbonato de metal alcalino tal como carbonato de sodio o carbonato de potasio; un hidrogenocarbonato de metal alcalino tal como hidrogenocarbonato de sodio o hidrogenocarbonato de potasio; o una base orgánica tal como trietilamina o piridina. La base se puede utilizar en una cantidad de 1 a 3 equivalentes con respecto a 1 mol del compuesto de la fórmula (V-4). Con el fin de obtener el compuesto de la fórmula (I-1), la base se utiliza preferiblemente en una cantidad de 1 a 1,5 equivalentes, y con el fin de obtener el compuesto de la fórmula (XIII), la base se utiliza preferiblemente en una cantidad de 2 a 2,5 equivalentes.

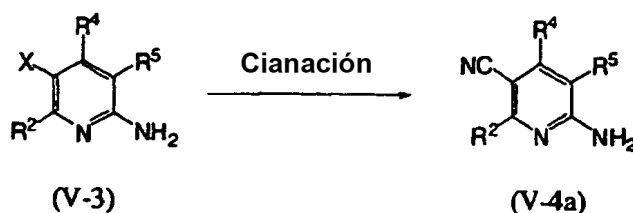
El disolvente puede ser cualquier disolvente con tal que sea inerte para la reacción, y puede ser, por ejemplo, un alcohol tal como metanol, etanol, propanol o butanol; un hidrocarburo aromático tal como benceno, tolueno o xileno; un hidrocarburo alifático tal como pentano, hexano, heptano, éter de petróleo, ligroína o benzina de petróleo, un éter tal como éter dietílico, éter dipropílico, éter dibutílico, tetrahidrofurano o dioxano; un éster tal como acetato de metilo o acetato de etilo; un nitrilo tal como acetonitrilo o propionitrilo; un amiduro de ácido tal como dimetilformamida o dimetilacetamida; un sulfóxido tal como dimetilsulfóxido; una sulfona tal como sulfolano; un amiduro de ácido fosfórico tal como hexametilfosforamida; un hidrocarburo halogenado tal como cloroformo, diclorometano, tetracloruro de carbono o 1,2-dicloroetano; o una mezcla disolvente de los mismos.

En la reacción para el procedimiento de producción [9], el compuesto de la fórmula (VI) se puede utilizar en una proporción de 0,8 a 2,5 equivalentes con respecto a 1 mol del compuesto de la anterior fórmula (V-4). Con el fin de obtener el compuesto de la fórmula (I-1), el compuesto de la fórmula (VI) se utiliza preferiblemente en una cantidad de 0,8 a 1,5 equivalentes, y con el fin de obtener el compuesto de la fórmula (XIII), el compuesto de la fórmula (VI) se utiliza preferiblemente en una cantidad de 2 a 2,5 equivalentes.

La reacción para el procedimiento de producción [9] se lleva a cabo usualmente a una temperatura de reacción de 0 a 100°C, preferiblemente de 0 a 50°C. El tiempo de reacción es usualmente de 0,5 a 24 horas.

Se pueden combinar mutuamente de manera adecuada diversas condiciones de reacción en el procedimiento de producción [9]. Además, entre tales diversas condiciones de reacción, existen condiciones de reacción de intervalos usuales y condiciones de reacción de intervalos preferidos, y se pueden seleccionar y combinar también mutuamente de manera adecuada.

PROCEDIMIENTO DE PRODUCCIÓN [10]



R², R⁴, R⁵ y X se definen como antes.

La reacción para el procedimiento de producción [10] se puede llevar a cabo por medio del uso de un agente de cianación en presencia de un disolvente.

El agente de cianación puede ser, por ejemplo, cianuro de cobre, cianuro de cinc, cianuro de sodio, cianuro de trimetilsililo o cianuro de tributilestaño, pero se prefiere el cianuro de cobre.

El disolvente puede ser, por ejemplo, un alcohol tal como metanol, etanol, propanol o butanol; un hidrocarburo aromático tal como benceno, tolueno o xileno; un hidrocarburo alifático tal como pentano, hexano, heptano, éter de petróleo, ligroína o benzina de petróleo, un éter tal como éter dietílico, éter dipropílico, éter dibutílico, tetrahidrofurano o dioxano; un éster tal como acetato de metilo o acetato de etilo; un nitrilo tal como acetonitrilo o propionitrilo; un amiduro de ácido tal como dimetilformamida o dimetilacetamida; un sulfóxido tal como dimetilsulfóxido; una sulfona tal como sulfolano; un amiduro de ácido fosfórico tal como hexametilfosforamida; un hidrocarburo halogenado tal como cloroformo, diclorometano, tetracloruro de carbono o 1,2-dicloroetano; o una mezcla disolvente de los mismos.

En la reacción para el procedimiento de producción [10], el agente de cianación se puede utilizar en una proporción de 0,8 a 5 equivalentes, preferiblemente de 1 a 2,5 equivalentes, con respecto a 1 mol del compuesto de la anterior fórmula (V-3).

La reacción para el procedimiento de producción [10] se lleva a cabo usualmente a una temperatura de reacción de 80 a 200°C, preferiblemente de 100 a 150°C. El tiempo de reacción es usualmente de 1 a 24 horas.

Se pueden combinar mutuamente de manera adecuada diversas condiciones de reacción en el procedimiento de producción [10]. Además, entre tales diversas condiciones de reacción, existen condiciones de reacción de intervalos usuales y condiciones de reacción de intervalos preferidos, y se pueden seleccionar y combinar también mutuamente de manera adecuada.

Las realizaciones preferidas de los plaguicidas que contienen los compuestos de la presente invención (que significan más adelante en esta memoria todos los compuestos representados por la fórmula (1) a no ser que se

especifique lo contrario) se describirán más abajo. Los plaguicidas que contienen los compuestos de la presente invención son particularmente útiles, por ejemplo, como agentes para controlar diversas plagas que se convierten en problemáticas en los campos agrícolas y hortícolas, es decir plaguicidas agrícolas y hortícolas, o como agentes para controlar plagas que son parásitas en animales, es decir plaguicidas contra parásitos en animales.

5 Los plaguicidas agrícolas y hortícolas que contienen los compuestos de la presente invención son útiles como insecticida, miticida, nematocida o plaguicida para el suelo, y son eficaces para controlar ácaros parásitos de plantas tales como la araña roja (Tetranychus urticae), la araña roja carmín (Tetranychus cinnabarinus), la araña roja del té (Tetranychus kanzawai), la araña roja de los cítricos (Panonychus citri), la araña roja europea (Panonychus ulmi), la araña blanca (Poliphagotarsonemus latus), el ácaro tostado del cítrico rosado (Aculops pelekassi) y el ácaro de los bulbos (Rhizoglyphus echinopus); áfidos tales como el pulgón verde del melocotonero (Myzus persicae) y el pulgón del algodón (Aphis gossypii); plagas de insectos agrícolas tales como la polilla dorso de diamante (Plutella xilostella), la polilla de la col (Mamestra brassicae), el gusano gris del tabaco (Spodoptera litura), el gusano de la pera y la manzana (Laspeyresia pomonella), el gusano del maíz (Heliotis zea), el gusano del cogollo del tabaco (Heliotis virescens), la lagarta peluda (Lymantria dispar), el enrollahojas del arroz (Cnaphalocrocis medinalis), Adoxophyes sp., el escarabajo de la patata de Colorado (Leptinotarsa decemlineata), el escarabajo de la hoja de las cucurbitáceas (Aulacophora femoralis), el picudo del algodón (Anthonomus grandis), saltadores de plantas, saltadores de hojas, cochinillas, chinches, moscas blancas, trips, saltamontes, moscas de antómidos, escarabajos, la rosquilla negra (Agrotis ipsilon), gusano cortador (Agrotis segetum) y hormigas; nematodos parásitos de plantas tales como nematodos agalladores, nematodos de los quistes, nematodos de la lesión de la raíz, el nematodo de la punta blanca del arroz (Aphelenchoides besseyi), el nematodo de los brotes de las fresas (Nothotilenchus acris), el nematodo de la madera de pino (Bursaphelenchus lignicolus); gasterópodos tales como babosas y caracoles; plagas del suelo tales como isópodos tales como cochinillas (Armadilidium vulgare) y cochinillas (Porcellio scaber); plagas de insectos higiénicas tales como el ácaro tropical de los ratones (Ornithonyssus bacoti), cucarachas, mosca común (Musca domestica) y mosquito común (Culex pipiens); plagas de insectos de los granos almacenados como la polilla de los cereales (Sitotroga cerealella), el gorgojo de la judía adzuki (Callosobruchus chinensis), el escarabajo rojo de la harina (Tribolium castaneum) y gusanos de la harina; plagas de insectos de los enseres domésticos tales como la polilla de la ropa (Tinea pellionella), el escarabajo negro de las alfombras (Anthrenusscrophularidae) y las termitas subterráneas; ácaros domésticos tales como el ácaro del moho (Tyrophagus putrescentiae), Dermatophagoides farinae, Chelacaropsis moorei, etcétera. Entre ellos, los plaguicidas agrícolas y hortícolas que contienen los compuestos de la presente invención son particularmente eficaces para controlar los ácaros parásitos de plantas, las plagas de insectos agrícolas, los nematodos parásitos de plantas o similares. Además, son eficaces contra plagas de insectos que han adquirido resistencia a insecticidas organofosforados, de carbamato y/o piretroides sintéticos. Por otra parte, los compuestos de la presente invención tienen propiedades sistémicas excelentes, y por medio de la aplicación de los plaguicidas agrícolas y hortícolas que contienen los compuestos de la presente invención al tratamiento del suelo, no solo se pueden controlar los insectos nocivos, los ácaros nocivos, los nematodos nocivos, los gasterópodos nocivos y los isópodos nocivos en el suelo sino también las plagas del follaje.

40 Otras realizaciones preferidas de los plaguicidas que contienen compuestos de la presente invención pueden ser plaguicidas agrícolas y hortícolas que controlan colectivamente los ácaros parásitos de plantas, las plagas de insectos agrícolas, los nematodos parásitos de plantas, los gasterópodos y las plagas del suelo anteriormente mencionadas.

45 El plaguicida agrícola y hortícola que contiene el compuesto de la presente invención, se formula usualmente mezclando el compuesto con diversos coadyuvantes agrícolas y se utiliza en forma de una formulación tal como un espolvoreable, gránulos, gránulos dispersables en agua, un polvo mojable, un concentrado en suspensión con una base acuosa, un concentrado en suspensión con una base oleosa, gránulos solubles en agua, un concentrado emulsionable, un concentrado soluble, una pasta, un aerosol o una formulación de volumen ultra-bajo. Sin embargo, con tal que sea adecuado para el fin de la presente invención, se puede formular en cualquier tipo de formulación que se utiliza comúnmente en este campo. Tales coadyuvantes agrícolas incluyen portadores sólidos tales como tierra de diatomeas, cal apagada, carbonato de calcio, talco, hulla blanca, caolín, bentonita, una mezcla de caolinita y sericita, arcilla, carbonato de sodio, bicarbonato de sodio, mirabilita, zeolita y almidón; disolventes tales como agua, tolueno, xileno, nafta disolvente, dioxano, acetona, isoforona, metil isobutil cetona, clorobenceno, ciclohexano, dimetilsulfóxido, N,N-dimetilformamida, dimetilacetamida, N-metil-2-pirrolidona, y alcohol; tensioactivos aniónicos y propagadores tales como una sal de ácido graso, un benzoato, un alquilsulfosuccinato, un dialquilsulfosuccinato, un policarboxilato, una sal de éster de ácido alquilsulfúrico, un alquilsulfato, un alquilarilsulfato, un alquildiglicoletersulfato, una sal de éster de alcohol y ácido sulfúrico, un alquilsulfonato, un alquilarilsulfonato, un arilsulfonato, un lignosulfonato, un alquildifenileterdisulfonato, un poliestirensulfonato, una sal de éster de ácido alquilsulfúrico, un alquilarilsulfato, un estirilarilsulfato, una sal de éster de ácido polioxietilenaalquilarilsulfúrico, un polioxietilenaalquilarilsulfato, una sal de éster de ácido polioxietilenaalquilarilsulfúrico, un polioxietilenaalquilarilsulfato, una sal de éster de ácido polioxietilenaalquilarilsulfúrico, y una sal de un producto condensado de naftalenosulfonato con formalina; tensioactivos no iónicos y propagadores tales como un éster de ácido graso y sorbitán, un éster de ácido graso y glicerina, un poliglicérido de ácido graso, un éter de poliglicol de alcohol de ácido graso, acetilenglicol, alcohol acetilénico, un polímero de bloques de oxialquileno, un polioxietileno alquil éter, un polioxietileno alquilaril éter, un polioxietileno estirilalil éter, un polioxietilenglicol alquil éter, un

5 polietilenglicol, un éster de ácido graso y polioxietileno, un éster de ácido graso y polioxietilensorbitán, un éster de ácido graso y polioxietilenglicerina, un aceite de ricino hidrogenado polioxietilenado, y un éster de ácido graso polioxipropilenado; aceites vegetales y minerales tales como aceite de oliva, aceite de kapok, aceite de ricino, aceite de palma, aceite de camelia, aceite de coco, aceite de sésamo, aceite de maíz, aceite de salvado de arroz, aceite de cacahuete, aceite de semilla de algodón, aceite de soja, aceite de colza, aceite de linaza, aceite de tung, y parafinas líquidas; etcétera. Cada uno de los componentes como tales coadyuvantes pueden ser uno o más seleccionados adecuadamente para su uso, con tal que se pueda completar de ese modo el propósito de la presente invención. Además, también se pueden emplear diversos coadyuvantes se utilizan comúnmente, tales como una carga, un espesante, un agente anti-sedimentación, un agente anti-congelante, un estabilizador de la dispersión, un agente reductor de la fitotoxicidad, un agente anti-moho, etcétera.

La razón en peso del compuesto de la presente invención con respecto a los diversos coadyuvantes agrícolas es usualmente de 0,001:99,999 a 95:5, preferiblemente de 0,005:99,995 a 90:10.

15 En la aplicación real de tal formulación, ésta se puede utilizar tal cual, o se puede diluir hasta una concentración predeterminada con un diluyente tal como agua, y se pueden añadir a ésta diversos propagadores p. ej. tensioactivos, aceites vegetales o aceites minerales, según requiera el caso.

20 La aplicación del plaguicida agrícola y hortícola que contiene el compuesto de la presente invención no se puede definir generalmente, puesto que ésta varía dependiendo de las condiciones meteorológicas, el tipo de formulación, la estación de aplicación, el sitio de aplicación o los tipos o el grado de irrupción de los insectos de la plaga. Sin embargo, se aplica usualmente a una concentración del ingrediente activo de 0,05 a 800.000 ppm, preferiblemente de 0,5 a 500.000 ppm, y la dosis por área unitaria es tal que el compuesto de la presente invención es de 0,05 a 50.000 g, preferiblemente de 1 a 30.000 g, por hectárea. Además, los plaguicidas agrícolas y hortícolas como otra realización preferida de los plaguicidas que contienen los compuestos de la presente invención se pueden aplicar de acuerdo con la aplicación de plaguicidas anteriormente descrita. La presente invención incluye tal uso agrícola u hortícola de una cantidad eficaz de la piridil-metamina de la presente invención para controlar plagas, particularmente para controlar ácaros parásitos de plantas, plagas de insectos agrícolas o nematodos parásitos de plantas.

30 Diversas formulaciones de plaguicidas agrícolas y hortícolas que contienen los compuestos de la presente invención o sus composiciones diluidas se pueden aplicar por medio de métodos convencionales de aplicación que son empleados comúnmente, tales como pulverización (p. ej. pulverización, eyección, nebulización, atomización, diseminación o dispersión en agua de polvo o grano), aplicación al suelo (p. ej. mezcla o remojo), aplicación superficial (p. ej. revestimiento, empolvamiento o recubrimiento) o impregnación para obtener alimento venenoso. Además, es posible alimentar animales domésticos con un alimento que contenga el ingrediente activo anterior y controlar la irrupción o el crecimiento de las plagas, particularmente de las plagas de insectos, con sus excrementos. Además, el ingrediente activo se puede aplicar también por medio del denominado método de aplicación de volumen ultra-bajo. En este método, la composición puede estar compuesta por 100% de ingrediente activo.

40 Además, los plaguicidas agrícolas y hortícolas que contienen compuestos de la presente invención se pueden mezclar con o se pueden utilizar combinados con otros productos químicos agrícolas, fertilizantes o agentes reductores de la fitotoxicidad, con lo que a veces se pueden obtener efectos o actividad sinérgicas. Tales otros productos químicos agrícolas incluyen, por ejemplo, un herbicida, un insecticida, un miticida, un nematocida, un plaguicida para el suelo, un fungicida, un agente antiviral, un atrayente, un antibiótico, una hormona vegetal, un agente regulador del crecimiento vegetal, etcétera. Especialmente, con un plaguicida mixto que tiene un compuesto de la presente invención mezclado con o utilizado combinado con uno o más compuestos activos de otros productos químicos agrícolas, el intervalo de aplicación, el tiempo de aplicación, las actividades plaguicidas, etc. se puede mejorar en las direcciones preferidas. El compuesto de la presente invención y los compuestos activos de los otros productos químicos agrícolas se pueden formular separadamente de manera que se puedan mezclar para su uso en el momento de la aplicación, o se pueden formular juntos. La presente invención incluye tal composición plaguicida mixta.

55 La razón de mezcla del compuesto de la presente invención con respecto a los compuestos activos de los otros productos químicos agrícolas no se puede definir generalmente, puesto que varía dependiendo de las condiciones meteorológicas, los tipos de formulaciones, el tiempo de aplicación, el sitio de aplicación, los tipos o el grado de irrupción de las plagas de insectos, etc., pero se encuentra usualmente en un intervalo de 1:300 a 300:1, preferiblemente de 1:100 a 100:1, en peso. Además, la dosis para la aplicación es tal que la cantidad total de los compuestos activos es de 0,1 a 50.000 g, preferiblemente de 1 a 30.000 g, por hectárea. La presente invención incluye un uso agrícola u hortícola de una cantidad eficaz de la piridil-metamina de la presente invención para controlar plagas por medio de una aplicación de tal composición plaguicida mixta.

65 Los compuestos activos de los agentes para el control de la plaga de insectos tales como insecticidas, miticidas, nematocidas o plaguicidas para el suelo en los otros productos químicos agrícolas anteriormente mencionados, incluyen, por ejemplo, (por medio de sus nombres comunes, algunos de los cuales están todavía en una fase de aplicación) compuestos de fosfato orgánicos tales como profenofos, diclorvos, fenamifos, fenitrotión, EPN, diazinon, clorpirifos-metilo, acephato, protiofos, fostiazato, fosfocarb, cadusafos, dislufotón, clorpirifos, demetón-S-metilo,

dimetoato, metamidofos, imiciafos, isoxatión, isofenfos, etión, etrimfos, quinalfos, dimetilvinfos, sulprofos, tiometón, vamidotión, piraclufos, piridafentión, pirimifos-metilo, propafos, fosadona, formotión, malatión, tetraclovinfos, clorfenvinfos, cianofos, triclorfón, metidatión, fentoato, ESP, azinfos-metilo, fentión, heptenofos, metoxiclor, paratión, monocrotfos, paratión-metilo, terbufos, fospamidón, fosmet y forato; compuestos carbamato tales como carbarilo, propoxur, aldicarb, carbofurano, tiodicarb, metomilo, oxamilo, etiofencarb, pirimicarb, fenobucarb, carbosulfán, benfuracarb, bendiocarb, furatiocarb, isoprocarb, metolcarb, xililcarb, XMC y fenotiocarb; derivados de nereistoxinas tales como cartap, tiociclam, bensultap y tiosultap-sódico; compuestos de cloro orgánicos tales como dicofol, tetradifón, endosulfán, dienoclor y dieldrina; compuestos metálicos orgánicos tales como Óxido de fenbutatina y cihexatina; compuestos piretroides tales como fenvalerato, permetrina, cipermetrina, deltametrina, cihalotrina, teflutrina, etofenprox, fenpropatrina, bifentrina, ciflutrina, flucitrinato, fluvalinato, cicloprotrina, lambda-cihalotrina, piretrinas, esfenvalerato, tetrametrina, resmetrina, protrifenbute, zeta-cipermetrina, acrinatrina, alpha-cipermetrina, aletrina, gamma-cihalotrina, teta-cipermetrina, taufluvalinato, tralometrina, proflutrina, betacipermetrina, beta-ciflutrina y metoflutrina; compuestos de benzourea tales como diflubenzurón, clorfluazurón, teflubenzurón, flufenoxurón, lufenurón, novalurón, hexaflumurón, noviflumurón, bistrifluron y fluazuron; compuestos de tipo hormona juvenil tales como metopreno, piriproxifeno, fenoxicarb y diofenolan; compuestos de piridazinona tales como piridabeno; compuestos pirazol tales como fenpiroximato, fipronil, tebufenpirad, etiprol, tolfenpirad, acetoprol, pirafiprol y piriprol; neonicotinoides tales como imidacloprid, nitenpiram, acetamiprid, tiacloprid, tiametoxam, clotianidin, dinotefurano y nitiagina; compuestos de hidrazina tales como tebufenozida, metoxifenozida, cromafenozida y halofenozida; otros compuestos tales como flonicamid, buprofezin, hexitiazox, amitraz, clordimeform, silafluofeno, triazamato, pimetrozina, pirimidifeno, clorfenapir, indoxacarb, acequinocilo, etoxazol, ciromazina, 1,3-dicloropropeno, diafenthiurón, benclotiaz, flufenrim, piridaliol, espiroclifeno, bifentazol, espiromesifeno, espirotetramat, propargita, clofentezina, fluacipirim, metaflumizona, flubendiamida, clorantraniliprol, ciflumetofeno, cienopirafeno, pirifluquinazona, fenazaquina, piridabeno, amidoflumet, clorobenzoato, sulfluramida, hidrametilnon, metaldehído y rianodina. Además, productos químicos agrícolas microbianos tales como *Bacillus thuringiensis aizawai*, *Bacillus thuringiensis kurstaki*, *Bacillus thuringiensis israelensis*, *Bacillus thuringiensis japonensis*, *Bacillus thuringiensis tenebrionis*, proteína cristalina insecticida producida por *Bacillus thuringiensis*, virus de insectos, hongos entomopatogénicos, y hongos nematófagos; antibióticos o antibióticos semisintéticos tales como avermectina, benzoato de emamectina, milbemectina, espinosad, ivermectina, lepimectina, espinetoram, abamectina y emamectina; productos naturales tales como azadiractina y rotenona; y se pueden mencionar, por ejemplo repelentes tales como DEET.

