

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 371 922**

51 Int. Cl.:
C07D 231/44 (2006.01)
A01N 43/56 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

- 96 Número de solicitud europea: **05757057 .4**
96 Fecha de presentación: **14.06.2005**
97 Número de publicación de la solicitud: **1761501**
97 Fecha de publicación de la solicitud: **14.03.2007**

54 Título: **DERIVADOS DE N-FENILPIRAZOLE COMO PESTICIDAS.**

30 Prioridad:
26.06.2004 EP 04015063

45 Fecha de publicación de la mención BOPI:
11.01.2012

45 Fecha de la publicación del folleto de la patente:
11.01.2012

73 Titular/es:
MERIAL LTD.
3239 SATELLITE BLVD.
DULUTH, GA 30096-4640, US

72 Inventor/es:
SCHNATTERER, Stefan;
MAIER, Michael;
LOCHHAAS, Friederike;
KNAUF, Werner y
SEEGER, Karl

74 Agente: **Ponti Sales, Adelaida**

ES 2 371 922 T3

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

DESCRIPCIÓN

Derivados de N-fenilpirazole como pesticidas

[0001] La presente invención se refiere a nuevos derivados de carbamatos de aminopirazol sustituidos en la posición 5 polares, a procesos para su preparación, a composiciones de los mismos, y a su uso para el control de plagas (incluyendo artrópodos y helmintos).

El control de insectos, arácnidos y helmintos con compuestos de alcocarbonilamino- y haloalcoxi carbonilaminopirazole sustituidos en la posición 5 se ha descrito en, por ejemplo, en las patentes con número de publicación FR 2834288, EP 295117, WO2000/035884 y WO 2003/074493. Los derivados de carbamatos de aminopirazol sustituidos en la posición 5 de la presente invención llevan cadenas de carbón polares y anillos con heteroátomos tales como oxígeno, nitrógeno y azufre en el grupo carbamato.

Sin embargo, dado que los pesticidas modernos deben cumplir un amplio rango de exigencias, por ejemplo, con respecto al nivel, duración y espectro de acción, espectro de uso, toxicidad, combinación con otras sustancias activas, combinación con ayudantes de formulación o síntesis, y dado que es posible la aparición de resistencias, el desarrollo de dichas sustancias no se puede considerar nunca como concluido, y existe constantemente una elevada demanda de nuevos compuestos que son ventajosos con respecto a los compuestos conocidos, por lo menos en lo que se refiere a algunos aspectos.

[0002] Es un objeto de la presente invención proporcionar nuevos pesticidas que se puedan utilizar en animales de compañía domésticos.

Es ventajoso aplicar pesticidas a animales en forma oral para prevenir la posible contaminación de humanos o el medio circundante.

Otro objetivo de la presente invención es proporcionar nuevos pesticidas que se puedan utilizar en dosis inferiores que los pesticidas existentes.

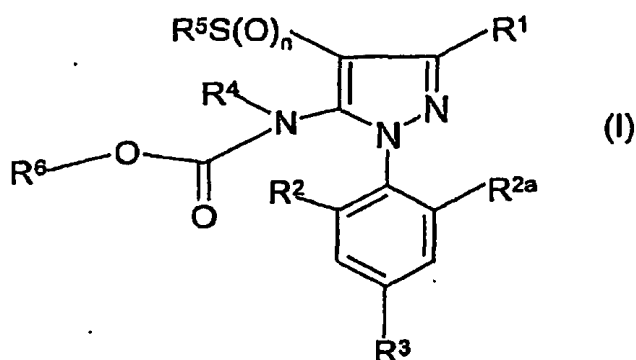
Otro objeto de la invención es proporcionar nuevos pesticidas que sean sustancialmente no eméticos.

Otro objeto de la invención es proporcionar nuevos pesticidas que sean más seguros para el usuario y el medio ambiente.

Otro objeto de la invención es proporcionar nuevos pesticidas que muestren una actividad mejorada contra los ectoparásitos en términos de cantidad de aplicación y duración de actividad como ectoparasiticidas sistémicos.

Estos objetivos se logran totalmente o en parte mediante la presente invención.

[0003] La presente invención proporciona un compuesto que es un derivado de carbamatos de aminopirazol sustituidos en la posición 5 de fórmula (I):



donde:

R¹ es CN o CF₃;

R² y R^{2a} son cada uno independientemente halógeno o CH₃;

R³ es haloalquilo-(C₁-C₃), haloalcoxi-(C₁-C₃) o SF₅;

R^4 es H, alqueno-(C₂-C₆), haloalqueno-(C₂-C₆), alquino-(C₂-C₆), haloalquino-(C₂-C₆), cicloalquilo-(C₃-C₇) o alquilo-(C₁-C₆) estando el último grupo mencionado no sustituido o sustituido por uno o más radicales seleccionados del grupo consistente en cicloalquilo-(C₃-C₇), CN, NO₂, R⁷, COR⁸, R⁹ y CO₂R⁸;

5 R^5 es alquilo-(C₁-C₆), haloalquilo-(C₁-C₆), alqueno-(C₂-C₆), haloalqueno-(C₂-C₆), alquino-(C₂-C₆) o haloalquino-(C₂-C₆);