Los compuestos activos fungicidas en los productos químicos agrícolas anteriormente mencionados incluyen, por ejemplo, (por medio de sus nombres comunes, algunos de los cuales están todavía en una fase de aplicación, o códigos de ensayo de la Japan Plant Protección Association) compuestos de anilinoimidazolinona tales como mepanipirim, pirimetanilo y ciprodinilo; compuestos de piridinamina tales como fluazinam; compuestos de azol tales como triadimefón, bitertanol, triflumizol, etaconazol, propiconazol, penconazol, flusilazol, miclobutanil, ciproconazol, tebuconazol, hexaconazol, furconazol-cis, procloraz, metconazol, epoxiconazol, tetraconazol, fumarato de oxpoconazol, sipconazol, protioconazol, triadimenol, flutriafol, difenoconazol, fluquinconazol, fenbuconazol, bromuconazol, diniconazol, triciclazol, probenazol, simeconazol, pefurazoato, ipconazol e imibenconazol; compuestos de quinoxalina tales como quinometionato; compuestos de ditiocarbamato tales como maneb, zineb, mancozeb, policarbamato, metiram, propineb y tiram; compuestos de cloro orgánicos tales como ftaluro, clorotalonilo y quintozeno; compuestos de imidazol tales como benomilo, tiofanato-metilo, carbendazim, tiabendazol, fuberiazol y ciazofamid; compuestos de cianoacetamida tales como cimoxanil; compuestos de fenilamida tales como metalaxilo, metalaxil-M, mephenoxam, oxadixilo, ofurace, benalaxilo, benalaxil-M (otro nombre: kiralaxilo, quiralaxilo), furalaxilo y ciprofuram; compuestos de ácido sulfénico tales como diclofluanid; compuestos de cobre tales como hidróxido cúprico y oxina-cobre; compuestos de isoxazol tales como himexazol; compuestos organofosforados tales como fosetilo-Al, tolcofos-metilo, S-benzilo, O,O-diisopropilfosforotioato, O-etilo, S,S-difenilfosforoditioato, etilhidrógenofosfonato de aluminio, edifenfos y iprobenfos; compuestos de N-halogenotioalquilo tales como captán, captafol y folpet; compuestos de dicarboximida tales como procimidona, iprodiona y vinclozolina; compuestos de benzanilida tales como flutolanilo, mepronilo, zoxamid y tiadinilo; compuestos de anilida tales como carboxina, oxicarboxino, tifluzamida, pentiopirad y boscalida; compuestos de piperazina tales como triforina; compuestos de piridina tales como pirifenox; compuestos de carbinol tales como fenarimol y flutriafol; compuestos de piperidina tales como fenpropidina; morfolina compuestos tales como fenpropimorf y tridemorf; compuestos de organoestaño tales como hidróxido de fentina y acetato de fentina; compuestos de urea tales como penciclorón; compuestos de ácido cinámico tales como dimetomorf y flumorf; compuestos de fenilcarbamato tales como dietiofencarb; compuestos de cianopirrol tales como fludioxonil y fenpiclonil, compuestos de estrobilurina tales como azoxistrobina, kresoxim-metilo, metominofeno, trifloxiestrobina, picoxiestrobina, orizaestrobina, dimoxiestrobina, piraclostrobina, fluoxaestrobina y fluacipirina; compuestos de oxazolidinona tales como famoxadona; compuestos de tiazolcarboxamida tales como etaboxam; compuestos de sililamida tales como siltiofam; compuestos de amidocarbamato de aminoácido tales como iprovalicarb y bentiavalicarb-isopropilo; compuestos de imidazolidina tales como fenamidona; compuestos de hidroxanilida tales como fenhexamid; compuestos de bencenosulfonamida tales como flusulfamida; compuestos de oxima-eter tales como ciflufenamid; compuestos de fenoxiamida tales como fenoxanilo; antibióticos tales como validamicina, kasugamicina y polioxinas; compuestos de guanidina tales como iminocadina; y otros compuestos tales como isoprotilano, piroquilona, diclomezina, quinoxifeno, hidrocloreto de propamocarb, espiroxamina, cloropirina, dazomet, metam sódico, nicobifeno, metrafenona, UBF-307, diclocimet,

proquinazid, amisulbrom (otro nombre: amibromdol), KIF-7767 (KUF-1204, piribencarb metilo, mepiricarb), Syngenta 446510 (mandipropamida, dipromandamida), fluopicolida, carpropamida, BCF051, BCM061 y BCM062,

5 Además, los productos químicos agrícolas que se pueden utilizar mezclados con o combinados con los compuestos de la presente invención, pueden ser, por ejemplo, los compuestos ingrediente activo en los herbicidas como se describe en Farm Chemicals Handbook (2002 edición), particularmente los de tipo tratamiento del suelo.

10 Los plaguicidas contra parásitos de animales son eficaces para controlar p. ej. parásitos externos que son parásitos sobre la superficie del cuerpo de animales anfitriones (por ejemplo en el dorso, la axila, el abdomen inferior o en el interior del muslo) o parásitos internos que son parásitos en el cuerpo de de animales anfitriones (por ejemplo en el estómago, el tracto intestinal, el pulmón, el corazón, el hígado, los vasos sanguíneos, la hipodermis o los tejidos linfáticos), pero son particularmente eficaces para controlar los parásitos externos.

15 Los parásitos externos pueden ser, por ejemplo, ácaros o pulgias parásitos de animales. Sus especies son tantas que es difícil enumerar todos ellos, y por lo tanto, se proporcionarán sus ejemplos típicos.

20 Los ácaros parásitos de animales pueden ser, por ejemplo, garrapatas tales como Boophilus microplus, Rhipicephalus sanguineus, Haemaphysalis longicornis, Haemaphysalis flava, Haemaphysalis campanulata, Haemaphysalis concinna, Haemaphysalis japonica, Haemaphysalis kitaokai, Haemaphysalis ias, Ixodes ovatus, Ixodes nipponensis, Ixodes persulcatus, Amblyomma testudinarium, Haemaphysalis megaspinosa, Dermacentor reticulatus, y Dermacentor taiwanesis; arañas rojas comunes (Dermanyssus gallinae); ácaros de aves septentrionales tales como Ornithonyssus silviarum, y Ornithonyssus bursa; trombidioidea tales como Eutrombicula wichmanni, Leptotrombidium akamushi, Leptotrombidium pallidum, Leptotrombidium fuji, Leptotrombidium tosa, Neotrombicula autumnalis, Eutrombicula alfreddugesi, y Helenicula miyagawai; cheiletidae tales como Cheiletiella yasguri, Cheiletiella parasitivorax, y Cheiletiella blakei; ácaros de la sarna sarcóptica tales como Psoroptes cuniculi, Chorioptes bovis, Otodectes cynotis, Sarcoptes scabiei, y Notoedres cati; y Demodicidae tales como Demodex canis. Los plaguicidas contra parásitos en animales, que contienen los compuestos de la presente invención, son particularmente eficaces para el control garrapatas entre ellos.

30 Las pulgas pueden ser, por ejemplo, insectos sin alas parásitos externos pertenecientes a Siphonaptera, más específicamente, pulgas pertenecientes a Pulicidae, Ceratephillus, etc. Las pulgas pertenecientes a Pulicidae pueden ser, por ejemplo, Ctenocephalides canis, Ctenocephalides felis, Pulex irritans, Echidnophaga gallinacea, Xenopsilla cheopis, Leptopsilla segnis, Nosopsillus fasciatus, y Monopsillus anisus. Los plaguicidas contra parásitos en animales, que contienen los compuestos de la presente invención, son particularmente eficaces para el control de pulgas pertenecientes a Pulicidae, particularmente Ctenocephalides canis y Ctenocephalides felis, entre ellos.

40 Otros parásitos externos pueden ser, por ejemplo, los piojos chupadores (Anoplura) tales como el piojo del ganado de nariz corta (Haematopinus eurysternus), el piojo chupador del caballo (Haematopinus asini), el piojo de las ovejas, el piojo del ganado de nariz larga (Linognathus vituli), y el piojo de la cabeza (Pediculus capitis); piojos masticadores tales como el piojo masticador del perro (Trichodectes canis); e insectos dípteros chupadores de sangre tales como el tábano (Tabanus trigonus), los mosquitos mordedores (Culicoides schultzei), y la mosca negra (Simulium ornatum). Además, los parásitos internos pueden ser, por ejemplo, nematodos tales como lombrices pulmonares, tricocéfalos (Trichuris), gusanos tuberosos, parásitos gástricos, áscaris, y filarioidea; cestodos tales como Spirometra erinacei, Diphilobothrium latum, Dipilidium caninum, Taenia multiceps, Echinococcus granulosus, Echinococcus multilocularis; trematodos tales como Schistosoma japonicum, Fasciola hepatica; y protozoos tales como coccidia, parásitos de la malaria (Plasmodium malariae), sarcoquistes intestinales, toxoplasma, y criptosporidium.

50 Los animales anfitriones pueden ser, por ejemplo, animales mascota, animales domésticos, y volatería, tales como perros, gatos, ratones, ratas, hámsters, cobayas, ardillas, conejos, hurones, aves (tales como palomas, loros, miná religioso, gorriones de Java, loros melíferos, tórtolas y canarios), vacas, caballos, cerdos, ovejas, patos y pollos. Los plaguicidas contra parásitos en animales, que contienen los compuestos de la presente invención, son particularmente eficaces para el control de plagas parásitas sobre animales mascota o animales domésticos, especialmente para el control de parásitos externos, entre ellos. Entre los animales mascota o los animales domésticos, son particularmente eficaces para perros y gatos, vacas y caballos.

60 Cuando el compuesto de la presente invención se utiliza como plaguicida contra parásitos en animales, éste se puede utilizar tal cual o se puede utilizar con coadyuvantes adecuados, formulado en diversas formulaciones tales como un espolvoreable, gránulos, comprimidos, un polvo, cápsulas, un concentrado soluble, un concentrado emulsionable, un concentrado en suspensión a base de agua y un concentrado en suspensión a base de aceite. Además de tales formulaciones, éste se puede formular en cualquier tipo de formulación que se utiliza comúnmente en este campo, con tal que sea adecuado para el propósito de la presente invención. Los coadyuvantes que se van a utilizar para las formulaciones pueden ser, por ejemplo, los tensioactivos aniónicos o los tensioactivos no iónicos ilustrados anteriormente para la formulación de plaguicidas agrícolas y hortícolas; un tensioactivo catiónico tal como bromuro de cetiltrimetilamonio; un disolvente tal como agua, acetona, acetonitrilo, monometilacetamida, dimetilacetamida, dimetilformamida, 2-pirrolidona, N-metil-2-pirrolidona, queroseno, triacetina, metanol, etanol,

isopropanol, alcohol bencílico, etilenglicol, propilenglicol, polietilenglicol, polioxietilenglicol líquido, butildiglicol, monometiléter de etilenglicol, monoetiléter de etilenglicol, monoetiléter de dietilenglicol, n-butiléter de dietilenglicol, monometiléter de dipropilenglicol, o n-butiléter de dipropilenglicol; un antioxidante tal como butilhidroxianisol, butilhidroxitolueno, ácido ascórbico, hidrogenometasulfito de sodio, galato de propilo o tiosulfato de sodio; un agente formador de recubrimiento pelicular tal como polivinilpirrolidona, poli(alcohol vinílico), o un copolímero de acetato de vinilo y vinilpirrolidona; los aceites vegetales y los aceites minerales ilustrados anteriormente como coadyuvantes de formulación de plaguicidas agrícolas y hortícolas; un portador tal como lactosa, sacarosa, glucosa, almidón, harina de trigo, polvo de maíz, torta y harina de soja, salvado de arroz desgrasado, carbonato de calcio u otras sustancias alimenticias asequibles comercialmente; etcétera. Uno o más de los componentes respectivos de estos coadyuvantes se pueden seleccionar adecuadamente para su uso, con tal que los mismos no se aparten del fin de la presente invención. Además, se pueden seleccionar adecuadamente para su uso otros de los coadyuvantes anteriormente mencionados, algunos entre los conocidos en este campo, y además, se pueden seleccionar adecuadamente para su uso algunos entre los coadyuvantes anteriormente mencionados que se van a utilizar en el campo agrícola y hortícola.

La razón de mezcla del compuesto de la presente invención con respecto a los diferentes coadyuvantes es usualmente de 0,1:99,9 a 90:10. En el uso real de tal formulación, ésta se puede utilizar tal cual, o se puede diluir hasta una concentración predeterminada con un diluyente tal como agua, y se pueden añadir a la misma diversos propagadores (p. ej. tensioactivos, aceites vegetales o aceites minerales), según requiera el caso.

La administración del compuesto de la presente invención a un animal anfitrión se lleva a cabo oralmente o parenteralmente. En cuanto al método de administración oral, se puede mencionar un método de administración de un comprimido, un agente líquido, una cápsula, una oblea, una galleta, una carne picada u otro alimento, que contenga el compuesto de la presente invención. En cuanto al método de administración parenteral, se puede mencionar, por ejemplo, un método donde el compuesto de la presente invención se formula en una formulación adecuada y a continuación se introduce en el organismo p. ej. por medio de administración intravenosa, administración intramuscular, administración intradérmica, administración hipodérmica, etc.; un método donde éste se administra sobre la superficie del cuerpo por medio de tratamiento de aplicación puntual, tratamiento epicutáneo; o un método de imbibición de un fragmento de resina o similares que contiene el compuesto de la presente invención bajo la piel del animal anfitrión.

La dosis del compuesto de la presente invención a un animal anfitrión varía dependiendo del método de administración, el propósito de la administración, los síntomas presentados, etc., pero se administra usualmente en una proporción de 0,01 mg a 100 g, preferiblemente de 0,1 mg a 10 g, por 1 kg de peso corporal del animal anfitrión.

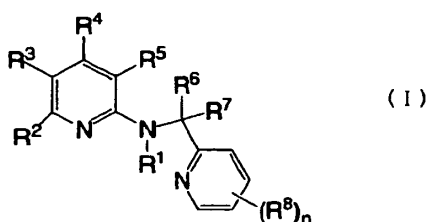
Un método para controlar una plaga por medio del método de administración anteriormente mencionado o por medio de la dosis anteriormente mencionada, particularmente se describe por la presente un método para controlar parásitos externos o parásitos internos.

Además, controlando las plagas parásitas en animales como se ha descrito antes, es posible prevenir o curar diferentes enfermedades del animal anfitrión ocasionadas por las mismas en algunos casos. De este modo, la presente invención también incluye un agente preventivo o terapéutico para una enfermedad animal causada por parásitos, que contiene el compuesto de la presente invención como ingrediente activo.

Cuando el compuesto de la presente invención se utiliza como plaguicida contra parásitos en animales, se pueden utilizar diversas vitaminas, minerales, aminoácidos, nutrientes, enzimas, antipiréticos, sedantes, antiflogísticos, fungicidas, colorantes, sustancias aromáticas, conservantes, etc., mezclados con o combinados con los coadyuvantes. Además, según requiera el caso, se pueden mezclar o combinar para su uso otros fármacos animales o productos químicos agrícolas, tales como vermícidias, agentes anti-coccidios, insecticidas, miticidas, pulicidas, nematocidas, bactericidas o agentes antibacterianos, con lo que se pueden obtener a veces efectos mejorados. La presente invención incluye tal composición plaguicida que tiene los diversos componentes anteriormente mencionados mezclados o combinados para su uso.

Las realizaciones preferidas del compuesto representado por la fórmula (I) anterior son las siguientes. Sin embargo, se debe entender que la presente invención no está restringida por las mismas de ninguna manera.

(1) Un derivado de piridil-metanamina representado por la fórmula (I) o una de sus sales:



donde R^1 es hidrógeno, alquilo que puede estar sustituido con R^b , alquenilo que puede estar sustituido con R^b , alquinilo que puede estar sustituido con R^b , arilo, ciano, $N=CHR^c$, OR^c , $S(O)_pR^c$, $COSR^c$, $COOR^c$, COR^c , o un grupo heterocíclico que puede estar sustituido con alquilo o haloalquilo; cada uno de R^2 y R^3 que son independientes entre sí, es hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, alquilo que puede estar sustituido con R^8 , cicloalquilo, alquenilo, alquinilo, arilo, un grupo heterocíclico, NR^aR^c , OR^a , SR^a , COR^a , $COOR^a$, $CONR^aR^c$, $CH=NOR^a$, SO_2R^a o SOR^a ; R^4 is trifluorometilo o clorodifluorometilo; R^5 es hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, alquilo que puede estar sustituido con R^8 , alquenilo que puede estar sustituido con R^8 , alquinilo que puede estar sustituido con R^8 , OR^a , SR^a , NR^aR^c , $COOR^a$ o COR^a ; cada uno de R^6 y R^7 que son independientes entre sí, es hidrógeno, ciano, alquilo, haloalquilo o cicloalquilo, o R^6 y R^7 pueden formar juntos cicloalquilo C3-C6 que puede estar sustituido con halógeno; R^8 es alquilo, cicloalquilo, alcoxialquilo, alcoxialcoxialquilo, hidroxialquilo, halógeno, haloalquilo, ciano, nitro, arilo que puede estar sustituido con halógeno, un grupo heterocíclico que puede estar sustituido con halógeno, oxi heterocíclico que puede estar sustituido con halógeno, $CONR^aR^c$, COR^c , $COOR^c$, NR^aR^c o OR^a ; R^a es hidrógeno, alquilo, cicloalquilo, haloalquilo o alquilo heterocíclico; R^b es halógeno, arilo que puede estar sustituido con R^8 , un grupo heterocíclico que puede estar sustituido con R^8 , oxi heterocíclico que puede estar sustituido con R^8 , tio heterocíclico que puede estar sustituido con R^8 , ciano, NR^aR^c , $NHCOOR^a$, COR^c , $COOR^c$, $CONR^aR^c$, alcoxialcoxi, OR^a o $S(O)_pR^a$; R^c es hidrógeno, alquilo, haloalquilo, cicloalquilo, alcoxialquilo, hidroxialquilo, arilo que puede estar sustituido con halógeno, o un grupo heterocíclico que puede estar sustituido con haloalquilo; n es un número entero de 0 a 4, p es un número entero de 0 a 2, en el radical NR^aR^c en cada uno de los sustituyentes anteriores, R^a y R^c pueden formar juntos un anillo heterocíclico de 5 o 6 miembros junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, siempre que se excluya N-(2-piridilmetil)-3,5,6-tricloro-4-(trifluorometil)-2-piridilamina.

(2) El derivado de piridil-metanamina o una de sus sales de acuerdo con el apartado (1), donde R^1 es hidrógeno, alquilo que puede estar sustituido con R^b , alquenilo que puede estar sustituido con R^b , alquinilo que puede estar sustituido con R^b , arilo, un grupo heterocíclico que puede estar sustituido con haloalquilo, $N=CHR^c$, OR^c , $COSR^c$ o COR^c ; cada uno de R^2 y R^3 que son independientes entre sí, es hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, alquilo que puede estar sustituido con R^8 , cicloalquilo, alquenilo, alquinilo, arilo, un grupo heterocíclico, NR^aR^c , OR^a , SR^a , COR^a , $COOR^a$, $CONR^aR^c$, SO_2R^a o SOR^a ; R^5 es hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, alquilo que puede estar sustituido con R^8 , $COOR^a$ o COR^a ; cada uno de R^6 y R^7 que son independientes entre sí, es hidrógeno, ciano, alquilo, haloalquilo o cicloalquilo; R^8 es alquilo, cicloalquilo, alcoxialquilo, alcoxialcoxialquilo, hidroxialquilo, halógeno, haloalquilo, ciano, nitro, NR^aR^c o OR^a ; R^a es hidrógeno, alquilo, cicloalquilo o haloalquilo; R^b es halógeno, arilo que puede estar sustituido con R^8 , un grupo heterocíclico que puede estar sustituido con R^8 , ciano, NR^aR^c , $NHCOOR^a$, OR^a o SR^a ; y R^c es hidrógeno, alquilo, cicloalquilo, arilo o un grupo heterocíclico que puede estar sustituido con haloalquilo.

(3) El derivado de piridil-metanamina o una de sus sales de acuerdo con el apartado (2), donde cada uno de R^2 y R^3 que son independientes entre sí, es hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, alquilo, haloalquilo, alquenilo, alquinilo, arilo, un grupo heterocíclico, NR^aR^c , OR^a , SR^a , COR^a o SOR^a ; R^5 es hidrógeno, halógeno o COR^a ; R^8 es alquilo, halógeno, haloalquilo, alcoxialcoxialquilo, hidroxialquilo, ciano, NR^aR^c o OR^a ; R^a es hidrógeno, alquilo o haloalquilo; R^b es halógeno, arilo, un grupo heterocíclico que puede estar sustituido con R^8 , ciano, NR^aR^c , OR^a o SR^a ; y R^c es hidrógeno, alquilo, arilo o un grupo heterocíclico.

(4) El derivado de piridil-metanamina o una de sus sales de acuerdo con el apartado (2), donde R^1 es hidrógeno, alquilo que puede estar sustituido con R^b , alquenilo que puede estar sustituido con R^b , alquinilo, arilo, un grupo heterocíclico que puede estar sustituido con haloalquilo, OR^c o COR^c ; R^2 es hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo, haloalquilo, alquinilo, arilo, NR^aR^c , OR^a o SR^a ; R^3 es hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, haloalquilo, arilo, NR^aR^c , SR^a o COR^a ; R^4 es trifluorometilo; R^5 es hidrógeno, halógeno o COR^a ; cada uno de R^6 y R^7 que son independientes entre sí, es hidrógeno, alquilo o cicloalquilo; R^8 es alquilo, halógeno, haloalquilo, alcoxialcoxialquilo, hidroxialquilo, ciano o OR^a ; R^a es hidrógeno o alquilo; R^b es halógeno, arilo, un grupo heterocíclico que puede estar sustituido con R^8 , OR^a o NR^aR^c ; R^c es hidrógeno, alquilo, arilo o un grupo heterocíclico.

(5) El derivado de piridil-metanamina o una de sus sales de acuerdo con el apartado (2), donde R^1 es hidrógeno, alquilo que puede estar sustituido con R^b , alquenilo que puede estar sustituido con R^b , alquinilo que puede estar sustituido con R^b , arilo, OR^c o COR^c ; R^b es halógeno, arilo que puede estar sustituido con R^8 , ciano, OR^a o SR^a ; $R^{b'}$ es halógeno, arilo que puede estar sustituido con R^8 , un grupo heterocíclico que puede estar sustituido con R^8 , ciano, OR^a o SR^a .

El derivado de piridil-metanamina o una de sus sales del apartado (1) anterior es un compuesto novedoso y se puede producir por medio de al menos un procedimiento entre los procedimientos para producir los derivados de piridil-metanamina mostrados mediante los procedimientos de producción [1], [2], [3], [4], [5], [6], [7], [8], [9] y [10] anteriores. Por ejemplo, se puede producir por medio de al menos un procedimiento entre los procedimientos producción [1], [2] y [3] anteriores.

EJEMPLOS

Ahora, la presente invención se describirá con más detalle con referencia a los Ejemplos, pero se debe entender que la presente invención no está restringida de ningún modo por los mismos. En primer lugar, se describirán los Ejemplos de Preparación del compuesto de la presente invención.

EJEMPLO DE PREPARACIÓN 1**PREPARACIÓN DE N-(2-PIRIDILMETIL)-6-CLORO-4-(TRIFLUOROMETIL)-2-PIRIDILAMINA (Núm. de Compuesto 128)**

A una disolución de 10 g de 2,6-dicloro-4-(trifluorometil)piridina en 50 ml de etanol, se le añadieron 10 g de 2-picolilamina y se agitó a temperatura ambiente durante 24 horas, y a continuación se hizo reaccionar a 60°C durante 16 horas y a 80°C durante 24 horas. Una vez completada la reacción, el etanol se separó mediante destilación a presión reducida, y al residuo, se le añadió acetato de etilo. La disolución de acetato de etilo se lavó con una disolución acuosa saturada de cloruro de sodio y a continuación se secó sobre sulfato de magnesio anhidro, y el acetato de etilo se separó mediante destilación a presión reducida. El residuo sólido obtenido se recristalizó en hexano para obtener 9,55 g del producto deseado.

EJEMPLO DE PREPARACIÓN 2**PREPARACIÓN DE N-(2-PIRIDILMETIL)-5,6-DICLORO-4-(TRIFLUOROMETIL)-2-PIRIDILAMINA (Núm. de Compuesto 118)**

A una disolución de 5,0 g de N-(2-piridilmetil)-6-cloro-4-(trifluorometil)-2-piridilamina en 50 ml de dimetilformamida, se le añadieron 2,4 g de N-clorosuccinimida a temperatura ambiente, seguido de calentamiento gradual a 50°C. Tres horas después, se añadieron 0,2 g de N-clorosuccinimida y se hicieron reaccionar durante 1 hora, y además, se añadieron 0,2 g y se hicieron reaccionar durante 45 minutos. Se dejó que la disolución de reacción se enfriara y a continuación se añadió agua a esto, seguido de extracción dos veces con acetato de etilo. La disolución del extracto se lavó con una disolución acuosa saturada de cloruro de sodio y a continuación se secó sobre sulfato de magnesio anhidro, y el disolvente se separó mediante destilación a presión reducida. El residuo se purificó por medio de cromatografía en columna de gel de sílice (eluyente: n-hexano/acetato de etilo = 1/1) para obtener 2,8 g del producto deseado.

EJEMPLO DE PREPARACIÓN 3**PREPARACIÓN DE N-ALIL-N-(2-PIRIDILMETIL)-5,6-DICLORO-4-(TRIFLUOROMETIL)-2-PIRIDILAMINA (Núm. de Compuesto 55)**

A una disolución de 300 mg de N-(2-piridilmetil)-5,6-dicloro-4-(trifluorometil)-2-piridilamina en 4 ml de dimetilformamida, se le añadieron 40 mg de hidruro de sodio, seguido de agitación a temperatura ambiente. Al cabo de 10 minutos, se añadieron gota a gota 110 mg de bromuro de alilo, seguido de agitación a temperatura ambiente durante 2,5 horas. Una vez completada la reacción, se añadió agua a la disolución de reacción, seguido de extracción dos veces con acetato de etilo. La disolución del extracto se lavó con una disolución acuosa saturada de cloruro de sodio y a continuación se secó sobre sulfato de magnesio anhidro, y el disolvente se separó mediante destilación a presión reducida. El residuo se purificó por medio de cromatografía en columna de gel de sílice (eluyente: N-hexano/acetato de etilo = 3/1) para obtener 150 mg del producto deseado.

EJEMPLO DE PREPARACIÓN 4**PREPARACIÓN DE N,N-BIS(2-PIRIDILMETIL)-5-NITRO-4-(TRIFLUOROMETIL)-2-PIRIDILAMINA (Núm. de Compuesto 9)**

(1) Enfriando con hielo, se añadieron gradualmente 1,0 g de 2-amino-4-(trifluorometil)piridina a 5 ml de ácido sulfúrico al 97%, seguido de agitación a temperatura ambiente hasta que éste se disolvió. La disolución de reacción se enfrió a -10°C, y se añadieron gota a gota una mezcla disolvente refrigerada de 0,8 ml de ácido nítrico al 69% y 0,6 ml de ácido sulfúrico al 97%, seguido de una reacción a -10°C durante 30 minutos. La disolución de reacción se vertió en 40 g de hielo, y se añadió amoníaco acuoso al 28% para su neutralización. Después de enfriar, los cristales precipitados se recogieron mediante filtración y se secaron. El polvo incoloro obtenido se añadió a 5,5 ml de ácido sulfúrico al 97% enfriando con hielo, seguido de agitación durante 30 minutos. Además, se agitó a temperatura ambiente durante 1 hora y a continuación se hizo reaccionar a 50°C durante 1 hora. Después de enfriar, la disolución de reacción se vertió en 40 g de hielo, y se añadió amoníaco acuoso al 28% para su neutralización, seguido de agitación enfriando con hielo. Los cristales precipitados se recogieron mediante filtración, se lavaron con agua fría y a continuación se secaron para obtener 0,41 g de 2-amino-5-nitro-4-(trifluorometil)piridina que tenía un punto de fusión de 138-140°C.

(2) A una disolución de 260 mg de 2-amino-5-nitro-4-(trifluorometil)piridina y 350 mg de hidrobromuro de (2-bromometil)piridina en 6 ml de dimetilsulfóxido, se le añadieron gota a gota 0,38 ml de una disolución acuosa 10 de M hidróxido de sodio y se hizo reaccionar a temperatura ambiente durante 16 horas. Se añadió agua a la disolución de reacción, seguido de extracción dos veces con acetato de etilo. La disolución del extracto se lavó con una disolución acuosa saturada de cloruro de sodio y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro, y el disolvente se separó mediante destilación a presión reducida. El residuo se purificó por medio de

cromatografía en columna de gel de sílice (eluyente: n-hexano/acetato de etilo = 1/2) para obtener 130 mg del producto deseado.

5 EJEMPLO DE PREPARACIÓN 5

PREPARACIÓN DE N,N-BIS(2-PIRIDILMETIL)-6-BROMO-4-(TRIFLUOROMETIL)-2-PIRIDILAMINA (Núm. de Compuesto 90)

(1) A 5,0 g de 2,6-dicloro-4-(trifluorometil)piridina, se le añadieron 25 ml de una disolución de ácido acético saturada con bromuro de hidrógeno (aproximadamente 30%) y se hicieron reaccionar a reflujo. Al cabo de 3 horas, se añadieron además 10 ml de una disolución de ácido acético saturada con bromuro de hidrógeno (aproximadamente 30%), seguido de reflujo durante 2 horas. Además, se añadieron 10 ml de una disolución de ácido acético saturada con bromuro de hidrógeno (aproximadamente 30%) y se sometió a reflujo durante 2 horas, y a continuación, 10 ml de ácido acético saturado con bromuro de hidrógeno (aproximadamente 30%) y se sometió a reflujo durante 1 hora. La disolución de reacción se enfrió a temperatura ambiente, y a continuación se añadió a 200 ml de una disolución acuosa de hidrógeno de sodio al 10% enfriando con hielo. A la disolución obtenida, se le añadió hidróxido de sodio (sólido) para constituir la disolución alcalina. La disolución se extrajo dos veces con éter dietílico, y la disolución del extracto se secó sobre sulfato de magnesio anhidro y el disolvente se separó mediante destilación a presión reducida para obtener 6,9 g de 2,6-dibromo-4-(trifluorometil)piridina oleosa.

(2) A una disolución de 1,0 g de 2,6-dibromo-4-(trifluorometil)piridina en 10 ml de dimetilformamida, se le añadieron 0,72 g de 2,2'-dipicolilamina y 0,33 g de hidrogenocarbonato de sodio y se hizo reaccionar a 90°C durante 19 horas. Se dejó que la disolución de reacción se enfriara y a continuación se añadió agua a esto, seguido de extracción dos veces con acetato de etilo. La disolución del extracto se lavó con una disolución acuosa saturada de cloruro de sodio y a continuación se secó sobre sulfato de magnesio anhidro, y el disolvente se separó mediante destilación a presión reducida. El residuo se purificó por medio de cromatografía en columna de gel de sílice (eluyente: n-hexano/acetato de etilo = 1/3) para obtener 1,1 g del producto deseado.

30 EJEMPLO DE PREPARACIÓN 6

PREPARACIÓN DE N,N-BIS(2-PIRIDILMETIL)-6-BROMO-5-CLORO-4-(TRIFLUOROMETIL)-2-PIRIDILAMINA (Núm. de Compuesto 92)

A una disolución de 500 mg de N,N-bis(2-piridilmetil)-6-bromo-4-(trifluorometil)-2-piridilamina en 5 ml de dimetilformamida, se le añadieron 170 mg de N-clorosuccinimida y se hizo reaccionar a 60°C durante 7 horas. Se dejó que la disolución de reacción se enfriara y a continuación se añadió agua a esto, seguido de extracción dos veces con acetato de etilo. La disolución del extracto se lavó con una disolución acuosa saturada de cloruro de sodio y a continuación se secó sobre sulfato de magnesio anhidro, y el disolvente se separó mediante destilación a presión reducida. El residuo se purificó por medio de cromatografía en columna de gel de sílice (eluyente: n-hexano/acetato de etilo = 1/3) para obtener 500 mg del producto deseado.

EJEMPLO DE PREPARACIÓN 7

45 PREPARACIÓN DE N,N-BIS(2-PIRIDILMETIL)-5-CLORO-6-ETIL-4-(TRIFLUOROMETIL)-2-PIRIDILAMINA (Núm. de Compuesto 94)

Se sometieron a reflujo 370 mg de N,N-bis(2-piridilmetil)-6-bromo-5-cloro-4-(trifluorometil)-2-piridilamina, 95 mg de trimetilsililacetileno, 20 mg de transdiclorobistrifenilfosfina-paladio, 10 mg de yoduro de cobre y 4 ml de trietilamina durante 4 horas. La trietilamina se separó mediante destilación a presión reducida, y a continuación, se añadió agua, seguido de filtración a través de celite. El producto filtrado se extrajo dos veces con éter dietílico, y el disolvente de extracción se separó mediante destilación a presión reducida. Al residuo, se le añadieron 2 ml de metanol y 4 ml de una disolución acuosa 1N de hidróxido de sodio, seguido de agitación a temperatura ambiente durante 2 horas. A continuación, se añadió ácido clorhídrico al 10% para volver la disolución ácida. El metanol se separó mediante destilación a presión reducida, y se añadió carbonato de sodio para volver la disolución alcalina, seguido de extracción dos veces con éter dietílico. La disolución del extracto se secó sobre sulfato de magnesio anhidro, y el disolvente se separó mediante destilación a presión reducida. El residuo se purificó por medio de cromatografía en columna de gel de sílice (eluyente: n-hexano/acetato de etilo = 1/3) para obtener 250 mg del producto deseado.

60 EJEMPLO DE PREPARACIÓN 8

PREPARACIÓN DE N-(1-(3-PIRIDIL)ETIL)-N-(2-PIRIDILMETIL)-5,6-DICLORO-4-TRIFLUOROMETIL-2-PIRIDILAMINA (Núm. de Compuesto 97)

(1) A una mezcla disolvente que comprendía 4,56 g de 2-amino-6-cloro-4-trifluorometilpiridina y 30 ml de dimetilformamida, se le añadieron 3,4 g de N-clorosuccinimida. A continuación, la mezcla disolvente se calentó a 80°C y se hizo reaccionar durante 2 horas. Una vez completada la reacción, la mezcla disolvente se

enfrió con hielo, y se añadió una disolución acuosa saturada de hidrogenocarbonato de sodio. Ésta se extrajo dos veces con acetato de etilo, y a continuación, la capa orgánica se lavó con una disolución acuosa saturada de cloruro de sodio y se secó sobre sulfato de sodio anhidro. El disolvente en la capa orgánica se separó mediante destilación a presión reducida, y el residuo se purificó por medio de cromatografía de gel de sílice (eluyente: n-hexano/acetato de etilo = 3/1) para obtener 3,8 g de 6-amino-2,3-dicloro-4-trifluorometilpiridina que tenía un punto de fusión de 118-121°C.

(2) A una mezcla disolvente que comprendía 800 mg de 6-amino-2,3-dicloro-4-trifluorometilpiridina y 20 ml de etanol, se le añadieron 557 mg de 3-piridinaldehído, 3 g de tamices moleculares y 0,5 ml de ácido acético y se hizo reaccionar durante 3 días a reflujo. Una vez completada la reacción, el disolvente se separó mediante destilación a presión reducida. El residuo se disolvió en 50 ml de éter dietílico, y enfriando con hielo, se le añadieron gota a gota 4,6 ml de una disolución de bromuro de metilmagnesio (3 M, disolución en éter dietílico), Una vez completada la adición gota a gota, la mezcla se agitó a temperatura ambiente durante la noche. La mezcla disolvente se enfrió con hielo, y se añadieron 20 ml de agua. La disolución se extrajo dos veces con acetato de etilo. A continuación, la capa orgánica se lavó con una disolución acuosa saturada de cloruro de sodio y se secó sobre sulfato de sodio anhidro. El disolvente en la capa orgánica se separó mediante destilación a presión reducida, y el residuo se purificó por medio de cromatografía de gel de sílice (eluyente: n-hexano/acetato de etilo = 1/1), y los cristales brutos obtenidos se recrystalizaron en acetato de etilo/hexano para obtener 308 mg de N-(1-(3-piridil)etil)-5,6-dicloro-4-trifluorometil-2-piridilamina que tenía un punto de fusión de 159-161°C.

(3) A una suspensión que comprendía 19 mg de hidruro de sodio y 10 ml de dimetilformamida, se le añadió gota a gota gradualmente una mezcla disolvente que comprendía 133 mg de N-(1-(3-piridil)etil)-5,6-dicloro-4-trifluorometil-2-piridilamina y 1 ml de dimetilformamida enfriando con hielo, seguido de agitación a 0°C durante 30 minutos. A continuación, se añadió gota a gota gradualmente una mezcla disolvente que comprendía 136 mg de 2-bromometilpiridina y 2 ml de dimetilformamida. Una vez completada la adición gota a gota, la mezcla disolvente se hizo reaccionar a temperatura ambiente durante 2 horas. Una vez completada la reacción, la mezcla disolvente se enfrió con hielo, y a ésta se le añadieron 10 ml de agua, seguido de extracción tres veces con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con una disolución acuosa saturada de cloruro de sodio y se secó sobre sulfato de sodio anhidro. El disolvente en la capa orgánica se separó mediante destilación a presión reducida, y el residuo se purificó por medio de cromatografía de gel de sílice (eluyente: n-hexano/acetato de etilo = 1/1) para obtener 111 mg del producto deseado en forma de un aceite incoloro.

EJEMPLO DE PREPARACIÓN 9

PREPARACIÓN DE N,N-BIS(2-PIRIDILMETIL)-5-CLORO-4,6-BIS(TRIFLUOROMETIL)-2-PIRIDILAMINA (Núm. de Compuesto 103)

(1) A una disolución de 1,5 g de 2-amino-4,6-bis(trifluorometil)piridina en 5 ml de dimetilformamida, se le añadieron 870 mg de N-clorosuccinimida. A continuación, la mezcla disolvente se calentó a 40°C y se hizo reaccionar durante 1 hora. Se dejó que la disolución de reacción se enfriara y a continuación se añadió agua a esto y se agitó, seguido de extracción dos veces con acetato de etilo. A continuación, la capa orgánica se lavó con una disolución acuosa saturada de cloruro de sodio y se secó sobre sulfato de sodio anhidro. El disolvente en la capa orgánica se separó mediante destilación a presión reducida, y el residuo se purificó por medio de cromatografía de gel de sílice (eluyente: n-hexano/acetato de etilo = 7/3) para obtener 1,1 g de 2-amino-5-cloro-4,6-bis(trifluorometil)piridina que tenía un punto de fusión de 97°C.

(2) A una disolución de 150 mg de 2-amino-5-cloro-4,6-bis(trifluorometil)piridina y 260 mg de 2-bromometilpiridina con bromuro de hidrógeno en 4 ml de dimetilsulfóxido, se le añadieron gota a gota 0,2 ml de una disolución acuosa 10 M de hidróxido de sodio y se hizo reaccionar a temperatura ambiente durante 2,5 horas. Se añadió agua a la disolución de reacción, seguido de extracción dos veces con acetato de etilo. La disolución del extracto se lavó con una disolución acuosa saturada de cloruro de sodio y a continuación se secó sobre sulfato de magnesio anhidro, y el disolvente se separó mediante destilación a presión reducida. El residuo se purificó por medio de cromatografía en columna de gel de sílice (eluyente: n-hexano/acetato de etilo = 1/3) para obtener 110 mg del producto deseado.

EJEMPLO DE PREPARACIÓN 10

PREPARACIÓN DE N-(1-(2-PIRIDIL)-2-METIL)PROPIL-5,6-DICLORO-4-TRIFLUOROMETIL-2-PIRIDILAMINA (Núm. de Compuesto 75)

A una mezcla disolvente que comprendía 313 mg de 6-amino-2,3-dicloro-4-(trifluorometil)piridina, 160 mg de 2-piridinaldehído y 10 ml de metanol, se le añadió una cantidad catalítica de ácido acético y se hizo reaccionar a reflujo. Al cabo de 6 horas, el disolvente se separó mediante destilación a presión reducida, y al residuo oleoso resultante obtenido, se le añadieron 30 ml de éter dietílico. A esta disolución, se le añadieron 2,7 ml de una disolución en éter dietílico de cloruro de isopropilmagnesio (2M) enfriando con hielo. Una vez completada la adición gota a gota, la mezcla se calentó a temperatura ambiente y se agitó durante la noche. A la disolución de reacción, se le añadió agua, seguido de extracción dos veces con acetato de etilo. La disolución del extracto se lavó con una disolución acuosa saturada de cloruro de sodio y a continuación se secó sobre sulfato de magnesio anhidro, y el

disolvente se separó mediante destilación a presión reducida. El residuo se purificó por medio de cromatografía en columna de gel de sílice (eluyente: n-hexano/acetato de etilo = 1/4) para obtener 182 mg del producto deseado que tenía un punto de fusión de 165-168°C.

5 EJEMPLO DE PREPARACIÓN 11

PREPARACIÓN DE N-(2-PIRIDILMETIL)-5-CIANO-4,6-BIS(TRIFLUOROMETIL)-2-PIRIDILAMINA (Núm. de Compuesto 286)

(1) A una disolución de 1,4 g de 6-amino-3-bromo-2,4-bis(trifluorometil)piridina en 3 ml de triamiduro de ácido hexametilfosfórico, se le añadieron 1,0 g de cianuro de cobre y se hizo reaccionar a 140°C durante 4 horas bajo irradiación con microondas. Se dejó que la disolución de reacción se enfriara y se añadieron a esto agua y acetato de etilo, y se separó mediante filtración en celite un sólido insoluble. La capa orgánica se separó, y la capa acuosa se extrajo nuevamente dos veces con acetato de etilo. Las capas orgánicas se colocaron juntas y se lavaron con una disolución acuosa saturada de cloruro de sodio y se secaron sobre sulfato de magnesio anhidro, y el disolvente se separó mediante destilación a presión reducida. El residuo se purificó por medio de cromatografía en columna de gel de sílice (eluyente: n-hexano/acetato de etilo = 1/2) para obtener 690 mg de 6-amino-3-ciano-2,4-bis(trifluorometil)piridina que tenía un punto de fusión de 158-160°C.

(2) A una mezcla disolvente que comprendía 350 mg de 6-amino-3-ciano-2,4-bis(trifluorometil)piridina y 4 ml de etanol, se le añadieron 150 mg de 2-piridinaldehído, 0,4 g de tamices moleculares y 0,1 ml de ácido acético, y se hicieron reaccionar durante 40 horas a reflujo. Una vez completada la reacción, el producto de reacción se sometió a filtración, y el disolvente se separó mediante destilación a presión reducida. El residuo se disolvió en 4 ml de etanol, y se añadieron 52 mg de borohidruro de sodio enfriando con hielo, seguido de agitación a temperatura ambiente durante 3 horas. Una vez completada la reacción, se añadieron 20 ml de agua, seguido de extracción dos veces con acetato de etilo. A continuación, la capa orgánica se lavó con una disolución acuosa saturada de cloruro de sodio y se secó sobre sulfato de sodio anhidro. El disolvente en la capa orgánica se separó mediante destilación a presión reducida, y el residuo se purificó por medio de cromatografía instantánea de gel de sílice para obtener 82 mg del producto deseado que tenía un punto de fusión de 122-123°C.

EJEMPLO DE PREPARACIÓN 12

PREPARACIÓN DE HIDROCLORURO DE N,N-BIS(2-PIRIDILMETIL)-6-CLORO-5-CIANO-4-(TRIFLUOROMETIL)-2-PIRIDILAMINA


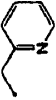



(Núm. de Compuesto 330)








A una disolución de 350 mg de N,N-bis(2-piridilmetil)-6-cloro-5-ciano-4-(trifluorometil)-2-piridilamina (Núm. de Compuesto 24) en 7 ml de etanol, se le añadieron gota a gota 1,5 ml de ácido clorhídrico concentrado. Después de enfriar a temperatura ambiente durante 1 hora, el disolvente se separó mediante destilación a presión reducida. El sólido de color blanco obtenido se sometió a limpieza de repulpado con etanol para obtener 410 mg del producto deseado que tenía un punto de fusión de 144-146°C.

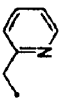
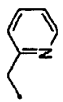
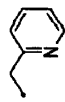
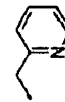

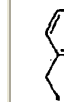
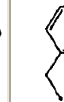


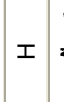
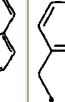


Ahora, se proporcionarán ejemplos típicos del compuesto representado por la fórmula (I) anterior en la Tabla 1. Estos compuestos se pueden preparar por medio de los Ejemplos de Preparación 1 a 12 anteriormente descritos o por medio de los diversos procedimientos para la producción del compuesto de la presente invención anteriormente mencionados. En la Tabla 1, Núm. representa el Núm. de Compuesto, Me metilo, Et etilo, Pr(i) isopropilo, Bu(t) butilo terciario, CO carbonilo, COO carboxilo, Ph fenilo, piridilo piridilo, piridiloxi piridiloxi, piperidino piperidino, morfolinilo morfolinilo, respectivamente. La temperatura mostrada como las propiedades físicas es el punto de fusión, "aceite" representa una sustancia oleosa, "amorfo" no cristalino, "aceite gomoso" una sustancia oleosa pegajosa, respectivamente. Además, nD representa un índice de refracción. Con respecto a los que no se muestra el punto de fusión o el índice de refracción, el RMN H^1 se muestra en la Tabla 2.

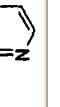

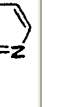
TABLA 1

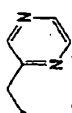
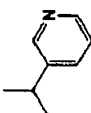
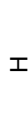
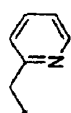
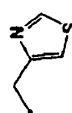

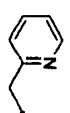
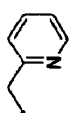
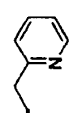
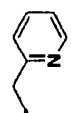

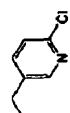
Núm.	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	(R ⁸) _n	Propiedades físicas
1		Cl	Cl	CF ₃	Cl	H	H	n=0	99-100°C
2		H	Cl	CF ₃	Cl	H	H	n=0	76,5°C
3		H	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	74-75°C
4		Cl	Cl	CF ₃	Cl	H	H	n=0	aceite
5		H	Br	CF ₃	Br	H	H	n=0	110-111°C
6		H	Cl	CF ₃	Cl	H	H	n=0	62-68°C
7		H	H	CF ₃	H	H	H	n=0	aceite
8		Cl	Cl	CF ₃	Cl	H	H	6-CN	108-112°C
9		H	NO ₂	CF ₃	H	H	H	n=0	aceite
10	Me	Cl	Cl	CF ₃	Cl	H	H	n=0	n _D ²⁰ =1,5618
11	H	H	NO ₂	CF ₃	H	H	H	n=0	137-138°C

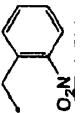
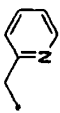
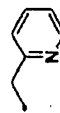
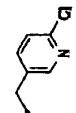
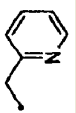
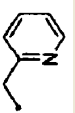
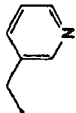
12	H	H	H	NH ₂	CF ₃	H	H	H	H	n=0	85-86°C
13	H	H	H	CF ₃ CF ₃	CF ₃	H	H	H	H	n=0	92-93°C
14	H	H	H	H	CF ₃	NO ₂	NO ₂	H	H	n=0	121-123°C
15	H	H	H	Ph	CF ₃	H	H	H	H	n=0	amorfo
16	H	H	H	Cl	CF ₃	Cl	Cl	Me	H	n=0	52°C
17		H	H	CF ₃	CF ₃	H	H	H	H	n=0	aceite
18		H	H	Cl	CF ₃	H	H	H	H	n=0	aceite
19		Cl	Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	H	n=0	76-77°C
20	H	Cl	Cl	CN	CF ₃	H	H	H	H	n=0	156-157°C
21	H	Cl	Cl	H	CF ₃	CN	CN	H	H	n=0	81-82°C
22	H	H	H	CN	CF ₃	H	H	H	H	n=0	93-95°C
23	CH ₂ Ph	Cl	Cl	Cl	CF ₃	Cl	Cl	H	H	n=0	aceite
24		Cl	Cl	CN	CF ₃	H	H	H	H	n=0	80-81°C
25	H	Cl	Cl	CN	CF ₃	CH(OH) Me	CH(OH) Me	H	H	n=0	131-132°C
26	H	Cl	Cl	H	CF ₃	COMe	COMe	H	H	n=0	87-88°C
27	H	Cl	Cl	COMe	CF ₃	H	H	H	H	n=0	aceite
28	H	H	H	NO ₂	CF ₃	NO ₂	NO ₂	H	H	n=0	176-179°C
29		Cl	Cl	COMe	CF ₃	H	H	H	H	n=0	aceite

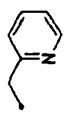
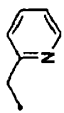
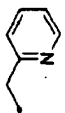
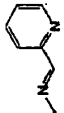
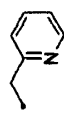
30	H	Cl	H	CF ₃	NO ₂	H	H	n=0	117-118°C
31	H	Cl	NO ₂	CF ₃	H	H	H	n=0	154-155°C
32		Cl	H	CF ₃	COMe	H	H	n=0	aceite
33	H	Cl	Cl	CF ₃	NO ₂	H	H	n=0	150-152°C
34	H	Cl	NO ₂	CF ₃	Cl	H	H	n=0	137-138°C
35		Cl	NO ₂	CF ₃	H	H	H	n=0	aceite
36		Cl	H	CF ₃	NO ₂	H	H	n=0	aceite
37	H	Cl	COOMe	CF ₃	COOMe	H	H	n=0	100-101°C
38		Cl	H	CF ₃	Cl	H	H	n=0	aceite
39		Cl	NO ₂	CF ₃	Cl	H	H	n=0	aceite
40	H	Cl	Cl	CF ₂ Cl	Cl	H	H	n=0	105-106°C
41	H	Cl	Cl	CF ₂ Cl	H	H	H	n=0	119-120°C
42		Cl	H	CF ₂ Cl	H	H	H	n=0	aceite
43		Cl	Cl	CF ₂ Cl	H	H	H	n=0	aceite
44	H	Cl	CONMe ₂	CF ₃	H	H	H	n=0	146-147°C
45	Me	Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	82-86°C
46		CN	H	CF ₃	H	H	H	n=0	aceite

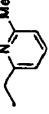
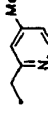
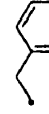

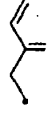
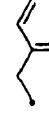
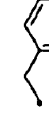
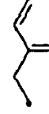
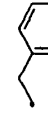
47		Cl	CONH ₂	CF ₃	H	H	H	n=0	158-159°C
48		CN	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	aceite
49		Cl	CONMe ₂	CF ₃	H	H	H	n=0	amorfo
50		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	aceite
51		CN	H	CF ₃	H	H	H	n=0	94-96°C
52		Cl	CH(OH)Pr(i)	CF ₃	H	H	H	n=0	aceite
53		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	aceite
54		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	aceite
55		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	aceite
56		CN	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	116-118°C
57		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	aceite
58		F	H	CF ₃	H	H	H	n=0	aceite
59		Cl	Cl	CF ₃	Cl	H	H	n=0	amorfo

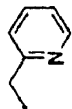
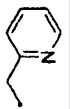
84		H	CN	CF ₃	Cl	H	H	H	n=0	112-114°C
85		Cl	Cl	CF ₃	Cl	H	H	H	3-OMe	163-165°C
86		Cl	Cl	CF ₃	H		H	H	H	aceite gomoso
87		CF ₃	Cl	CF ₃	Cl	H	H	H	n=0	92-93°C
88		H	CF ₃	CF ₃	Cl	H	H	H	n=0	100-102°C
89		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	H	n=0	81-82°C
90		Br	H	CF ₃	H	H	H	H	n=0	aceite
91		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	H	n=0	aceite
92		Br	Cl	CF ₃	H	H	H	H	n=0	77-78°C
93		Br	Br	CF ₃	H	H	H	H	n=0	71-73°C
94		-C≡CH	Cl	CF ₃	H	H	H	H	n=0	aceite
95		Me	NO ₂	CF ₃	H	H	H	H	n=0	aceite
96		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	H	n=0	aceite


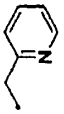
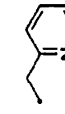


																								
97		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	H	H	n=0	aceite													
98		Me	Cl	CF ₃	Cl	H	H	H	H	n=0	85-87°C													
99		SMe	Cl	CF ₃	H	H	H	H	H	n=0	103-105°C													
100		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	H	H	n=0	68-70°C													
101		Me	Cl	CF ₃	H	H	H	H	H	n=0	94-96°C													
102		Me	Cl	CF ₃	H	H	H	H	H	n=0	aceite													
103		CF ₃	Cl	CF ₃	H	H	H	H	H	n=0	58-59°C													
104		F	F	CF ₃	F	H	H	H	H	n=0	aceite													
105		Ph	CN	CF ₃	H	H	H	H	H	n=0	158-160°C													
106		Cl	CN	CF ₃	F	H	H	H	H	n=0	72-73°C													
107		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	H	H	n=0	aceite gomoso													

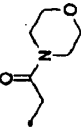
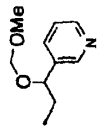
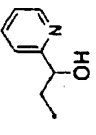
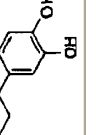
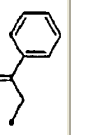
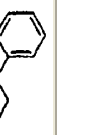
108		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	H	n=0	aceite gomoso
109		Cl	CN	CF ₃	F	H	H	H	n=0	87-88°C
110		CF ₃	H	CF ₃	H	H	H	H	n=0	aceite
111		Cl	Cl	CF ₃	H	Me	H	H	n=0	aceite
112	H	Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	H	3-Me	123-126°C
113	H	Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	H	3-CF ₃	149-151°C
114		OMe	NO ₂	CF ₃	H	H	H	H	n=0	aceite
115		F	NO ₂	CF ₃	H	H	H	H	n=0	aceite
116		CF ₃	Cl	CF ₃	H	H	H	H	n=0	aceite
117	H	Cl	H	CF ₃	Cl	H	H	H	n=0	110,6°C
118	H	Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	H	n=0	112,7°C
119	H	H	H	CF ₃	H	H	H	H	n=0	nD _{31,2} = 1,5245
120	H	CF ₃	H	CF ₃	H	H	H	H	n=0	113,2°C
121	H	F	F	CF ₃	F	H	H	H	n=0	87,7°C
122	H	CF ₃	Cl	CF ₃	Cl	H	H	H	n=0	160,7

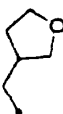
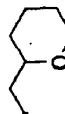

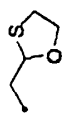
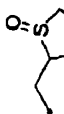
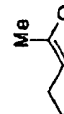
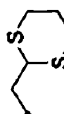


123	H	OEt	Cl	CF ₃	Cl	H	H	n=0	112,3°C
124	H	SMe	Cl	CF ₃	Cl	H	H	n=0	n _D 30,2=1,5426
125	H	SMe	SMe	CF ₃	Cl	H	H	n=0	116,5°C
126	H	SO ₂ Me	Cl	CF ₃	Cl	H	H	n=0	175,1°C
127	H	Cl	Cl	CF ₃	Cl	H	H	5-CF ₃	141,4°C
128	H	Cl	H	CF ₃	H	H	H	n=0	78,6°C
129	H	Cl	H	CF ₃	COOMe	H	H	n=0	99,5°C
130	H	Cl	COOMe	CF ₃	H	H	H	n=0	101,6°C
131	H	H	H	CF ₃	COOMe	H	H	n=0	n _D 29,0=1,5229
132	H	H	COOMe	CF ₃	H	H	H	n=0	90,1°C
133		CF ₃	Br	CF ₃	H	H	H	n=0	57-58°C
134		CF ₃	SMe	CF ₃	H	H	H	n=0	aceite
135		CF ₃	SOMe	CF ₃	H	H	H	n=0	aceite
136		H	CF ₃	CF ₃	H	H	H	n=0	aceite
137	CH ₂ Ph	Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	aceite
138	COSEt	Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	amorfo
139		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	6-CH ₂ OCH ₂ OCH ₃ aceite
140		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	6-CH ₂ OH aceite

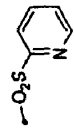






162		CF ₃	Cl	CF ₃	H	H	H	H	H	6-Me	aceite
163		CF ₃	Cl	CF ₃	H	H	H	H	H	4-Me	
164		CF ₃	Cl	CF ₃	H	Me	H	H	H	n=0	aceite
165		CF ₃	Cl	CF ₃	H	H	H	H	H	n=0	aceite
166	Et t	CF ₃	Cl	CF ₃	H	H	H	H	H	n=0	aceite
167		Cl	CF ₂ H	CF ₃	H	H	H	H	H	n=0	aceite
168		CF ₂ H	Cl	CF ₃	H	H	H	H	H	n=0	aceite
169		COMe	Cl	CF ₃	H	H	H	H	H	n=0	
170		CF ₂ Me	Cl	CF ₃	H	H	H	H	H	n=0	aceite
171		CF ₃	Me	CF ₃	H	H	H	H	H	n=0	aceite
172	CH ₂ CH ₂ NHCOOBu (t)	Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	H	H	n=0	127-131°C
173	CH ₂ CH ₂ OMe	CF ₃	Cl	CF ₃ CF ₃	H	H	H	H	H	n=0	aceite
174	H	Cl	Cl I	CF ₃	Me	H	H	H	H	n=0	125-127°C







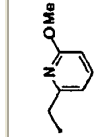





175	H	Me	Cl	CF ₃	Me	H	H	n=0	60-61°C
176	H	Cl	Cl	CF ₃	NH ₂	H	H	n=0	119-121°C
177	H	H	CN	CF ₃	Me	H	H	n=0	100-101°C
178	H	Cl	CN	CF ₃	Me	H	H	n=0	139-141°C
179	H	Cl	Me	CF ₃	CN	H	H	n=0	93-95°C
180	H	CF ₃	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	145-146°C
181	H	CF ₃	H	CF ₃	Cl	H	H	n=0	90-95°C
182	H	CF ₃	Cl	CF ₃	Me	H	H	n=0	106-107°C
183	H	CF ₃	Cl	CF ₃	Me	Me	H	n=0	76-78°C
184	H	CF ₃	Cl	CF ₃	Et	H	H	n=0	91-92°C
185	H	CF ₃	Cl	CF ₃	SMe	H	H	n=0	98-99°C
186	H	CF ₃	Cl	CF ₃	OMe	H	H	n=0	84-86°C
187	H	Cl	H	CF ₃	$\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$	H	H	n=0	59°C
188	H	Cl	$\text{CH}_2\text{CH}=\text{CH}_2$	CF ₃	H	H	H	n=0	aceite
189	H	Cl	H	CF ₃	$\text{CH}_2\text{C}(\text{Me})=\text{CH}_2$	H	H	n=0	68-70°C
190	H	Cl	$\text{CH}_2\text{C}(\text{Me})=\text{CH}_2$	CF ₃	H	H	H	n=0	aceite
191	H	CF ₃	Cl	CF ₃	Br	H	H	n=0	88-89°C
192		Br	CHF ₂	CF ₃	H	H	H	n=0	aceite
193		Cl	COCF ₃	CF ₃	H	H	H	n=0	aceite
194		Cl	CH(NH ₂)CF ₃	CF ₃	H	H	H	n=0	aceite












195		Cl	COOMe	CF ₃	H	H	H	n=0	aceite
196		Cl	CH ₂ CH=CH ₂	CF ₃	H	H	H	n=0	aceite
197		Cl	CH ₂ C(Me)=CH ₂	CF ₃	H	H	H	n=0	aceite
198		Cl	CH=N-OMe	CF ₃	H	H	H	n=0	aceite
199	CH ₂ CF ₃	Cl	CN	CF ₃	H	H	H	n=0	74-78°C
200	CH(Me)CH ₂ OMe	Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	aceite
201	CH ₂ CH(Me) OCH ₂ OMe	Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	aceite
202	CH ₂ CH ₂ OH	Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	95-97°C
203	CH ₂ CH(Me) OH	Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	104°C
204	CH ₂ SMe	Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	aceite
205	CH ₂ CH ₂ SEt	Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	aceite
206	CH ₂ CH ₂ SOEt	Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	aceite
207	CH ₂ CH ₂ SO ₂ Et	Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	117°C
208		CF ₃	Cl	CF ₃	Me	H	H	n=0	aceite
209	H	Cl	Cl	CF ₃	Br	H	H	n=0	102-103°C
210	CH ₂ CH (OMe) ₂	Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	aceite
211		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	aceite

235		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	aceite
236	CH ₂ CHO	Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	aceite
237	CH ₂ COMe	Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	80-81°C
238	CH ₂ CN	Cl	CN	CF ₃	H	H	H	n=0	85-86°C
239	CH ₂ CH ₂ COOH	Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	104°C
240	CH ₂ CH ₂ COOMe	Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	aceite
241	CN	Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	166-167°C
242		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	aceite
243		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	139°C
244		Cl	H	CF ₃	H	H	H	n=0	130-133°C
245		Cl	H	CF ₃	H	H	H	n=0	112-116°C
246		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	125°C
247		Cl	CN	CF ₃	H	H	H	n=0	131°C


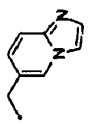



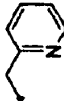
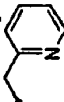
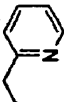
257		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	H	n=0	aceite
258		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	H	n=0	aceite
259		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	H	n=0	108°C
260		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	H	n=0	aceite
261		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	H	n=0	aceite
262		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	H	n=0	aceite
263		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	H	n=0	aceite
264		Cl	H	CF ₃	H	H	H	H	n=0	aceite
265		Cl	H	CF ₃	H	H	H	H	n=0	aceite
266		Cl	CN	CF ₃	H	H	H	H	n=0	127-128°C

276	SO ₂ Ph	Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	106-108°C
277		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	124-126°C
278	H	CF ₃	Br	CF ₃	H	H	H	n=0	158-159°C
279		Cl	Cl	CF ₃	H	Me	H	n=0	aceite
280		Cl	CN	CF ₃	H	Me	H	n=0	aceite
281	H	CF ₃	H	CF ₃	Cl	Me	H	n=0	63-64°C
282	H	CF ₃	Cl	CF ₃	H	Me	H	n=0	125-127°C
283	Me	CF ₃	Cl	CF ₃	H	Me	H	n=0	aceite
284	H	Cl	CN	CF ₃	H	Me	Me	n=0	98-102°C
285		Cl	CN	CF ₃	H	Me	Me	n=0	99-101°C
286	H	CF ₃	CN	CF ₃	H	H	H	n=0	122-123°C
287		CF ₃	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	aceite
288		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	n=0	aceite
289		Cl	CN	CF ₃	H	H	H	n=0	amorfo

290		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	5-Me	88-89°C
291		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	5-F	aceite
292		CF ₃	Cl	CF ₃	H	H	H	5-F	amorfo
293		Cl	CN	CF ₃	H	H	H	6-Me	aceite
294		OMc	Cl	CF ₃	H	H	H	6-OMe	aceite
295		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	6-OMe	aceite
296		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	6-OMe	aceite
297		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	6-Br	aceite
298		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	6-F	aceite
299		CF ₃	Cl	CF ₃	H	H	H	6-F	aceite
300		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	6-(2-piridil)	97-99°C
301		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	6-Ph	aceite

302		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	H	6- (2-piridiloxi)	aceite
303		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	H	6-NH ₂	82-85°C
304		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	H	6-COOMe	aceite
305		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	H	6-COOH	aceite
306		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	H	6-CN	aceite
307		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	H	3, 5-Me. 4-OMe	73-75°C
308		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	H	n=0	aceite
309		Cl	CN	CF ₃	H	H	H	H	n=0	126°C
310		CF ₃	Cl	CF ₃	H	H	H	H	n=0	aceite
311		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	H	n=0	aceite
312		CF ₃	Cl	CF ₃	H	H	H	H	n=0	aceite

313		Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	H	n=0	aceite
314		CF ₃	CN	CF ₃	H	H	H	H	n=0	70-71°C
315	CH ₂ CH(OMe) ₂	CF ₃	Br	CF ₃	H	H	H	H	n=0	
316		Cl	CN	CF ₃	H	H	H	H	n=0	89-90°C
317		CF ₃	Br	CF ₃	H	H	H	H	n=0	104-105°C
318		CF ₃	Br	CF ₃	H	H	H	H	n=0	aceite
319		CF ₃	CN	CF ₃	H	H	H	H	n=0	84-85°C
320		CF ₃	CN	CF ₃	H	Me	H	H	n=0	aceite
321		NMC ₂	CN	CF ₃	H	H	H	H	n=0	aceite
322	H	Cl	CN	CF ₃	H	H	H	H	6-piperidino	90-92°C
323	H	Cl	CN	CF ₃	H	H	H	H	6-morfolinilo	150-152°C
324		Cl	CN	CF ₃	H	H	H	H	n=0	aceite
325		Cl	CN	CF ₃	H	H	H	H	6-piperidino	91°C

326		Cl	CN	CF ₃	H	H	H	H	6-morfolinilo	94°C
327		Cl	CN	CF ₃	H	H	H	n=0		123-124°C
328	H	Cl	CN	CF ₃	H	H	Me	H	6-Me	118-119°C
329		Cl	CN	CF ₃	H	H	Me	H	6-Me	aceite
330	Hidrocloruro del Núm. de Compuesto 24									
331	Hidrocloruro del Núm. de Compuesto 103									
332	Hidrocloruro del Núm. de Compuesto 314									
333	COOMe	Cl	Cl	CF ₃	H	H	H	H	n=0	
334	COOEt	CF ₃	Br	CF ₃	H	H	Me	H	n=0	
335		Cl	CN	CF ₃	H	H	- (CH ₂) ₃ -	n=0		
336		Cl	H	CF ₃	H	H	H	n=0		
337		CN	CN	CF ₃	H	H	H	n=0		
338		CF ₃	CN	CF ₃	H	H	Et	n=0		
339		CF ₃	CHF ₂	CF ₃	H	H	H	n=0		

340		CF ₃	Cl	CF ₃	H	H	H	H	n=0	
-----	---	-----------------	----	-----------------	---	---	---	---	-----	--

ES 2 370 534 T3

TABLA 2

Núm.	RMN H1 (δ ppm (Disolvente: CDCl ₃ /400MHz)
4	4,83 (4 H, s), 7,18 (2 H, dd, J = 5,2,6, 8 Hz), 7,47 (2 H, d, J = 8,0 Hz) 7,66 (1 H, td, J = 8,0, 2,0 Hz, 8,54 (2 H, d, J = 5, 2 Hz)
7	5,01 (4 H, s), 6,73 (1 H, s), 6,79 (1 H, s), 6,78 (1H d, J = 5,6 Hz), 7,18 (2 H, dd, J = 8,0, 5,2 Hz), 7,22 (2 H, d, J = 8,0 Hz), 7,62 (2 H, ddd, J = 8,0, 7,2, 2,0 Hz), 8,30 (1 H, d, J = 5,6 Hz), 8,57 (2 H, d, J = 5, 2 Hz)
9	(Disolvente: DMSO - d ₆ 5,12 (4 H, s ancho), 7,24 (1 H, s), 7,29 (4 H, s ancho), 7,75 (2 H, s ancho), 8,51 (2 H, s ancho), 8,95 (1 H, s)
15	4,74 (2 H, d, J = 5,2 Hz), 6,06 (1 H, s), 6,82 (1 H, s), 7,19 - 7,24 (1 H, m), 7,30 - 7,45 (6 H, m), 7,69 (1 H, td, J = 7,6, 1,7 Hz), 8,11 (1 H, s), 8,60 (1 H, d, J = 5, 2 Hz)
17	5,06 (4 H, s), 6,96 (1 H, s), 7,17 - 7,24 (4 H, m), 7,64 (2 H, td, J = 7,6, 1,7 Hz), 8,56 (1 H, s), 8,57 - 8,58 (2 H, m)
18	4,98 (4 H, s), 6,83 (1 H, s), 7,18 - 7,20 (2 H, m), 7,21 (2 H, d, J = 8,0 Hz), 7,63 (2 H, td, J = 7,7, 1,5 Hz), 8,23 (1 H, s), 8,7 (2 H, d, J = 4,8 Hz)
23	4,66 (2 H, s), 4,70 (2 H, s), 7,18 (1 H, dd, J = 8,0, 5,2 Hz), 7,24 - 7,31 (5 H, m), 7,40 (1 H, d, J = 7,6 Hz), 7,67 (1 H, td, J = 8,0, 2,0 Hz), 8,55 (1 H, d, J = 8,0 Hz)
27	2,58 (3 H, s), 4,69 (2 H, d, J = 4,8 Hz), 6,61 (1 H, s ancho), 6,67 (1 H, s), 7,23 - 7,26 (1 H, m), 7,32 (1 H, d, J = 8,0 Hz), 7,70 (1H td, J = 7,7, 1,9 Hz), 8,56 (1 H, d, J = 4,8 Hz)
29	2,56 (3 H, s) 4,99 (4 H, s), 6,71 (1 H, s), 7,20 - 7,24 (4 H, m), 7,65 (2 H, td, J = 7,7, 1,7 Hz), 8,56 (2 H, d, J = 4,4 Hz)
32	2,58 (3 H, s), 4,71 (4 H, s), 7,05 (1 H, s), 7,17 (2 H, dd, J = 7,2, 4,8 Hz), 7,26 (2 H, d, J = 5,2 Hz), 7,63 (2 H, td, J = 7,7, 1,9 Hz), 8,53 (2H d, J = 5,2 Hz)
35	5,02 (4 H, s ancho), 6,83 (1 H, s), 7,22 - 7,34 (4 H, m), 7,68 (2 H, td, J = 7,7, 1,9 Hz), 8,57 (2 H, d, J = 4,4 Hz)
36	4,84 (4 H, s), 6,95 (1 H, s), 7,20 (2 H, ddd, J = 7,2, 4,8, 0,9 Hz), 7,30 (2 H, d, J = 7,6 Hz), 7,67 (2 H, td, J = 7,7, 1,6 Hz), 8,53 (2 H, dt, J = 4,8, 1,0 Hz)
38	4,90 (4 H, s), 7,08 (1 H, s), 7,17 (2 H, dd, J = 7,2, 5,2 Hz), 7,47 (2 H, d, J = 7,2 Hz), 7,66 (2 H, td, J = 7,7, 1,7 Hz), 8,54 (2 H, d, J = 4,8 Hz)
39	5,02 (4 H, s), 7,21 (2 H, ddd, J = 7,4, 5,0, 1,0 Hz), 7,41 (2 H, d, J = 8,0 Hz), 7,69 (2 H, td, J = 7,5, 1,7 Hz), 8,55 (2 H, dt, J = 5,2, 1,0 Hz)
42	4,99 (4 H, s), 6,60 (1 H, s), 6,78 (1 H, s), 7,20 (2 H, dd, J = 7,2, 4,8 Hz), 7,26 - 7,28 (2 H, m), 7,64 (2 H, td, J = 7,7, 1,9 Hz), 8,56 (2 H, dd, J = 5,0, 1,0 Hz)
43	4,96 (4 H, s), 6,75 (1 H, s), 7,20 (2 H, dd, J = 7,2, 4,8 Hz), 7,26 (2 H, d, J = 7,6 Hz), 7,65 (2 H, td, J = 7,7, 1,9 Hz), 8,56 (2 H, dt, J = 4,8, 1,0 Hz)
46	5,01 (4 H, s), 7,02 (1 H, s), 7,12 (1 H, s), 7,21 (2 H, dd, J = 7,8, 5,0 Hz), 7,26 (2 H, d, J = 8,0 Hz), 7,65 (2 H, td, J = 7,6, 1,9 Hz), 8,56 (2 H, dt, J = 4,8, 1,0 Hz)
48	4,98 (4 H, s), 7,17 (1 H, s), 7,20 - 7,25 (4 H, m), 7,66 (2 H, td, J = 7,8, 1,7 Hz), 8,56 (2 H, d, J = 4,8 Hz)
49	2,89 (3 H, s), 3,12 (3 H, s), 4,92 - 5,06 (4 H, m), 6,73 (1 H, s), 7,19 - 7,25 (4 H, m), 7,5 (2 H, td, J = 7,7, 1,9 Hz), 8,56 (2 H, dt, J = 5,2, 1,1 Hz)
50	1,57 (2 H, s ancho), 2,96 (2 H, t, J = 6,4 Hz), 3,69 (2 H, t, J = 6,4 Hz), 4,79 (2 H, s), 6,70 (1 H, s), 8,16 (1 H, t ancho, J = 5,0 Hz), 8,20 (1 H, d, J = 8,0 Hz), 8,61 (1 H, td, J = 7,6, 1,5 Hz), 8,51 (1 H, d, J = 4,4 Hz)
52	0,67 (3 H, d, J = 6,4 Hz), 1,18 (3 H, d, J = 6,4 Hz), 1,26 (1 H, t, J = 7,2 Hz), 2,53 (1 H, d, J = 8,8 Hz), 4,98 (4 H, d, J = 3,6 Hz), 6,73 (1 H, s) 7,20 (2 H, dd, J = 7,2, 4,8 Hz), 7,25 - 7,26 (2 H, m), 7,64 (2 H, td, J = 7,6, 1,7 Hz), 8,56 (2 H, d, J = 4,8 Hz)
53	4,80 (2 H, s), 4,94 (2 H, s), 6,72 (1 H, s), 7,18 (1 H, d, J = 8,0 Hz), 7,22 (2 H, dd, J = 7,4, 5,0 Hz), 7,26 - 7,29 (1 H, m), 7,63 - 7,68 (2 H, m), 8,54 - 8,58 (3 H, m)
54	4,83 (2 H, s), 4,93 (2 H, s), 6,69 (1 H, s), 7,17 (2 H, d, J = 6,0 Hz), 7,21 - 7,24 (2 H, m), 7,66 (1 H, td, J = 7,7, 1,9 Hz), 8,56 (1 H, d, J = 5,2 Hz), 8,56 (1 H, d, J = 6,4 Hz)

ES 2 370 534 T3

Núm.	RMN H1 (δ ppm (Disolvente: CDCl ₃ /400MHz)
55	4,22 (2 H, d, J = 4, 8 Hz), 4,84 (2 H, s), 5,20 (1 H, dd, J = 28,6, 1,4 Hz), 5,21 (1 H, s), 5,79 - 5,86 (1 H, m), 6,69 (1 H, s), 7,19 - 7,26 (2 H, m), 7,65 (1 H, t, J = 6,8 Hz), 8,56 (1 H, d, J = 4,0 Hz)
57	5,01 (2 H, s), 5,15 (2 H, s), 6,93 (1 H, s), 7,17 - 7,20 (1 H, m), 7,22 - 7,29 (1 H, m), 7,39 (1 H, d, J = 8,0 Hz), 7,51 (1 H, dd, J = 7,6, 6,4 Hz), 7,60 - 7,70 (2 H, m), 7,79 (1 H, d, J = 7,6 Hz), 8,02 (1 H, d, J = 8,8 Hz), 8,10 (1 H, d, J = 8,0 Hz), 8,56 (1 H, d, J = 4, 4 Hz)
58	4,97 (4 H, s), 6,35 (1 H, d, J = 2,0 Hz), 6,57 (1 H, s), 7,19 (2 H, dd, J = 8,0, 4,8 Hz), 7,24 (2 H, d, J = 7,6 Hz), 7,64 (2 H, td, J = 7,7, 1,7 Hz), 8,56 (2 H, dd, J = 4,8, 0,8 Hz)
59	4,96 (2 H, s), 5,04 (2 H, s), 7,14 - 7,25 (2 H, m), 7,61 (1 H, d, J = 7,6 Hz), 7,69 (1 H, td, J = 7,2, 1,2 Hz), 8,56 (1 H, dd, J = 4,8, 1,0 Hz), 8,67 (2 H, d, J = 4,8 Hz)
62	2,67 (6 H, s), 2,53 (2 H, t, J = 6,8 Hz), 3,75 (2 H, t, J = 6,8 Hz), 4,83 (2 H, s), 6,70 (1 H, s), 7,19 - 7,23 (2 H, m), 7,64 (1 H, td, J = 7,6, 1, 7 Hz), 8,57 (1 H, d, J = 4,8 Hz)
63	4,96 (4 H, s), 6,72 (1 H, s), 7,20 (2 H, dd, J = 7,8, 5,0 Hz), 7,24 (2 H, d, J = 7,6 Hz), 7,64 (2 H, td, J = 7,8, 2,0 Hz), 8,56 (2 H, d, J = 4,8 Hz)
64	2,51 (4 H, s ancho), 2, 59 (2 H, t, J = 6,4 Hz), 3,67 (4 H, s ancho), 3,79 (2 H, t, J = 6,4 Hz), 4,82 (2 H, s), 6,70 (1 H, s), 7,19 - 7,24 (2 H, m), 7,64 (1 H, td, J = 7,6, 1,7 Hz), 8,57 (1 H, d, J = 4, 8 Hz)
65	1,58 (9 H, s), 4,79 (2 H, s), 6,49 (1 H, s), 6,77 (1 H, s), 7,19 (1 H, dd, J = 7,6, 5,2 Hz), 7,24 (1 H, d, J = 7,6 Hz), 7,66 (1 H, td, J = 7,6, 2,0 Hz), 8,59 (1 H, dd, J = 4,8, 1,2 Hz)
67	1,78 (3 H, d, J = 6,8 Hz), 4,62 (2 H, s), 5,29 (1 H, c, J = 6,8 Hz), 7, 10 (1 H, dd, J = 6,8, 4,8 Hz), 7,21 (1 H, dd, J = 8,4, 2,8 Hz), 7,28 (1 H, d, J = 2, 8 Hz), 7,51 - 7,56 (2 H, m), 7,65 (1 H, td, J = 8,0, 2,0 Hz), 8,47 (1 H, dd, J = 4,0, 1,2 Hz), 8,55 (1 H, dd, J = 4,0, 2,0 Hz)
70	1,68 (3 H, d, J = 6,8 Hz), 4,11 (1 H, d, J = 6,8 Hz), 4,14 (1 H, d, J = 6,8 Hz), 6,12 - 6,13 (1 H, m), 6,61 (1 H, s), 7,02 (1 H, d, J = 8,0 Hz), 7,12 - 7,17 (2 H, m), 7,34 (1 H, d, J = 7,6 Hz), 7,53 - 7,57 (1 H, m), 7,59 - 7,6 3 (1 H, m), 8,51 - 8,55 (2 H, m)
71	5,03 (2 H, s), 5,04 (2 H, s), 6,84 (1 H, s), 7,18 - 7,22 (2 H, m), 7,36 (1 H, d, J = 4,8 Hz), 7,66 (1 H, td, J = 8,0, 2,0 Hz), 8,56 (1 H, dd, J = 4,8, 1,0 Hz), 8,69 (2 H, d, J = 4,8 Hz)
76	0,87 (3 H, d, J = 6,8 Hz), 0,99 (3 H, d, J = 6, 8 Hz), 2,85 - 2,91 (1 H, m), 4,72 (1 H, d, J = 17,6 Hz), 5,25 (1 H, d, J = 17,6 Hz), 5,75 - 5,85 (1 H, m), 6,16 (1 H, d, J = 7,6 Hz), 6,61 (1 H, s), 7,00 (1 H, dd, J = 6,8, 5, 6 Hz), 7,09 - 7,12 (1 H, m), 7,22 - 7,28 (1 H, m), 7,46 (1 H, d, J = 7,6 Hz), 7,60 - 7,64 (1 H, m), 8,40 (1 H, dd, J = 4,8, 0,8 Hz), 8,44 (1 H, dd, J = 2,0, 1,2 Hz)
79	0,91 (3 H, t, J = 7,2 Hz), 2 - 04 - 2,11) (1 H, m), 2,25 - 2,34 (1 H, m), 4,82 (1 H, d, J = 17,6 Hz), 4,92 (1 H, d, J = 17,6 Hz), 5,89 - 5,95 (1 H, m), 6,65 (1 H, s), 6,80 (1 H, d, J = 7,6 Hz), 7,08 - 7,16 (2 H, m), 7,41 (1 H, d, J = 8,0 Hz), 7,44 - 7,48 (1 H, m), 7,61 (1 H, td, J = 8,0, 2,0 Hz), 8,50 (2 H, ddd, J = 2,8, 2,0, 0,8 Hz)
80	2,25 (1 H, t, J = 2,6 Hz), 4,43 (2 H, d, J = 2,4 Hz), 4,91 (2 H, s), 6,84 (1 H, s), 7,21 (1 H, dd, J = 6,8, 5,2 Hz), 7,29 (1 H, d, J = 8,0 Hz), 7,66 (1 H, td, J = 7,8, 2,0 Hz), 8,56 - 8,58 (1 H, m)
81	2,85 (6 H, s), 4,95 (4 H, s), 6, 36 (1 H, s), 7,16 - 7,19 (2 H, m), 7,21 (2 H, d, J = 8,0 Hz), 7,62 (2 H, td, J = 7,7, 1,6 Hz), 8,55 - 8,57 (2 H, m)
82	3,71 (3 H, s), 5,09 (2 H, s), 7,21 (2 H, dd, J = 7,6, 5,4 Hz), 7,24 (1 H, s), 7,28 - 7,32 (1 H, m), 7,65 (1 H, td, J = 7,6, 1,7 Hz), 8,58 (1 H, d, J = 3,6 Hz)
83	5,05 (4 H, s ancho), 6,95 (1 H, s), 7,20 - 7,23 (4 H, m), 7,65 (2 H, td, J = 7, 6, 1,7 Hz), 8,54 (1 H, s), 8,57 (2 H, d, J = 4,4 Hz)
86	0,46 - 0,52 (3 H, m), 0,71 - 0,75 (1 H, m), 1,59 - 1,64 (1 H, m), 4,84 (1 H, d, J = 17,2 Hz), 5,10 - 5,14 (1 H, m), 5,12 (1 H, d, J = 17,2 Hz), 6,61 (1 H, s), 7,13 - 7,20 (3 H, s), 7,45 (1 H, d, J = 8,0 Hz), 7,56 (1 H, dd, J = 8,0, 1,6 Hz), 7,64 (1 H, td, J = 7,6, 2,0 Hz), 8,54 (2 H, dd, J = 4,8, 1,4 Hz)
90	4,98 (4 H, s), 6,64 (1 H, s), 6,92 (1 H, s), 7,17 - 7,20 (2 H, m), 7,25 - 7,2 7 (2 H, m), 7,63 (2 H, td, J = 8,0, 2,0 Hz), 8, 55 - 8, 57 (2 H, m)

ES 2 370 534 T3

Núm.	RMN H1 (δ ppm (Disolvente: CDCl ₃ /400MHz)
91	5,32 (2 H, s ancho), 7,20 - 7,23 (2 H, m), 7,34 (1 H, s ancho), 7,60 (1 H, d, J = 4,8 Hz), 7,67 (1 H, t, J = 7,4 Hz), 8,54 (1 H, d, J = 4,4 Hz), 8,80 (2 H, d, J = 5,2 Hz)
94	4,98 (4 H, s), 6,87 (1 H, s), 7,17 - 7,20 (2 H, m), 7,23 - 7,25 (2 H, m), 7,63 (2 H, td, J = 7,6, 2,0 Hz), 8,56 (2 H, dd, J = 4,8, 1,0 Hz)
95	5,04 (4 H, s), 6,71 (1 H, s), 7,19 - 7,23 (4 H, m), 7,65 (2 H, td, J = 7,8, 1,6 Hz), 8,56 (2 H, d, J = 4,0 Hz)
96	4,96 (2 H, s), 5,03 (2 H, s), 6,85 (1 H, s), 7,19 - 7,22 (1 H, m), 7,24 - 7,29 (1 H, m), 7,63 - 7,69 (1 H, m), 8,49 - 8,57 (3 H, m), 8,62 (1 H, s)
97	1,66 (3 H, d, J = 6,8 Hz), 4,58 (2 H, s), 6,25 (1 H, c, J = 6,8 Hz), 6,60 (1 H, s), 6,99 (1 H, d, J = 8,4 Hz), 7,14 - 7,17 (1 H, m), 7,23 (1 H, dd, J = 8,0, 9,8 Hz), 7,27 - 7,59 (1 H, m), 7,65 (1 H, d, J = 8,0 Hz), 8,52 (2 H, dd, J = 4,8, 1,2 Hz), 8,63 (1 H, s ancho)
102	2,51 (3 H, s), 4,98 (4 H, s), 6,66 (1 H, s), 7,16 - 7,23 (4 H, m), 7,59 - 7,64 (2 H, m), 8,56 (2 H, dd, J = 4,8, 1,2 Hz)
104	4,92 (4 H, s), 7,16 - 7,19 (2 H, m), 7,29 (2 H, d, J = 8,0 Hz), 7,63 - 7,67 (2 H, m), 8,53 - 8,57 (2 H, m)
107	4,77 (2 H, s), 4,91 (2 H, s), 6,73 (1 H, s), 7,17 (1 H, d, J = 7,6 Hz), 7,21 - 7,26 (1 H, m), 7,28 (1 H, d, J = 7,6 Hz), 7,60 - 7,68 (2 H, m), 8,32 (1 H, d, J = 2,0 Hz), 8,56 (1 H, ddd, J = 4,8, 2,0, 1,2 Hz)
108	4,85 (2 H, s), 5,27 (2 H, s), 6,72 (1 H, s), 7,19 - 7,23 (1 H, m), 7,26 - 7,28 (1 H, m), 7,34 (1 H, d, J = 8,0 Hz), 7,43 - 7,49 (1 H, m), 7,56 - 7,60 (1 H, m), 7,64 - 7,68 (1 H, m), 8,13 (1 H, dd, J = 8,0, 0,8 Hz), 8,54 (1 H, dd, J = 8,0, 0,8 Hz)
110	5,04 (4 H, s), 6,93 (1 H, s), 7,09 (1 H, s), 7,18 - 7,21 (2 H, m), 7,30 (2 H, d, J = 7,6 Hz), 7,63 (2 H, td, J = 7,7, 1,9 Hz), 8,56 (2 H, dt, J = 4,0, 1,0 Hz)
111	1,68 (3 H, d, J = 6,8 Hz), 4,73 (1 H, d, J = 17,2 Hz), 4,79 (1 H, d, J = 17,2 Hz), 5,81 - 5,83 (1 H, m), 6,62 (1 H, s), 7,16 - 7,21 (2 H, m), 7,30 (1 H, d, J = 8,0 Hz), 7,42 (1 H, dd, J = 8,0, 2,4 Hz), 7,61 - 7,65 (1 H, m), 8,15 (1 H, d, J = 2,4 Hz), 8,54 (1 H, d, J = 4,8 Hz)
114	3,81 (3 H, s), 5,01 (4 H, s), 6,41 (1 H, s), 7,20 - 7,23 (4 H, m), 7,66 (2 H, td, J = 7,7, 1,5 Hz), 8,57 - 8,58 (2 H, m)
115	5,01 (4 H, s ancho), 6,82 (1 H, s), 7,22 - 7,25 (4 H, m), 7,67 (2 H, td, J = 7,7, 1,9 Hz), 8,57 (2 H, d, J = 3,6 Hz)
116	4,84 (2 H, s), 4,99 (2 H, s), 6,98 (1 H, s), 7,19 - 7,28 (3 H, m), 7,65 (2 H, td, J = 7,7, 1,9 Hz), 8,54 - 8,57 (3 H, m)
134	2,29 (3 H, s), 5,04 (4 H, s), 7,06 (1 H, s), 7,18 - 7,22 (2 H, m), 7,30 (2 H, d, J = 7,2 Hz), 7,61 - 7,67 (2 H, m), 8,56 (2 H, d, J = 4,0 Hz)
135	2,97 (3 H, s), 5,07 (4 H, s ancho), 7,18 (1 H, s), 7,21 - 7,24 (2 H, m), 7,30 - 7,52 (2 H, m), 7,66 (2 H, td, J = 7,7, 1,7 Hz), 8,56 (2 H, d, J = 4,4 Hz)
136	5,55 (2 H, s), 7,17 - 7,21 (2 H, m), 7,29 (1 H, d, J = 6,0 Hz), 7,62 - 7,72 (2 H, m), 7,73 (1 H, s), 7,98 (1 H, d, J = 8,0 Hz), 8,50 (1 H, dd, J = 2,4, 1,2 Hz), 8,60 (1 H, dd, J = 2,0, 1,2 Hz)
137	4,85 (2 H, s), 4,89 (2 H, s), 6,70 (1 H, s), 7,18 - 7,37 (7 H, m), 7,63 (1 H, td, J = 7,6, 2,0 Hz), 8,56 (1 H, d, J = 2,0 Hz)
138	1,31 (3 H, t, J = 7,6 Hz), 2,97 (2 H, c, J = 7,6 Hz), 5,41 (2 H, s), 7,16 - 7,21 (2 H, m), 7,64 (1 H, td, J = 7,6, 2,0 Hz), 8,37 (1 H, s), 8,54 (1 H, d, J = 4,8 Hz)
139	3,42 (3 H, s), 4,67 (2 H, s), 4,76 (2 H, s), 4,93 (2 H, s), 4,97 (2 H, s), 6,84 (1 H, s), 7,14 (1 H, d, J = 8,0 Hz), 7,20 (1 H, dd, J = 8,0, 4,8 Hz), 7,25 (1 H, d, J = 7,2 Hz), 7,34 (1 H, d, J = 8,0 Hz), 7,61 - 7,67 (2 H, m), 8,56 (1 H, dd, J = 4,8, 0,8 Hz)
140	3,66 (1 H, t, J = 4,8 Hz), 4,73 (2 H, s), 4,96 (4 H, s), 6,80 (1 H, s), 7,13 - 7,25 (4 H, m), 7,62 - 7,67 (2 H, m), 8,56 (1 H, d, J = 4,0 Hz)
141	1,03 (9 H, s), 3,59 (2 H, s), 4,87 (2 H, s), 6,71 (1 H, s), 7,09 (1 H, d, J = 7,6 Hz), 7,17 (1 H, dd, J = 8,8, 6,0 Hz), 7,60 (1 H, td, J = 8,0, 2,0 Hz), 8,55 (1 H, dd, J = 2,0, 0,8 Hz)
142	1,49 (6 H, s), 4,10 (2 H, s), 4,11 (2 H, s), 6,44 (1 H, s), 6,95 (1 H, d, J = 8,0 Hz), 7,07 -

ES 2 370 534 T3

Núm.	RMN H1 (δ ppm (Disolvente: CDCl ₃ /400MHz)
	7,13 (2 H, m), 7,28 (1 H, d, J = 8,0 Hz), 7,51 - 7,57 (2 H, m), 8,48 (1 H, dd, J = 4,0, 0,8 Hz), 8,57 (1 H, dd, J = 3,2, 0,8 Hz)
145	1,62 - 1,64 (1 H, m), 1,71 - 1,80 (1 H, m), 1,93 - 1,98 (1 H, m), 2,20 - 2,26 (1H m), 2,42 (3 H, s), 2,60 - 2,62 (1 H, m), 3,06 - 3,10 (1 H, m), 3,49 (dd, 1H J = 7, 2, 14,8 Hz), 3,85 - 3,86 (1 H, m), 4,85 (1 H, d, J = 17,2 Hz), 4,95 (1 H, d, J = 17,2 Hz), 6,78 (1 H, s), 7,14 - 7,20 (2 H, m), 7,62 (dt, 1 H, J = 5,2, 8,0 Hz), 8,56 (1 H, d, J = 1,2, 4,8 Hz)
146	3,81 (3 H, s), 4,89 (2 H, s), 5,08 (2 H, s), 7,01 (1 H, s), 7,11 - 7,19 (3 H, m), 7,25 (1 H, d, J = 8,4 Hz), 7,62 (1 H, dt, J = 1,6, 0,8 Hz), 8,09 (1 H, dd, J = 4,4, 1,6 Hz), 8,53 (1 H, d, J = 4,8 Hz)
147	2,36 (3 H, s), 4,96 (4 H, d, J = 5,6 Hz), 6,79 (1 H, s), 7,10 (1 H, dd, J = 8,0, 4,8 Hz), 7,17 (1 H, m), 7,23 (1 H, d, J = 8,0 Hz), 7,45 (1 H, d, J = 8,0 Hz), 7,61 (1 H, dt, J = 8,0, 2,0 Hz), 8,35 (1 H, d, 3,6 Hz), 8,54 (1 H, dd, J = 4,8, 0,8 Hz)
148	3,28 (3 H, s), 3,60 (2 H, t, J = 5,2 Hz), 3,83 (2 H, t, J = 5,2 Hz), 4,89 (2 H, s), 6,78 (1 H, s), 7,21 - 7,27 (2 H, m), 7,67 (1 H, t, J = 2,0 Hz), 8,55 (1 H, d, J = 0,8 Hz)
149	3,00 (1 H, dd, J = 17,6, 8,0 Hz), 3,29 (1 H, dd, 17,6, 10,8 Hz), 3,84 - 3,89 (1 H, m), 4,07 - 4,13 (1 H, m), 4,87 (2 H, s), 5,09 - 5,16 (1 H, m), 6,75 (1 H, s), 7,21 - 7,27 (2 H, m), 7,69 (1 H, dt, J = 8,0, 1,2 Hz), 8,54 (1 H, d, 4,8 Hz)
151	2,37 (3 H, s), 4,80 (2 H, s), 4,86 (2 H, s), 5,94 (1 H, s), 6,82 (1 H, s), 7,19 - 7,24 (2 H, m), 7,65 (1 H, dt, J = 7,6, 1,6 Hz), 7,55 (1 H, d, J = 4 Hz)
152	3,88 (3 H, s), 4,72 (2 H, s), 5,08 (2 H, s), 6,67 (1 H, s), 6,79 (1 H, s), 6,96 (1 H, d, J = 7,6 Hz), 7,16 (1 H, 1 H, dd, J = 5,2, 2, 2 Hz), 7,32 (1 H, s), 7,58 (1 H, dd, J = 5,6, 8,0), 8,51 (1 H, d, J = 5,2 Hz)
154	2,52 (3 H, s), 4,94 (2 H, s), 5,02 (2 H, s), 7,04 (1 H, d, J = 8,0 Hz), 7,05 (1 H, d, J = 8,0 Hz), 7,14 (1 H, s), 7,20 (1 H, dd, J = 7,2, 4,8 Hz), 7,29 (1 H, d, J = 7,6 Hz), 7,51 (1 H, t, J = 7,6 Hz), 7,64 (1 H, td, J = 7,6, 1,2 Hz), 8,56 (1 H, d, J = 4,8 Hz)
155	2,52 (3 H, s), 4,89 (2 H, s), 4,98 (2 H, s), 6,85 (1 H, s), 7,01 (1 H, d, J = 7,2 Hz), 7,05 (1 H, d, J = 7,6 Hz), 7,20 (1 H, t, J = 6,4 Hz), 7,25 (1 H, d, J = 6,4 Hz), 7,51 (1 H, t, J = 7,6 Hz), 7,64 (1 H, t, J = 8,0 Hz), 8,56 (1 H, d, J = 4,8 Hz)
157	3,82 (3 H, s), 4,90 (2 H, s), 4,96 (2 H, s), 6,72 (1 H, dd, J = 5,2, 2,4 Hz), 6,79 (1 H, s), 6,82 (1 H, d, J = 2,0 Hz), 7,20 (1 H, dd, J = 7,6, 5,2 Hz), 7,64 (1 H, td, J = 8,0, 2,0 Hz), 7,64 (1 H, td, J = 8,0, 2,0 Hz), 8,37 (1 H, d, J = 5,6 Hz), 8,56 (1 H, d, J = 5,2 Hz)
161	2,31 (3 H, s), 4,91 (2 H, s), 4,96 (2 H, s), 6,80 (1 H, s), 7,01 (1 H, d, J = 5,2 Hz), 7,05 (1 H, s), 7,20 (1 H, ddd, J = 5,2, 4,8, 0,8 Hz), 7,25 (1 H, d, J = 8,0 Hz), 7,64 (1 H, td, J = 8,0, 2,0 Hz), 8,40 (1 H, d, J = 5,2 Hz), 8,56 (1 H, ddd, J = 4,8, 1,6, 0,8 Hz)
162	2,52 (6 H, s), 4,91 (4 H, s), 6,87 (1 H, s), 7,02 (2 H, d, J = 8,0 Hz), 7,04 (2 H, d, J = 8,0 Hz), 7,51 (2 H, t, J = 8,0 Hz)
164	1,69 (3 H, d, J = 7,6 Hz), 4,79 (1 H, d, J = 17,6 Hz), 4,99 (1 H, d, J = 17,2 Hz), 6,14 (1 H, s ancho), 6,89 (1 H, s), 7,05 (1 H, d, J = 7,6 Hz), 7,14 - 7,17 (2 H, m), 7,35 (1 H, d, J = 8,0 Hz), 7,54 - 7,63 (2 H, m), 8,54 (2 H, t, J = 2,4 Hz)
165	1,68 (3 H, d, J = 7,2 Hz), 4,65 (2 H, s), 6,26 (1 H, c, J = 6,8 Hz), 6,88 (1 H, s), 6,99 (1 H, d, J = 7,6 Hz), 7,17 (1 H, dd, J = 7,4, 5,0 Hz), 7,21 - 7,24 (1 H, m), 7,58 (1 H, td, J = 7,6, 1,7 Hz), 7,66 (1 H, d, J = 7,4 Hz), 8,50 (1 H, dd, J = 4,6, 1,8 Hz), 8,52 - 8,54 (1 H, m), 8,68 (1 H, d, J = 2,4 Hz)
166	1,24 (3 H, t, J = 7,2 Hz), 3,71 (2 H, c, J = 7,2 Hz), 4,84 (2 H, s), 6,92 (2 H, s), 7,20 (1 H, dd, J = 7,0, 4,8 Hz), 7,25 (1 H, d, J = 7,6 Hz), 7,64 (1 H, td, J = 7,6, 1,6 Hz), 8,56 (1 H, d, J = 4,4 Hz)
167	5,00 (4 H, s), 6,83 (1 H, s), 6,98 (1 H, t, J = 53,4 Hz), 7,19 - 7,26 (4 H, m), 7,65 (2 H, td, J = 7,6, 1,6 Hz), 8,56 (2 H, d, J = 4,8 Hz)
168	5,02 (4 H, s), 6,84 (1 H, t, J = 14,4 Hz), 6,99 (1 H, s), 7,17 - 7,21 (2 H, m), 7,29 (2 H, d, J = 7,2 Hz), 7,61 - 7,66 (2 H, m), 8,55 - 8,56 (2 H, m)
170	2,36 (3 H, s), 5,01 (4 H, s), 6,95 (1 H, s), 7,16 - 7,21 (2 H, m), 7,28 (2 H, d, J = 8,0 Hz), 7,60 - 7,65 (2 H, m), 8,54 - 8,56 (2 H, m), 1,86 (3 H, t, J = 19,2 Hz), 4,98 (4 H, s), 6,99 (1 H, s), 7,18 - 7,23 (4 H, m), 7,63 (2 H, td, J = 7,7, 1,6 Hz), 8,57 (2 H, d, J = 4,8 Hz)

ES 2 370 534 T3

Núm.	RMN H1 (δ ppm (Disolvente: CDCl ₃ /400MHz)
171	2,36 (3 H, s), 5,01 (4 H, s), 6,95 (1 H, s), 7,16 - 7,21 (2 H, m), 7,28 (2 H, d, J = 8,0 Hz), 7,60 - 7,65 (2 H, m), 8,54 - 8,56 (2 H, m)
173	3,30 (3 H, s), 3,63 (2 H, t, J = 5,6 Hz), 3,87 (2 H, t, J = 4,8 Hz), 4,89 (2 H, s), 7,06 (1 H, s), 7,17 - 7,27 (2 H, m), 7,63 (1 H, dt, 7,2, 2,0 Hz), 8,53 (1 H, d, J = 4,8 Hz)
188	3,48 (2 H, d, J = 6,4 Hz), 4,66 (2 H, d, J = 4,8 Hz), 4,99 - 5,08 (2 H, m), 5,86 (1 H, m), 6,11 (1 H, s ancho), 6,69 (1 H, s), 7,20 - 7,24 (1 H, m), 7,32 (1 H, d, J = 8,0 Hz), 7,68 (1 H, td, J = 8,0, 2,0 Hz), 8,57 (1 H, d, J = 4,0 Hz)
190	1,83 (3 H, s), 3,39 (2 H, s), 4,22 (1 H, s), 4,67 (2 H, s), 4,78 (1 H, s), 6,13 (1 H, s ancho), 6,71 (1 H, s), 7,21 (1 H, m), 7,32 (1 H, d, J = 8,0 Hz), 7,69 (1 H, t, J = 7,6 Hz), 8,57 (1 H, d, J = 5,2 Hz)
192	5,00 (4 H, s), 6,85 (1 H, s), 6,99 (1 H, t, J = 13,2 Hz), 7,21 (2 H, dd, J = 7,0, 5,8 Hz), 7,26 (2 H, d, J = 2,4 Hz), 7,65 (2 H, td, J = 7,7, 1,9 Hz), 8,56 (2 H, d, J = 4,4 Hz)
193	5,02 (4 H, s), 6,84 (1 H, s), 7,23 (2 H, dd, J = 7,2, 4,8 Hz), 7,25 - 7,30 (2 H, m), 7,67 (2 H, td, J = 7,6, 1,7 Hz), 8,57 (2 H, d, J = 5,2 Hz)
194	4,99 (4 H, s), 5,35 (1 H, s ancho), 6,85 (1 H, s), 7,21 (2 H, dd, J = 7,6, 4,8 Hz), 7,25 - 7,30 (2 H, m), 7,66 (2 H, td, J = 7,6, 1,7 Hz), 8,56 (2 H, d, J = 4,0 Hz)
195	3,90 (3 H, s), 5,00 (4 H, s), 6,71 (1 H, s), 7,16 - 7,26 (4 H, m), 7,62 - 7,69 (2 H, m), 8,52 - 8,56 (2 H, m)
196	3,48 (2 H, d, J = 6,0 Hz), 4,96 (2 H, s), 4,98 (2 H, s), 5,00 - 5,06 (2 H, m), 5,86 (1 H, m), 6,71 (1 H, s), 7,17 - 7,20 (2 H, m), 7,25 - 7,27 (2 H, m), 1,63 (2 H, m), 8,55 (2 H, d, J = 5,2 Hz)
197	1,82 (3 H, s), 3,38 (2 H, s), 4,22 (1 H, s), 4,78 (1 H, s), 4,97 (2 H, s), 4,98 (2 H, s), 6,73 (1 H, s), 7,19 (2 H, t, J = 6,0 Hz), 7,25 - 7,28 (2 H, m), 7,63 (2 H, td, J = 8,0, 2,0 Hz), 8,56 (2 H, d, J = 4,8 Hz)
198	3,74 (3 H, s), 4,87 (4 H, s), 6,73 (1 H, s), 7,11 - 7,18 (4 H, m), 7,64 (dt, 2 H, J = 4,4 Hz, J = 8,0 Hz), 8,08 (1 H, s), 8,53 (2 H, d, J = 4,4 Hz)
200	1,25 (3 H, s), 3,23 (3 H, s), 3,39 - 3,54 (3 H, m), 4,73 (2 H, s), 6,61 (1 H, s), 7,16 - 7,27 (2 H, m), 7,62 (1 H, dt, J = 8,2 Hz), 8,57 (1 H, d, J = 4,8 Hz)
201	1,23 (3 H, s, J = 6,4 Hz), 3,29 (3 H, s), 3,64 (1 H, dd, J = 7,6, 14,8 Hz), 3,71 - 3,74 (1 H, m), 4,07 - 4,11 (1 H, m); 4,57 (1 H, d, J = 6,8 Hz), 4,65 (1 H, d, J = 6,8 Hz), 4,85 (1 H, d, J = 16,8 Hz), 4,97 (1 H, d, J = 16,8 Hz), 6,81 (1 H, s), 7,18 - 7,20 (2 H, m), 7,59 (1 H, dt, J = 5,2, 8,0 Hz), 8,56 (1 H, dd, J = 2,0, 5,6 Hz)
204	2,18 (3 H, s), 4,89 (2 H, s), 4,90 (2 H, s), 6,83 (1 H, s), 7,20 - 7,23 (1 H, m), 7,26 - 7,27 (1 H, m), 7,66 (1 H, dt, J = 4,0 Hz, J = 8,0 Hz), 8,57 (1 H, d, J = 4,0 Hz)
205	1,30 (3 H, t, J = 8,4 Hz), 2,63 (2 H, c, J = 8,4 Hz), 2,77 (2 H, t, J = 7,6 Hz), 3,82 - 3,86 (2 H, m), 4,81 (2 H, s), 6,69 (1 H, s), 7,20 - 7,23 (2 H, m), 7,65 (1 H, dt, J = 4,8 Hz, J = 8,0 Hz), 8,57 (1 H, d, J = 4,8 Hz)
206	1,37 (3 H, t, J = 8,4 Hz), 2,77 - 2,89 (2 H, m), 2,94 - 3,01 (1 H, m), 3,19 - 3,26 (1 H, m), 4,03 - 4,15 (1 H, m), 4,19 - 4,26 (1 H, m), 4,85 (2 H, s), 6,85 (1 H, s), 7,20 - 7,26 (2 H, m), 7,67 (1 H, dt, J = 4,8 Hz, J = 8,0 Hz), 8,55 (1 H, d, J = 4,8 Hz)
208	2,52 (3 H, s), 4,67 (4 H, s), 7,17 (2 H, dd, J = 6,8, 4,4 Hz), 7,45 (2 H, d, J = 8,0 Hz), 7,65 (2 H, td, J = 7,7, 1,7 Hz), 8,55 (2 H, d, J = 4,4 Hz)
210	3,42 (6 H, s), 3,77 (2 H, d, J = 4,8 Hz), 4,57 (1 H, t, J = 4,8 Hz), 4,86 (2 H, s), 6,78 (1 H, s), 7,18 - 7,21 (2 H, m), 7,64 (1 H, dt, J = 2,0 Hz, J = 9,2 Hz), 8,56 (1 H, d, J = 6,0 Hz)
211	1,42 (3 H, s), 1,46 (3 H, s), 4,06 - 4,13 (2 H, m), 4,15 - 4,21 (2 H, m), 4,60 - 4,68 (1 H, m), 5,11 (2 H, s), 6,66 (1 H, s), 7,18 - 7,30 (2 H, m), 7,65 (1 H, dt, J = 4,8 Hz, J = 8,0 Hz), 8,57 (1 H, d, J = 4,8 Hz)
213	3,30 (6 H, s), 3,79 - 3,87 (4 H, m), 4,51 (2 H, d, J = 6,8 Hz), 4,56 (2 H, d, J = 6,8 Hz), 4,85 (2 H, s), 5,07 (1 H, s ancho), 6,66 (1 H, s), 7,16 - 7,19 (1 H, m), 7,29 (1 H, d, J = 8,4 Hz), 7,61 (1 H, dt, J = 4,8 Hz, J = 8,4 Hz), 8,56 (1 H, d, J = 4,8 Hz)
214	1,84 - 1,87 (1 H, m), 3,33 (1 H, s), 3,40 (1 H, t, J = 6,4 Hz), 3,49 (1 H, t, J = 6,0 Hz), 6,58 (1 H, s), 7,18 - 7,30 (2 H, m), 7,60 (1 H, dt, 7,2, 2,0 Hz), 8,55 (1 H, d, J = 4,8 Hz)

ES 2 370 534 T3

Núm.	RMN H1 (δ ppm (Disolvente: CDCl ₃ /400MHz)
217	1,32 (3 H, t, J = 7,8 Hz), 2,61 - 2,71 (2 H, m), 3,35 (3 H, s), 3,73 - 3,81 (1 H, m), 4,15 - 4,20 (1 H, m), 4,67 - 4,70 (1 H, m), 4,88 (2 H, s), 6,78 (1 H, s), 7,18 - 7,21 (2 H, m), 7,64 (1 H, dt, J = 4,0 Hz, J = 8,0 Hz), 8,57 (1 H, d, J = 4,0 Hz)
218	1,20 - 1,33 (6 H, m), 2,68 - 2,79 (4 H, m), 4,00 (2 H, d, J = 7,2 Hz), 4,29 (1 H, t, J = 6,8 Hz), 4,89 (2 H, s), 6,71 (1 H, s), 7,18 - 7,22 (2 H, m), 7,64 (1 H, dt, J = 4,4 Hz, J = 8,0 Hz), 8,57 (1 H, d, J = 4,4 Hz)
219	1,26 (6 H, t, J = 7,8 Hz), 2,65 - 2,78 (4 H, m), 4,05 (2 H, d, J = 7,6 Hz), 4,35 (1 H, t, J = 7,2 Hz), 4,90 (2 H, s), 6,98 (1 H, s), 7,20 - 7,22 (2 H, m), 7,65 (1 H, dt, J = 5,2 Hz, J = 8,0 Hz), 8,57 (1 H, d, J = 5,2 Hz)
220	1,41 (6 H, t, J = 7,8 Hz), 3,18 - 3,21 (4 H, m), 4,30 (2 H, d, J = 6,0 Hz), 4,44 (1 H, t, J = 6,4 Hz), 4,84 (2 H, s), 6,85 (1 H, s), 7,20 - 7,25 (2 H, m), 7,68 (1 H, dt, J = 4,8 Hz, J = 8,0 Hz), 8,54 (1 H, d, J = 4,8 Hz)
221	4,27 (2 H, d, J = 6,0 Hz), 4,80 (2 H, s), 6,00 (1 H, t, J = 6,8 Hz), 6,73 (1 H, s), 7,23 - 7,27 (2 H, m), 7,69 (1 H, dt, J = 4,0 Hz, J = 8,0 Hz), 8,56 (1 H, d, J = 4,0 Hz)
225	1,55 (3 H, d, J = 7,6 Hz), 3,70 (3 H, s), 4,72 (2 H, d, J = 6,8 Hz), 5,20 (1 H, dd, J = 7,2 Hz, J = 14,8 Hz), 6,64 (1 H, s), 7,19 - 7,23 (1 H, m), 7,32 (1 H, d, J = 7,6 Hz), 7,65 (1 H, dt, J = 4,8 Hz, J = 8,0 Hz), 8,59 (1 H, d, J = 4,8 Hz)
226	0,87 (3 H, d, J = 6,0 Hz), 1,06 (3 H, d, J = 6,0 Hz), 2,41 - 2,50 (1 H, m), 3,61 (3 H, s), 4,71 (1 H, d, J = 17,6 Hz), 4,92 (1 H, d, J = 17,6 Hz), 5,10 (1 H, d, J = 10,4 Hz), 6,67 (1 H, s), 7,15 - 7,19 (2 H, m), 7,61 (1 H, dt, J = 5,2 Hz, J = 8,0 Hz), 8,55 (1 H, d, J = 5,2 Hz)
227	3,80 (3 H, s), 5,06 (2 H, s), 5,77 (1 H, s), 6,21 (1 H, s), 6,71 (1 H, s), 7,18 - 7,22 (1 H, m), 7,41 (1 H, d, J = 8,0 Hz), 7,66 (1 H, dt, J = 4,8 Hz, J = 8,0 Hz), 8,56 (1 H, d, J = 4,8 Hz)
228	3,38 (3 H, s), 3,60 - 3,62 (2 H, m), 4,31 - 4,32 (2 H, m), 4,44 (2 H, s), 4,82 (2 H, s), 6,74 (1 H, s), 7,21 - 7,24 (1 H, m), 7,34 (1 H, d, J = 8,0 Hz), 7,67 (1 H, dt, J = 4,8 Hz, J = 8,0 Hz), 8,58 (1 H, d, J = 4,8 Hz)
229	3,07 (1 H, s ancho), 3,83 - 3,86 (2 H, m), 4,29 - 4,32 (2 H, m), 4,41 (2 H, s), 4,83 (2 H, s), 6,78 (1 H, s), 7,23 - 7,28 (1 H, m), 7,48 (1 H, d, J = 8,0 Hz), 7,69 (1 H, dt, J = 4,4 Hz, J = 8,0 Hz), 8,56 (1 H, d, J = 4,4 Hz)
233	3,24 (3 H, s), 3,42 - 3,45 (2 H, m), 3,47 - 3,51 (2 H, m), 4,25 (2 H, s), 4,86 (2 H, s), 6,63 (1 H, s), 7,21 - 7,25 (1 H, m), 7,38 (1 H, d), 7,74 (1 H, dt, J = 4,8 Hz, J = 7,6 Hz), 8,48 (1 H, d, J = 4,8 Hz), 9,67 (1 H, s ancho)
235	3,59 - 3,65 (4 H, m), 3,71 - 3,77 (4 H, m), 4,96 (2 H, s), 4,85 (2 H, s), 6,77 (1 H, s), 7,21 - 7,23 (1 H, m), 7,36 (1 H, d, J = 7,6 Hz), 7,68 (1 H, dt, J = 4,0 Hz, J = 8,0 Hz), 8,58 (1 H, d, J = 4,0 Hz)
236	4,50 (2 H, s), 4,79 (2 H, s), 6,76 (1 H, s), 7,22 - 7,25 (1 H, m), 7,31 (1 H, d, J = 8,0 Hz), 7,71 (1 H, dt, J = 4,4 Hz, J = 8,0 Hz), 8,56 (1 H, d, J = 4,4 Hz), 9,71 (1 H, s)
240	2,73 (2 H, dd, J = 6,8 Hz, J = 13,6 Hz), 3,65 (3 H, s), 3,97 (2 H, t, J = 6,8 Hz), 4,83 (2 H, s), 6,72 (1 H, s), 7,19 - 7,27 (2 H, m), 7,65 (1 H, dt, J = 5,2 Hz, J = 8,0 Hz), 8,56 (1 H, dd, J = 0,8 Hz, J = 4,8 Hz)
242	3,29 (3 H, s), 4,00 - 4,15 (2 H, m), 4,60 (1 H, d, J = 6,8 Hz), 4,69 (1 H, d, J = 6,8 Hz), 4,81 (1 H, d, J = 16,8 Hz), 4,87 (1 H, d, J = 16,8 Hz), 5,13 (1 H, dd, J = 4,8 Hz, J = 6,8 Hz), 6,85 (1 H, s), 7,16 (1 H, dd, J = 5,6 Hz, J = 6,4 Hz), 7,19 - 7,23 (2 H, m), 7,41 (1 H, d, J = 8,0 Hz), 7,60 (1 H, dt, J = 4,8 Hz, J = 8,0 Hz), 7,68 (1 H, dt, J = 5,2 Hz, J = 8,0 Hz), 8,53 (1 H, d, J = 4,8 Hz), 8,61 (1 H, d, J = 5,2 Hz)
248	1,48 - 1,71 (6 H, m), 3,47 - 3,50 (1 H, m), 3,65 - 3,69 (111, m), 3,79 - 3,88 (3 H, m), 3,95 - 4,00 (1 H, m), 4,57 (1 H, s ancho), 4,91 (2 H, s), 6,90 (1 H, s), 7,18 - 7,25 (2 H, m), 7,63 (1 H, dt, J = 4,4 Hz, J = 8,0 Hz), 8,55 (1 H, d, J = 4,4 Hz)
249	3,82 - 3,85 (2 H, m), 3,92 - 3,94 (2 H, m), 4,61 (2 H, s), 4,91 (2 H, s), 6,84 (1 H, s), 7,16 - 7,30 (4 H, m), 7,59 - 7,72 (2 H, m), 8,52 - 8,58 (2 H, m)
254	4,82 (2 H, s), 4,92 (2 H, s), 6,08 (1 H, d, J = 3,2 Hz), 6,31 (1 H, d, J = 3,2 Hz), 6,68 (1 H, s), 6,83 (1 H, s), 7,21 - 7,29 (2 H, m), 7,67 (1 H, dt, J = 8,2 Hz), 8,59 (1 H, d, J = 4,8 Hz)

ES 2 370 534 T3

Núm.	RMN H1 (δ ppm (Disolvente: CDCl ₃ /400MHz)
255	1,53 - 1,62 (2 H, m), 1,89 - 1,97 (2 H, m), 3,58 - 3,64 (1 H, m), 3,73 - 3,78 (1 H, m), 3,85 - 3,90 (2 H, m), 4,21 - 4,25 (1 H, m), 4,92 (2 H, s), 6,79 (1 H, s), 7,17 - 7,23 (2 H, m), 7,63 (1H, dt, J = 4,0 Hz, J = 8,0 Hz), 8,56 (1 H, d, J = 4,0 Hz)
256	3,4 - 3,85 (2 H, m), 3,88 - 3,94 (2 H, m), 3,97 - 3,98 (2 H, m), 4,94 (2 H, s), 5,17 (1 H, t, J = 4,0 Hz), 6,85 (1 H, s), 7,17 - 7,25 (2 H, m), 7,63 (1 H, dt, J = 4,0 Hz, J = 9,2 Hz), 8,56 (1 H, d, J = 4,0 Hz)
257	1,65 - 1,70 (1 H, m), 2,00 - 2,04 (1 H, m), 2,72 - 2,75 (1 H, m), 3,56 - 3,65 (2 H, m), 3,72 - 3,81 (3 H, m), 3,92 - 3,98 (1 H, m), 4,82 (2 H, s), 6,70 (1 H, s), 7,15 - 7,22 (2 H, m), 7,64 (1 H, dt, J = 4,4 Hz, J = 8,0 Hz), 8,56 (1 H, d, J = 4,4 Hz)
258	1,28 - 1,35 (1 H, m), 1,48 - 1,65 (4 H, m), 1,85 - 1,88 (1 H, m), 3,29 - 3,34 (1 H, m), 3,55 - 3,64 (2 H, m), 3,74 - 3,77 (1 H, m), 3,90 - 3,93 (1 H, m), 4,95 (2 H, s), 6,79 (1 H, s), 7,16 - 7,21 (2 H, m), 7,62 (1 H, dt, J = 4,0 Hz, J = 8,0 Hz), 8,55 (1 H, d, J = 4,0 Hz)
260	3,05 - 3,07 (2 H, m), 3,71 - 3,76 (2 H, m), 3,88 - 3,98 (2 H, m), 4,29 - 4,33 (1 H, m), 4,91 (2 H, s), 6,77 (1 H, s), 7,19 - 7,25 (2 H, m), 7,63 (1 H, dt, J = 4,4 Hz, J = 8,0 Hz), 8,57 (1 H, d, J = 4,4 Hz)
261	2,84 - 2,89 (1 H, m), 3,06 - 3,12 (1 H, m), 3,31 - 3,37 (1 H, m), 4,10 - 4,16 (2 H, m), 4,38 - 4,42 (1H, m), 4,59 - 4,62 (1 H, m), 4,86 (2 H, s), 6,78 (1 H, s), 7,20 - 7,25 (2 H, m), 7,67 (1 H, dt, J = 4,4 Hz, J = 8,0 Hz), 8,56 (1H d, J = 4,0 Hz)
262	1,89 (3 H, s), 2,92 - 2,95 (2 H, m), 4,20 - 4,22 (2 H, m), 4,39 (2 H, s), 4,83 (2 H, s), 6,78 (1 H, s), 7,17 - 7,24 (1 H, m), 7,43 - 7,47 (1 H, m), 7,63 (1 H, dt, J = 4,0 Hz, J = 8,0 Hz), 8,56 (1 H, d, J = 4,0 Hz)
263	1,99 - 2,05 (2 H, m), 2,75 - 2,82 (2 H, m), 2,95 - 3,01 (2 H, m), 4,10 (2 H, d, J = 7,2 Hz), 4,39 (1 H, t, J = 7,2 Hz), 4,86 (2 H, s), 6,72 (1 H, s), 7,19 - 7,22 (2 H, m), 7,65 (1 H, dt, J = 4,4 Hz, J = 8,0 Hz), 8,57 (1 H, d, J = 4,4 Hz)
264	3,56 (3 H, s), 4,71 (2 H, s), 4,95 (2 H, s), 6,04 (1 H, dd, J = 2,8 Hz, J = 3,2 Hz), 6,09 (1 H, s), 6,60 (1 H, d, J = 2,0 Hz), 6,67 (1 H, s), 6,75 (1 H, s), 6,90 (1 H, d, J = 7,6 Hz), 7,16 (1 H, dd, J = 5,2 Hz, J = 7,2 Hz), 7,58 (1 H, dt, J = 4,8 Hz, J = 8,0 Hz), 8,54 (1 H, d, J = 4,8 Hz)
265	3,46 (3 H, s), 4,68 (2 H, s), 9,94 (2 H, s), 5,97 (1 H, d, J = 3,2 Hz), 6,04 (1 H, d, J = 3,2 Hz), 6,78 (1 H, s), 6,83 (1 H, s), 6,91 (1 H, d, J = 7,2 Hz), 7,17 (1H, dd, J = 5,2 Hz, J = 7,6 Hz), 7,58 (1 H, dt, J = 5,2 Hz, J = 8,0 Hz), 8,54 (1 H, d, J = 4,8 Hz)
267	4,61 (2 H, s), 4,90 (2 H, s), 6,29 (1 H, s), 6,59 (1 H, s), 6,91 (1 H, d, J = 1,6 Hz), 7,08 (1 H, d, J = 7,6 Hz), 7,16 - 7,21 (2 H, m), 7,60 (1 H, dt, J = 4,8 Hz, J = 8,0 Hz), 7,76 (1 H, d, J = 8,0 Hz), 8,30 (1 H, d, J = 5,2 Hz), 8,50 (1 H, d, J = 4,8 Hz)
268	2,13 (3 H, s), 3,80 (3 H, s), 4,71 (2 H, s), 5,03 (2 H, s), 6,64 (1 H, s), 6,77 (1 H, s), 6,96 (1 H, d, J = 8,0 Hz), 7,14 (1 H, dd, J = 6,8, 5,6 Hz), 7,58 (1 H, dd, J = 7,2, 6,8 Hz), 6,50 (1 H, d, J = 4,4 Hz)
269	3,06 (1 H, dd, J = 8,0 Hz, J = 16,8 Hz), 3,44 - 3,52 (1 H, m), 3,95 (1 H, dd, J = 8,0 Hz, J = 15,2 Hz), 4,08 - 4,14 (1 H, m), 4,96 (2 H, s), 5,23 - 5,29 (1 H, m), 6,83 (1 H, s), 7,19 - 7,22 (1 H, m), 7,28 - 7,32 (2 H, m), 7,36 - 7,38 (2 H, m), 7,66 (1 H, dt, J = 4,4 Hz, J = 8,0 Hz), 8,56 (1 H, d, J = 4,4 Hz)
270	1,19 - 1,33 (2 H, m), 1,35 - 1,39 (1 H, m), 1,56 - 1,61 (2 H, m), 1,74 - 1,77 (2 H, m), 2,13 - 2,20 (1 H, m), 2,40 (3 H, s), 2,85 - 2,88 (1 H, m), 3,47 - 3,52 (1 H, m), 4,09 - 4,16 (1 H, m), 4,77 (1 H, d, J = 16,8 Hz), 4,93 (1 H, d, J = 16,8 Hz), 6,75 (1 H, s), 7,15 - 7,20 (2 H, m), 7,63 (1 H, dt, J = 5,2 Hz, J = 8,0 Hz), 8,55 (1 H, d, J = 5,2 Hz)
271	5,29 (2 H, s), 7,09 (1 H, s), 7,24 - 7,26 (1 H, m), 7,45 (1 H, d, J = 8,0 Hz), 7,72 (1 H, dt, J = 4,8 Hz, J = 8,0 Hz), 8,32 (1 H, s), 8,54 (1 H, d, J = 4,8 Hz)
272	7,16 (1 H, dd, J = 4,8 Hz, J = 7,2 Hz), 7,30 - 7,36 (3 H, m), 7,42 - 7,45 (1 H, m), 7,50 - 7,54 (3 H, m), 7,64 (1 H, dt, J = 4,8 Hz, J = 8,0 Hz), 8,49 (1 H, d, J = 4,8 Hz)
273	5,35 (2 H, s), 6,86 - 6,90 (2 H, m), 7,00 - 7,05 (1 H, m), 7,15 - 7,18 (1 H, m), 7,31 - 7,38 (1 H, m), 7,51 - 7,57 (1 H, m), 7,64 (1 H, dt, J = 4,0 Hz, J = 8,0 Hz), 8,97 (1 H, d, J = 4,0 Hz)
279	1,67 (3 H, d, J = 6,8 Hz), 4,77 (1 H, d, J = 17,2 Hz), 4,82 (1 H, d, J = 17,2 Hz), 5,97 (1 H, d, J = 6,8 Hz), 6,57 (1 H, s), 7,16 - 7,20 (2 H, m), 7,31 (1 H, d, J = 8,0 Hz), 7,43 (1 H, d, J = 8,0 Hz)

ES 2 370 534 T3

Núm.	RMN H1 (δ ppm (Disolvente: CDCl ₃ /400MHz)
	= 7,6 Hz), 7,62 (1 H, dt, J = 4,4 Hz, J = 8, 0 Hz), 8,39 (1 H, s), 8, 47 (1 H, d, J = 4,4 Hz), 8,55 (1 H, d, J = 4,0 Hz)
280	1,69 (3 H, t, J = 6,8 Hz), 4,77 - 4,97 (2 H, m), 6,67 (1 H, s ancho), 6,95 - 7,00 (2 H, m), 7,15 - 7,20 (2 H, m), 7,34 (1 H, s ancho), 7,57 (1 H, d, J = 7,8 Hz), 7,62 (1 H, td, J = 7,6, 1,7 Hz), 8,51 (1 H, d, J = 4,8 Hz), 8,54 (1 H, d, J = 4,4 Hz)
283	1,65 (3 H, d, J = 7,2 Hz), 2, 96 (3 H, s), 6, 07 (1 H, c, J = 6,9 Hz), 6,93 (1 H, s), 7,18 (1 H, dd, J = 7,6, 4,8 Hz), 7,28 (1 H, d, J = 8,0 Hz), 7,63 (1 H, td, J = 7,8, 2,0 Hz), 8,58 (1 H, dt, J = 4,0, 0,9 Hz)
287	1,71 (3 H, t, J = 6,8 Hz), 4,72 (1 H, d, J = 17,8 Hz), 5,05 (1 H, d, J = 17,8 Hz), 6,26 (1 H, c, J = 7,2 Hz), 6,88 (1 H, s), 7,10 (1 H, d, J = 8,0 Hz), 7,18 (1 H, dd, J = 6,8, 4,8 Hz), 7,61 (1 H, td, J = 8,0, 1,9 Hz), 8,44 (1 H, d, J = 2, 4 Hz), 8,48 (1 H, t, J = 2,2 Hz), 8,54 - 8,69 (1 H, m), 8,69 (1 H, s)
288	1,69 (3 H, t, J = 7,2 Hz), 4,70 (1 H, d, J = 17,8 Hz), 4,93 (1 H, d, J = 17,8 Hz), 6,23 (1 H, c, J = 7,2 Hz), 6,60 (1 H, s), 7,06 (1 H, d, J = 8,0 Hz), 7,17 (1 H, dd, J = 6,8, 4,8 Hz), 7,59 (1 H, td, J = 7,8, 1,6 Hz), 8,44 (1 H, d, J = 3,2 Hz), 8,48 (1 H, t, J = 2, 0 Hz), 8,52 (1 H, d, J = 4,0 Hz), 8,70 (1 H, d, J = 1,6 Hz)
289	4,98 (1 H, s ancho), 5,98 (1 H, s ancho), 6,13 (1 H, s ancho), 7,16 (1 H, dd, J = 7,4, 5,0 Hz), 7,49 - 7,53 (2 H, m), 7,57 - 7,66 (2 H, m), 7, 74 (1 H, dd, J = 7, 2, 0, 8 Hz), 7, 92 (1 H, dd, J = 8, 4, 0, 8 Hz), 8, 26 (1 H, dd, J = 8,4, 2,0 Hz), 8,48 (1 H, d, J = 4,4 Hz), 8,89 (1 H, dd, J = 4,2, 1,8 Hz)
291	4,3 (2 H, s), 4,95 (2 H, s), 7,19 - 7,38 (4 H, m), 7,26 (1 H, s), 7,65 (1 H, td, J = 8,0, 2,0 Hz), 8,40 (1 H, d, J = 2,4 Hz), 8,56 (1 H, m)
292	4,99 (4 H, s), 7,07 (1 H, s), 7,19 - 7,36 (4 H, m), 7,65 (1 H, td, J = 7,6, 2,0 Hz), 8,40 (1 H, d, J = 2,0 Hz), 8,56 (1 H, d, J = 4,4 Hz)
293	2,51 (3 H, s), 4,75 - 4,91 (2 H, m), 5,15 (2 H, s ancho), 6,95 (1 H, s ancho), 7,08 (1 H, d, J = 8,0 Hz), 7,20 - 7,33 (3 H, m), 7,54 (1 H, t, J = 8,0 Hz), 7,67 (1 H, td, J = 8, 0, 1,6 Hz), 8,56 (1 H, s ancho)
294	3,79 (3 H, s), 3,83 (3 H, s), 4,78 (2 H, s), 5,01 (2 H, s), 6,55 (1 H, s), 6,62 (1 H, d, J = 8,0 Hz), 6,78 (1 H, d, J = 7, 2 Hz), 7,17 - 7,22 (2 H, m), 7,48 - 7,53 (1 H, m), 7,61 (1 H, dt, J = 5,2 Hz, J = 9,2 Hz), 8,57 (1 H, d, J = 5,2 Hz)
295	3,83 (3 H, s), 4,77 (2 H, s), 5,01 (2 H, s), 6,63 (1 H, d, J = 8,4 Hz), 6,80 (1 H, d, J = 6,8 Hz), 7,00 (1 H, s), 7,18 - 7,25 (2 H, m), 7,51 (1 H, d, J = 8,0 Hz), 7,63 (1 H, dt, J = 4,8 Hz, J = 8,0 Hz), 8,57 (1 H, d, J = 4,8 Hz)
296	3,86 (6 H, s), 4,83 (4 H, s), 6,63 (2 H, d, J = 7,6 Hz), 6,81 (2 H, d, J = 7, 2 Hz), 7,04 (1 H, s), 7,49 - 7,54 (2 H, m)
297	4,93 (2 H, s), 4,94 (2 H, s), 6,79 (1 H, s), 7,19 - 7,36 (3 H, m), 7,39 (1 H, d, J = 7,2 Hz, 7,50 (1 H, d, J = 7,2 Hz), 7,66 (1 H, dt, J = 5,2 Hz, J = 8,0 Hz), 8,55 (1 H, d, J = 4,8 Hz)
298	4,91 (2 H, s), 4,95 (2 H, s), 6,77 (1 H, s), 6,84 (1 H, dd, J = 8,4, 2,4 Hz), 7,14 - 7,32 (3 H, m), 7,63 - 7,77 (2 H, m), 8,56 (1 H, m)
299	4,95 (2 H, s), 5,00 (2 H, s), 6,84 (1 H, dd, J = 8,4, 2,4 Hz), 7,05 (1 H, s), 7,19 - 7,33 (3 H, m), 7,64 - 7,77 (2 H, m), 8,56 (1 H, m)
301	5,05 (2 H, s), 5,10 (2 H, s), 7,03 (1 H, s), 7,17 - 7,20 (2 H, m), 7,37 - 7,4 8 (4 H, m), 7,57 - 7,67 (3 H, m), 7,94 - 7,99 (2 H, m), 8,58 (1 H, d, J = 4, 8 hz)
302	4,96 (2 H, s), 4,98 (2 H, s), 6,26 (1 H, t, J = 6,4 Hz), 6,63 (1 H, d, J = 9,2 Hz), 6,89 (1 H, s), 7,22 - 7,31 (3 H, m), 7,36 - 7,41 (1 H, m), 7,64 (1H t, J = 7, 2 Hz), 7,74 - 7,81 (2 H, m), 7,89 (1 H, d, J = 8, 0 Hz), 8,58 (1 H, d, J = 4,8 Hz)
304	4,00 (3 H, s), 4,95 (2 H, s), 5,08 (2 H, s), 6,85 (1 H, s), 7,19 - 7,22 (1 H, m), 7,26 - 7,29 (1 H, m), 7,44 (1 H, d, J = 8,0 Hz), 7,64 (1 H, dt, J = 4, 4 Hz, J = 8,0 Hz), 7,80 (1 H, t, J = 7,6 Hz), 8,04 (1 H, d, J = 8,0 Hz), 8,55 (1 H, d, J = 4,4 Hz)
305	5,04 (2 H, s), 5,06 (2 H, s), 6,79 (1 H, s), 7,27 - 7,35 (2 H, m), 7,56 (1 H, d, J = 7,6 Hz), 7,73 (1 H, dt, J = 3,6 Hz, J = 8,0 Hz), 7,89 (1 H, t, J = 8,0 Hz), 8,10 (1 H, d, J = 7,6 Hz), 8,41 (1 H, s ancho), 8,62 (1 H, d, J = 3,6 Hz)

ES 2 370 534 T3

Núm.	RMN H1 (δ ppm (Disolvente: CDCl ₃ /400MHz)
306	4,93 (2 H, s), 5,01 (2 H, s), 6,81 (1 H, s), 7,21 - 7,24 (1 H, m), 7,27 - 7,30 (1 H, m), 7,56 - 7,61, (2 H, m), 7,65 - 7,70 (1 H, m), 7,79 (1 H, t, J = 7,6 Hz), 8,55 (1 H, d, J = 3,6 Hz)
308	2,54 (3 H, s), 4,81 (2 H, s), 4,88 (2 H, s), 7,09 (1 H, dd, J = 8,0, 4,8 Hz), 7,21 (1 H, d, J = 7,6 Hz), 7,22 (1 H, d, J = 8,0 Hz), 7,26 (1 H, s), 7,36 (1 H, d, J = 7,6 Hz), 1,65 (1 H, td, J = 8,0, 2,0 Hz), 8,42 (1 H, dd, J = 4,8, 1,6 Hz), 8,55 (1 H, dd, J = 5,2, 2,4 Hz)
310	2,55 (3 H, s), 4,83 (2 H, s), 4,96 (2 H, s), 6,91 (1 H, s), 7,09 (1 H, dd, J = 8,0, 4,8 Hz), 7,20 - 7,24 (2 H, m), 7,36 (1 H, d, J = 8,0 Hz), 7,65 (1 H, td, J = 7,6, 1,6 Hz), 8,43 (1 H, dd, J = 5,2, 1,6 Hz), 8,55 (1 H, m)
311	2,53 (3 H, s), 4,83 (2 H, s), 4,87 (2 H, s), 6,71 (1 H, s), 7,12 (1 H, d, J = 8,0 Hz), 7,17 - 7,23 (2 H, m), 7,51 (1 H, dd, J = 8,0, 2,0 Hz), 7,65 (1 H, td, J = 7,6, 1,2 Hz), 8,42 (1 H, d, J = 2,4 Hz), 8,57 (1 H, d, J = 4,0 Hz)
312	2,54 (3 H, s), 4,83 (2 H, s), 4,94 (2 H, s), 6,96 (1 H, s), 7,12 (1 H, d, J = 8,4 Hz), 7,19 - 7,24 (2 H, m), 7,53 (1 H, dd, J = 7,6, 2,4 Hz), 7,65 (1 H, td, J = 8,0, 1,6 Hz), 8,44 (1 H, d, J = 2,0 Hz), 8,57 (1 H, d, J = 4,8 Hz)
313	2,54 (3 H, s), 4,79 (2 H, s), 4,88 (2 H, s), 6,69 (1 H, s), 6,96 (1 H, d, J = 4,8 Hz), 7,00 (1 H, s), 7,21 (1 H, d, J = 7,6 Hz), 7,23 (1 H, d, J = 7,6 Hz), 7,66 (1 H, td, J = 8,0, 2,0 Hz), 8,43 (1 H, d, J = 5,6 Hz), 8,56 (1 H, td, J = 4,8, 1,2 Hz)
318	4,84 (2 H, s), 4,99 (2 H, s), 6,97 (1 H, s), 7,19 - 7,28 (3 H, m), 7,63 - 7,68 (2 H, m), 8,54 - 8,58 (3 H, m)
320	1,70 (3 H, s ancho), 4,77 - 5,11 (2 H, m), 6,46 (1 H, s ancho), 6,95 (2 H, s ancho), 7,17 - 7,20 (2 H, m), 7,35 (1 H, s), 7,57 - 7,70 (2 H, m), 8,51 - 8,55 (2 H, m)
321	3,14 (6 H, s), 4,97 (4 H, s ancho), 6,32 (1 H, s), 7,18 - 7,22 (4 H, m), 7,65 (2 H, td, J = 7,8, 1,9 Hz), 8,56 (2 H, d, J = 4,4 Hz)
324	(disolvente: DMSO - d ₆) 1,83 (4 H, s ancho), 3,40 - 3,50 (4 H, m), 4,91 (2 H, s ancho), 4,99 (2 H, s ancho), 6,66 (1 H, s ancho), 7,03 (1 H, s), 7,20 - 7,32 (2 H, m), 7,34 (1 H, d, J = 7,6 Hz), 7,76 (1 H, t, J = 8,0 Hz), 8,02 (1 H, s ancho), 8,50 (1 H, d, J = 4,4 Hz)
329	1,68 (3 H, d, J = 6,8 Hz), 2,47 (3 H, s), 4,78 (2 H, s ancho), 4,98 - 5,03 (1 H, m), 7,01 (1 H, d, J = 3,8 Hz), 6,43 (1 H, s ancho), 6,60 (1 H, s ancho), 6,95 - 7,11 (1 H, m), 7,17 (1 H, dd, J = 6,8, 4,8 Hz), 7,50 (1 H, t, J = 8,0 Hz), 7,57 (1 H, m), 8,52 (1 H, m)

Ahora, se describirán los Ejemplos de Ensayo.

EJEMPLO DE ENSAYO 1

5

Ensayo sobre los efectos de control contra el pulgón verde del melocotonero (Myzus persicae)

Se insertó una hoja de rábano Japonés en un tubo de ensayo en el que se había colocado agua, y se liberaron sobre la hoja aproximadamente 20 ninfas en el primer instar de pulgón verde del melocotonero. Al día siguiente, se contó el número de ninfas parásitas sobre la hoja, y a continuación la hoja se sumergió durante aproximadamente 10 segundos en una disolución insecticida preparada para llevar la concentración del compuesto de la presente invención a 800 ppm, se secó al aire y se dejó en una cámara a temperatura constante a 25°C con iluminación. Las ninfas supervivientes se contaron 5 días después del tratamiento, y la mortalidad se calculó por medio de la siguiente ecuación. Los insectos caídos de la hoja o moribundos se incluyeron en el número de muertes. El ensayo se llevó a cabo con respecto a los Núms. de Compuesto 1, 2, 4, 6, 9, 10, 13, 16, 17, 18, 19, 20, 22, 24, 27, 32, 34, 35, 38, 40, 42, 43, 45, 48, 53-55, 57, 62-64, 68, 70, 71, 73, 74, 77-81, 83, 86-107, 112, 114, 116-118, 121, 123, 124, 128, 133, 134, 136, 137, 139-142, 145-149, 151, 152, 154, 155, 157, 161, 162, 164, 165, 167, 168, 173-175, 177, 178, 182-186, 191, 192, 200-206, 208, 210, 211, 213-215, 217-220, 222, 223, 225-230, 231, 233-235, 239, 240, 242, 248, 255-264, 270, 271, 280, 284, 287, 288, 290-293, 295, 297-300, 303, 304, 306-314, 316-321, 329, 331 y 332 anteriormente mencionados, con lo que todos los compuestos mostraron una mortalidad de al menos 90%.

$$\text{Mortalidad (\%)} = (1 - (\text{número de insectos supervivientes} / \text{número de insectos tratados})) \times 100$$

EJEMPLO DE ENSAYO 2

25

Ensayo sobre los efectos de control contra el gusano gris del tabaco (Spodoptera litura)

Un disco de hoja de col se sumergió durante aproximadamente 10 segundos en una disolución insecticida preparada para llevar la concentración del compuesto de la presente invención a 800 ppm y se secó al aire. En una placa Petri

que tenía un diámetro de 9 cm, se colocó un papel de filtro húmedo, y el fragmento de hoja de col seco se colocó sobre el mismo. A continuación, se liberaron sobre el mismo 10 larvas en el segundo-tercer instar de gusano gris del tabaco y después de colocar una tapa sobre la placa Petri, se dejó en una cámara a temperatura constante a 25°C con iluminación. El quinto día después de la liberación, se contaron las larvas muertas, y la mortalidad se calculó por medio de la siguiente ecuación. Las larvas moribundas se incluyeron en el número de muertas. El ensayo se llevó a cabo con respecto a los Núms. de Compuesto 1, 2, 4, 6, 9-11, 16, 17, 19, 20, 22-24, 42, 43, 45, 48, 50, 53-57, 59, 63, 64, 67-71, 73, 74, 76, 77, 79, 80, 83, 86, 89, 92, 93, 95-100, 102, 103, 105, 106, 109, 112, 114, 116-118, 121, 124, 125, 133, 135, 137, 139, 140, 142, 145-149, 151, 154, 155, 157, 161, 162, 164-168, 173-180, 182-186, 191, 192, 194, 198, 201, 202, 204-208, 210, 211, 213, 214, 217-225, 228, 229, 231-235, 238-240, 242, 248, 250, 251, 252, 255-257, 259-263, 266, 270, 277, 280, 285, 287-293, 295, 297-300, 303-306, 308-314, 316-321, 326, 327, 329, 331 y 332 anteriormente mencionados, con lo que todos los compuestos mostraron una mortalidad de al menos 90%.

$$\text{Mortalidad (\%)} = (\text{número de larvas muertas/número de larvas liberadas}) \times 100$$

EJEMPLO DE ENSAYO 3

Ensayo sobre adultos de araña roja (Tetranychus urticae)

Se preparó una disolución insecticida para llevar la concentración del compuesto de la presente invención a 800 ppm. Se trasplantó una judía de riñón en la que se había dejado solo la primera hoja primordial a un tiesto (diámetro: 8 cm, altura: 7 cm), y se liberaron sobre la misma 20 adultos de araña roja. Junto con la hoja de judía de riñón, se sumergieron en la disolución insecticida anterior, se secaron al aire y a continuación se dejaron en una cámara a temperatura constante a 25°C con iluminación. El segundo o tercer día después del tratamiento, se contaron los adultos muertos, y la mortalidad de los adultos se calculó por medio de la siguiente ecuación. Los adultos caídos de la hoja o moribundos se incluyeron en el número de muertas. El ensayo se llevó a cabo con respecto a los Núms. de Compuesto 1-4, 6, 9, 10, 13, 16-19, 24, 27, 35, 42, 43, 45, 48, 53-55, 57, 62-64, 68, 70-74, 77-80, 83, 86-90, 92-107, 109, 110, 112, 114, 116, 118, 121, 133-135, 137, 139, 140, 141, 142, 146-149, 151, 152, 154, 155, 157, 161, 162, 164-168, 171, 173-176, 180-187, 191-193, 196, 198, 199-201, 204-206, 208, 210, 211, 213-215, 217-223, 225-228, 230, 231, 234-236, 240-242, 248, 255-263, 270, 271, 272, 279, 280, 284, 285, 287-293, 295, 297-300, 303-306, 308-314, 316-321, 324-326, 329, 331 y 332 anteriormente mencionados, con lo que todos los compuestos mostraron una mortalidad de adultos de al menos 90%.

$$\text{Mortalidad de adultos (\%)} = (\text{Número de arañas rojas muertas/Número de arañas rojas tratadas}) \times 100$$

EJEMPLO DE ENSAYO 4

Ensayo sobre los efectos de control contra Haemaphysalis longicornis

Sobre la superficie interna de una placa Petri que tenía un diámetro de 9 cm, se añadió gota a gota 1 ml de una disolución del compuesto de la presente invención en acetona (concentración: 10 µg/ml) por medio de una micropipeta. Después de secar la superficie interna de la placa Petri, se colocan de 60 a 180 garraparas larvarias, y la placa Petri se cubre con una lámina de polietileno y se sella por medio de una banda de goma. Se cuenta el número de garrapatas volteadas después del contacto con el compuesto, con lo que la mayoría de los compuestos de la presente invención voltearán Haemaphysalis longicornis.

EJEMPLO DE ENSAYO 5

Ensayo sobre los efectos de control contra Haemaphysalis longicornis empleando un perro

Se liberaron 50 garrapatas jóvenes de Haemaphysalis longicornis sobre la aurícula de un perro (Beagle, 8 meses de edad) y se parasitaron artificialmente. El segundo día después de ser parasitado, se cuenta el número de garrapatas parásitas, y a continuación se aplica sobre la parte dorsal del cuello un compuesto formulado de la presente invención a una cantidad de 10 mg/kg. Después de la administración del fármaco, se continúa la observación hasta el quinto día, con lo que se determinan el número de garrapatas parásitas, el número de garrapatas caídas y se determina la vida o la muerte de las garrapatas caídas. Se tiene cuidado del perro independientemente en una jaula separada, al que se permitió libre acceso a agua y alimento con una cantidad predeterminada de un pienso para perros una vez al día. Como resultado, los compuestos de la presente invención son eficaces para matar o hacer caer Haemaphysalis longicornis parásitas.

EJEMPLO DE ENSAYO 6

Ensayo sobre los efectos de control contra la pulga del gato (Ctenocephalides felis) empleando un perro

Se liberaron 100 pulgas de gato no chupadoras de sangre adultas en tres días después de la emergencia de los adultos sobre el pelaje dorsal de un perro (Beagle, 8 meses de edad) y se hizo que lo parasitaran artificialmente, y

en la parte dorsal del cuello, se aplicó un compuesto formulado de la presente invención a una dosis de 10 mg/kg. El tercer día después de la administración del compuesto, la pulga de gato se recupera por medio de un peine atrapa pulgas, y se cuenta el número de parásitos. Se tiene cuidado del perro independientemente en una jaula separada, al que se permitió libre acceso a agua y alimento con una cantidad predeterminada de un pienso para perros una vez al día. Como resultado, el compuesto de la presente invención es eficaz para controlar la parasitosis por pulga del gato.

5

Ahora, se describirán más abajo los Ejemplos de Formulación.

10 **EJEMPLO DE FORMULACIÓN 1**

(1)	Compuesto de la presente invención	20 partes en peso
(2)	Arcilla	70 partes en peso
(3)	Hulla blanca	5 partes en peso
(4)	Policarboxilato de sodio	3 partes en peso
(5)	Alquilnaftalenosulfonato de sodio	2 partes en peso

Los componentes anteriores se mezclan uniformemente para obtener un polvo mojable.

15 **EJEMPLO DE FORMULACIÓN 2**

(1)	Compuesto de la presente invención	5 partes en peso
(2)	Talco	60 partes en peso
(3)	Carbonato de calcio	34,5 partes en peso
(4)	Parafina líquida	0,5 partes en peso

Los componentes anteriores se mezclan uniformemente para obtener un espolvoreable.

20 **EJEMPLO DE FORMULACIÓN 3**

(1)	Compuesto de la presente invención	20 partes en peso
(2)	N,N-dimetilacetamida	20 partes en peso
(3)	Éter polioxietilentriestirilfenílico	10 partes en peso
(4)	Dodecibencenosulfonato de calcio	2 partes en peso
(5)	Xileno	48 partes en peso

Los componentes anteriores se mezclan uniformemente y se disuelven para obtener un concentrado emulsionable.

25

EJEMPLO DE FORMULACIÓN 4

(1)	Arcilla	68 partes en peso
(2)	Lignosulfonato de sodio	2 partes en peso
(3)	Polioxietilentalquilarilsulfato	5 partes en peso
(4)	Hulla Blanca	25 partes en peso

La mezcla de los componentes anteriores se mezcla con el compuesto de la presente invención a una razón en peso de 4:1 para obtener un polvo mojable.

30

EJEMPLO DE FORMULACIÓN 5

(1)	Compuesto de la presente invención	50 partes en peso
(2)	Alquilnaftalenosulfonato de sodio producto de condensación de	2 partes en peso

	formaldehído	
(3)	Aceite de silicona	0,2 partes en peso
(4)	Agua	47,8 partes en peso

Los componentes anteriores se mezclan uniformemente y se pulverizan para obtener un líquido base, y se añaden

(5)	Policarboxilato de sodio	5 partes en peso
(6)	Sulfato de sodio anhidro	42,8 partes en peso

5 y la mezcla se mezcla uniformemente, se granula y se seca para obtener gránulos dispersables en agua.

EJEMPLO DE FORMULACIÓN 6

(1)	Compuesto de la presente invención	5 partes en peso
(2)	Éter polioxietilenoctilfenílico	1 parte en peso
(3)	Éster de ácido polioxietilenoalquileterfosfórico	0,1 partes en peso
(4)	Carbonato de calcio granular	93,9 partes en peso

10 Los componentes anteriores (1) a (3) se mezclan uniformemente preliminarmente y se diluyen con una cantidad apropiada de acetona, y a continuación la mezcla pulveriza sobre el componente (4), y se elimina la acetona para obtener gránulos.

EJEMPLO DE FORMULACIÓN 7

15

(1)	Compuesto de la presente invención	2,5 partes en peso
(2)	N,N-dimetilacetamida	2,5 partes en peso
(3)	Aceite de soja	95,0 partes en peso

Los componentes anteriores se mezclan uniformemente y se disuelven para obtener una formulación de volumen ultrabajo.

EJEMPLO DE FORMULACIÓN 8

(1)	Compuesto de la presente invención	40 partes en peso
(2)	Polioxietilenoestirilfenileterfosfato de potasio	4 partes en peso
(3)	Aceite de silicona	0,2 partes en peso
(4)	Goma xantana	0,1 partes en peso
(5)	Étilenglicol	5 partes en peso
(6)	Agua	50,7 partes en peso

25 Los componentes anteriores se mezclan uniformemente y se pulverizan para obtener un concentrado en suspensión con una base acuosa.

EJEMPLO DE FORMULACIÓN 9

(1)	Compuesto de la presente invención	10 partes en peso
(2)	Monoetiléter de dietilenglicol	80 partes en peso
(3)	Éter polioxietilenoalquílico	10 partes en peso

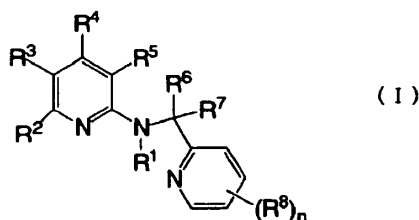
30 Los componentes anteriores se mezclan uniformemente para obtener un concentrado soluble.

APLICABILIDAD INDUSTRIAL

- 5 El plaguicida que contiene un derivado de piridil-metanamina novedoso o una de sus sales como ingrediente activo de la presente invención tiene un efecto, dosificación, etc. excelentes en comparación con los productos convencionales, y tiene un efecto de control muy alto con una baja dosificación y por lo tanto es aplicable para el control de plagas, y particularmente es muy aplicable industrialmente como plaguicida agrícola y hortícola y como plaguicida contra parásitos de animales.
- 10 Por la presente se hace referencia a la descripción completa de la Solicitud de Patente Japonesa Núm. 2006-170283 presentada el 20 de Junio de 2006 incluyendo la memoria, las reivindicaciones, los dibujos y el resumen.

REIVINDICACIONES

1. Un derivado de piridil-metanamina representado por la fórmula (I) o una de sus sales:



5 donde R^1 es hidrógeno, alquilo que puede estar sustituido con R^b , alqueno que puede estar sustituido con R^b , alquinilo que puede estar sustituido con R^b , arilo, ciano, $N=CHR^c$, OR^c , $S(O)_pR^c=$, $COSR^c$, $COOR^c$, COR^c , o un grupo heterocíclico que puede estar sustituido con alquilo o haloalquilo; cada uno de R^2 y R^3 que son independientes entre sí, es hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, alquilo que puede estar sustituido con R^8 , cicloalquilo, alqueno, alquinilo, arilo, un grupo heterocíclico, NR^aR^c , OR^a , SR^a , COR^a , $COOR^a$, $CONR^aR^c$, $CH=NOR^a$, SO_2R^a o SOR^a ; R^4 es trifluorometilo o clorodifluorometilo; R^5 es hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, alquilo que puede estar sustituido con R^8 , alqueno que puede estar sustituido con R^3 , alquinilo que puede estar sustituido con R^8 , OR^a , SR^a , NR^aR^c , $COOR^a$ o COR^a ; cada uno de R^6 y R^7 que son independientes entre sí, es hidrógeno, ciano, alquilo, haloalquilo o cicloalquilo, o R^6 y R^7 pueden formar juntos cicloalquilo C3-C6 que puede estar sustituido con halógeno; R^8 es alquilo, cicloalquilo, alcoxialquilo, alcoxialcoxialquilo, hidroxialquilo, halógeno, haloalquilo, ciano, nitro, arilo que puede estar sustituido con halógeno, un grupo heterocíclico que puede estar sustituido con halógeno, oxi heterocíclico que puede estar sustituido con halógeno, $CONR^aR^c$, COR^c , $COOR^c$, NR^aR^c o OR^a ; R^a es hidrógeno, alquilo, cicloalquilo, haloalquilo o alquilo heterocíclico; R^b es halógeno, arilo que puede estar sustituido con R^8 , un grupo heterocíclico que puede estar sustituido con R^8 , oxi heterocíclico que puede estar sustituido con R^8 , tio heterocíclico que puede estar sustituido con R^8 , ciano, NR^aR^c , $NHCOOR^a$, COR^c , $COOR^c$, $CONR^aR^c$, alcoxialcoxi, OR^a o $S(O)_pR^a$; R^c es hidrógeno, alquilo, haloalquilo, cicloalquilo, alcoxialquilo, hidroxialquilo, arilo que puede estar sustituido con halógeno, o un grupo heterocíclico que puede estar sustituido con haloalquilo; n es un número entero de 0 a 4, p es un número entero de 0 a 2, en el radical NR^aR^c en cada uno de los sustituyentes anteriores, R^a y R^c pueden formar juntos un anillo heterocíclico de 5 o 6 miembros junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, siempre que se excluya N-(2-piridilmetil)-3,5,6-tricloro-4-(trifluorometil)-2-piridilamina.

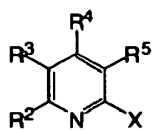
25 2. El derivado de piridil-metanamina o una de sus sales de acuerdo con la Reivindicación 1, donde R^1 es hidrógeno, alquilo que puede estar sustituido con R^b , alqueno que puede estar sustituido con R^b , alquinilo que puede estar sustituido con R^b , arilo, un grupo heterocíclico que puede estar sustituido con haloalquilo, $N=CHR^c$, OR^c , $COSR^c$ o COR^c ; cada uno de R^2 y R^3 que son independientes entre sí, es hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, alquilo que puede estar sustituido con R^8 , cicloalquilo, alqueno, alquinilo, arilo, un grupo heterocíclico, NR^aR^c , OR^a , SR^a , COR^a , $COOR^a$, $CONR^aR^c$, SO_2R^a o SOR^a ; R^5 es hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, alquilo que puede estar sustituido con R^8 , $COOR^a$ o COR^a ; cada uno de R^6 y R^7 que son independientes entre sí, es hidrógeno, ciano, alquilo, haloalquilo o cicloalquilo; R^8 es alquilo, cicloalquilo, alcoxialquilo, alcoxialcoxialquilo, hidroxialquilo, halógeno, haloalquilo, ciano, nitro, NR^aR^c o OR^a ; R^a es hidrógeno, alquilo, cicloalquilo o haloalquilo; R^b es halógeno, arilo que puede estar sustituido con R^8 , un grupo heterocíclico que puede estar sustituido con R^8 , ciano, NR^aR^c , $NHCOOR^a$, OR^a o SR^a ; y R^c es hidrógeno, alquilo, cicloalquilo, arilo o un grupo heterocíclico que puede estar sustituido con haloalquilo.

35 3. El derivado de piridil-metanamina o una de sus sales de acuerdo con la Reivindicación 2, donde cada uno de R^2 y R^3 que son independientes entre sí, es hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, alquilo, haloalquilo, alqueno, alquinilo, arilo, un grupo heterocíclico, NR^aR^c , OR^a , SR^a , COR^a o SOR^a ; R^5 es hidrógeno, halógeno o COR^a ; R^8 es alquilo, halógeno, haloalquilo, alcoxialcoxialquilo, hidroxialquilo, ciano, NR^aR^c o OR^a ; R^a es hidrógeno, alquilo o haloalquilo; R^b es halógeno, arilo, un grupo heterocíclico que puede estar sustituido con R^8 , ciano, NR^aR^c , OR^a o SR^a ; y R^c es hidrógeno, alquilo, arilo o un grupo heterocíclico.

45 4. El derivado de piridil-metanamina o una de sus sales de acuerdo con la Reivindicación 2, donde R^1 es hidrógeno, alquilo que puede estar sustituido con R^b , alqueno que puede estar sustituido con R^b , alquinilo, arilo, un grupo heterocíclico que puede estar sustituido con haloalquilo, OR^c o COR^c ; R^2 es hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo, haloalquilo, alqueno, arilo, NR^aR^c , OR^a o SR^a ; R^3 es hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, haloalquilo, arilo, NR^aR^c , SR^a o COR^a ; R^4 es trifluorometilo; R^5 es hidrógeno, halógeno o COR^a ; cada uno de R^6 y R^7 que son independientes entre sí, es hidrógeno, alquilo o cicloalquilo; R^8 es alquilo, halógeno, haloalquilo, alcoxialcoxialquilo, hidroxialquilo, ciano o OR^a ; R^a es hidrógeno o alquilo; R^b es halógeno, arilo, un grupo heterocíclico que puede estar sustituido con R^8 , OR^a o NR^aR^c ; R^c es hidrógeno, alquilo, arilo o un grupo heterocíclico.

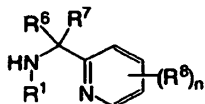
55 5. Un método para producir un derivado de piridil-metanamina o una de sus sales como se ha definido en la Reivindicación 1, que comprende

(1) hacer reaccionar un compuesto representado por la fórmula (II):



(II)

donde R², R³, R⁴ y R⁵ se definen como antes, y X es halógeno, con un compuesto representado por la fórmula (III):

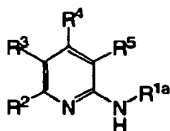


(III)

donde R¹, R⁶, R⁷, R⁸ y n se definen como antes; o

5

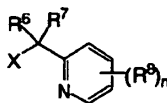
(2) hacer reaccionar un compuesto representado por la fórmula (V-1):



(V-1)

donde R^{1a} es alquilo que puede estar sustituido con R^b, alqueniilo que puede estar sustituido con R^b, alquinilo que puede estar sustituido con R^b, arilo, un grupo heterocíclico que puede estar sustituido con alquilo o haloalquilo, N=CHR^c, OR^c, S(O)_pR^c, COSR^c, COOR^c o COR^c, y R^b, R^c, p, R², R³, R⁴ y R⁵ se definen como antes, con un compuesto representado por la fórmula (VI):

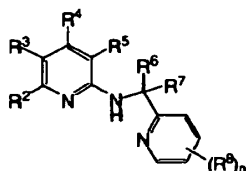
10



(VI)

donde R⁶, R⁷, R⁸, X y n se definen como antes; o

(3) hacer reaccionar un compuesto representado por la fórmula (I-1):



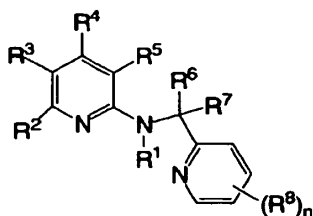
(I-1)

15

donde R², R³, R⁴, R⁵, R⁶, R⁷, R⁸ y n se definen como antes, con un compuesto representado por la fórmula (VII): R^{1a}-X, donde R^{1a} y X se definen como antes.

20

6. Un plaguicida que comprende, como ingrediente activo, un derivado de piridil-metanamina representado por la fórmula (I) o una de sus sales:



(I)

donde R¹ es hidrógeno, alquilo que puede estar sustituido con R^b, alqueniilo que puede estar sustituido con R^b, alquinilo que puede estar sustituido con R^b, arilo, ciano, N=CHR^c, OR^c, S(O)_pR^c, COSR^c, COOR^c, COR^c, o un grupo heterocíclico que puede estar sustituido con alquilo o haloalquilo; cada uno de R² y R³ que son independientes entre sí, es hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, alquilo que puede estar sustituido con R⁸, cicloalquilo, alqueniilo, alquinilo, arilo, un grupo heterocíclico, NR^aR^c, OR^a, SR^a, COR^a, COOR^a, CONR^aR^c, CH=NOR^a, SO₂R^a o SOR^a; R⁴ es trifluorometilo o clorodifluorometilo; R⁵ es hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, alquilo que puede estar sustituido con R⁸, alqueniilo que puede estar sustituido con R⁸, alquinilo que puede estar sustituido con R⁸, OR^a, SR^a, NR^aR^c,

25

- 5 COOR^a o COR^a; cada uno de R⁶ y R⁷ que son independientes entre sí, es hidrógeno, ciano, alquilo, haloalquilo o cicloalquilo, o R⁶ y R⁷ pueden formar juntos cicloalquilo C3-C6 que puede estar sustituido con halógeno; R⁸ es alquilo, cicloalquilo, alcoxialquilo, alcoxialcoxialquilo, hidroxialquilo, halógeno, haloalquilo, ciano, nitro, arilo que puede estar sustituido con halógeno, un grupo heterocíclico que puede estar sustituido con halógeno, oxi heterocíclico que puede estar sustituido con halógeno, CONR^aR^c, COR^c, COOR^c, NR^aR^c o OR^a; R^a es hidrógeno, alquilo, cicloalquilo, haloalquilo o alquilo heterocíclico; R^b es halógeno, arilo que puede estar sustituido con R⁸, un grupo heterocíclico que puede estar sustituido con R⁸, oxi heterocíclico que puede estar sustituido con R⁸, tio heterocíclico que puede estar sustituido con R⁸, ciano, NR^aR^c, NHCOOR^a, COR^c, COOR^c, CONR^aR^c, alcoxialcoxi, OR^a o S(O)_pR^a; R^c es hidrógeno, alquilo, haloalquilo, cicloalquilo, alcoxialquilo, hidroxialquilo, arilo que puede estar sustituido con halógeno, o un grupo heterocíclico que puede estar sustituido con haloalquilo; n es un número entero de 0 a 4, p es un número entero de 0 a 2, en el radical NR^aR^c en cada uno de los sustituyentes anteriores, R^a y R^c pueden formar juntos un anillo heterocíclico de 5 o 6 miembros junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos.
- 15 7. El plaguicida de acuerdo con la Reivindicación 6, donde R¹ es hidrógeno, alquilo que puede estar sustituido con R^b, alquenilo que puede estar sustituido con R^b, alquinilo que puede estar sustituido con R^b, arilo, un grupo heterocíclico que puede estar sustituido con haloalquilo, N=CHR^c, OR^c, COSR^c o COR^c; cada uno de R² y R³ que son independientes entre sí, es hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, alquilo que puede estar sustituido con R⁸, cicloalquilo, alquenilo, alquinilo, arilo, un grupo heterocíclico, NR^aR^c, OR^a, SR^a, COR^a, COOR^a, CONR^aR^c, SO₂R^a o SOR^a; R⁵ es hidrógeno, halógeno, ciano, nitro, alquilo que puede estar sustituido con R⁸, COOR^a o COR^a; cada uno de R⁶ y R⁷ que son independientes entre sí, es hidrógeno, ciano, alquilo, haloalquilo o cicloalquilo; R⁸ es alquilo, cicloalquilo, alcoxialquilo, alcoxialcoxialquilo, hidroxialquilo, halógeno, haloalquilo, ciano, nitro, NR^aR^c o OR^a; R^b es halógeno, arilo que puede estar sustituido con R⁸, un grupo heterocíclico que puede estar sustituido con R⁸, ciano, NR^aR^c, NHCOOR^a, OR^a o SR^a; y R^c es hidrógeno, alquilo, cicloalquilo, arilo o un grupo heterocíclico que puede estar sustituido con haloalquilo.
- 25 8. Un plaguicida agrícola y hortícola que contiene, como ingrediente activo, el derivado de piridil-metanamina representado por la fórmula (I) o una de sus sales como se ha definido en la Reivindicación 6.
- 30 9. Un insecticida, miticida o nematocida que contiene, como ingrediente activo, el derivado de piridil-metanamina representado por la fórmula (I) o una de sus sales como se ha definido en la Reivindicación 6.
- 35 10. El uso agrícola u hortícola de una cantidad eficaz del derivado de piridil-metanamina representado por la fórmula (I) o una de sus sales como se ha definido en la Reivindicación 6 para controlar una plaga.