R^6 es alquilo-(C₂-C₈), alqueno-(C₄-C₈), cicloalquilo-(C₃-C₇)- alquilo-(C₁-C₆) o -(C₁-C₆)-arilo- alquilo, estando los 4 últimos grupos mencionados no sustituidos o sustituidos (en las partes alquilo o alqueno) por uno o varios radicales X-Z; o un radical saturado heterocíclico- alquilo-(C₁-C₆), que está no sustituido o sustituido en el anillo heterocíclico por uno o más radicales Z¹;

10 Z es H, haloalquilo-(C₁-C₆), alqueno-(C₃-C₆), haloalqueno-(C₃-C₆), alqueno-(C₃-C₆), haloalquino-(C₃-C₆), cicloalquilo-(C₃-C₇), cicloalquilo-(C₃-C₇)- alquilo-(C₁-C₆), alcoxi-(C₁-C₆)-(CH₂O)_r alquilo-(C₁-C₆), arilo-[alquilo-(C₁-C₆)]_s, R⁹-[alquilo-(C₁-C₆)]_t, CHO o R¹⁰-CO;

X es O, NR¹¹ o S(O)_m; o NR¹¹-Z forman conjuntamente un anillo saturado con cinco o seis miembros que contiene opcionalmente un átomo adicional de N, O o S y está no sustituido o sustituido por uno o más radicales

15 seleccionados del grupo consistente en halógeno, alquilo-(C₁-C₆) y oxo;

R⁷ es fenil no sustituido o sustituido por uno o más radicales seleccionados del grupo consistente en halógeno, alquilo-(C₁-C₆), haloalquilo-(C₁-C₆), alcoxi-(C₁-C₆), haloalcoxi-(C₁-C₆), CN, NO₂, S(O)_pR¹² y NR¹³R¹⁴;

R⁸ es alquilo-(C₁-C₆), haloalquilo-(C₁-C₆), cicloalquilo-(C₃-C₇), cicloalquilo-(C₃-C₇)- alquilo-(C₁-C₄) o (CH₂)_qR⁷;

Z¹ es alquilo-(C₁-C₆), halógeno, alcoxi-(C₁-C₆), R⁷, O(CH₂)_qR⁷, O- tetrahidropirano, OCO alquilo-(C₁-C₆), OCO

20 (CH₂)_qR⁷, OCO₂ alquilo-(C₁-C₆), OCO₂CH₂R⁷, hidroxilo, oxo, tioxo, OCO alquilo-(C₁-C₆)-OCO alquilo-(C₁-C₆) o

alquilo-(C₁-C₆) donde el último grupo mencionado está no sustituido o sustituido por uno o más radicales OCO alquilo-(C₁-C₆) o dioxolano (cuyo anillo dioxolano está sustituido por uno o más radicales alquilo-(C₁-C₆)); o dos átomos de carbono adyacentes de un anillo (de la parte de anillo heterocíclico de R⁶) forman un benceno o un anillo

25 1,3-dioxolano no sustituido o sustituido por uno o más radicales alquilo-(C₁-C₆); o un anillo de carbono en forma de compuesto en espiral que tiene un anillo ciclopentano o ciclohexano; R⁹ es un radical heterocíclico saturado, no-saturado o heteroaromático no sustituido o sustituido por uno o más radicales seleccionados del grupo consistente en halógeno, alquilo-(C₁-C₆), haloalquilo-(C₁-C₆), alcoxi-(C₁-C₆), haloalcoxi-(C₁-C₆), CN, NO₂, S(O)_pR¹², OH y oxo;

30 R¹⁰ es H, alqueno-(C₂-C₆), haloalqueno-(C₂-C₆), alquino-(C₂-C₆), haloalquino-(C₂-C₆), cicloalquilo-(C₃-C₇), alcoxi-(C₁-C₆), haloalcoxi-(C₁-C₆), O(CH₂)_qR⁷, O(CH₂)_q cicloalquilo-(C₃-C₇), R⁷ o R⁹; o alquilo-(C₁-C₆) no sustituido o sustituido por uno o más radicales seleccionados del grupo consistente en halógeno, alcoxi-(C₁-C₆), haloalcoxi-(C₁-C₆), alquinoxilo-(C₃-C₆), haloalquinoxilo-(C₃-C₆), alquinoxilo-(C₃-C₆), haloalquinoxilo-(C₃-C₆),

cicloalquilo-(C₃-C₇), S(O)_pR¹², CN, NO₂, OH, R⁷, R⁹, COR⁸, NR¹³R¹⁴, OR⁸, CO₂H y CO₂R⁸;

35 R¹¹ es H o R¹⁰; o R¹⁰, R¹¹ y los N átomos enlazados forman un anillo que contiene opcionalmente un átomo adicional de N, O o S y está no sustituido o sustituido por uno o más radicales seleccionados del grupo consistente en halógeno, alquilo-(C₁-C₆) y oxo;

R¹² es alquilo-(C₁-C₆) o haloalquilo-(C₁-C₆),

R¹³ y R¹⁴ son cada uno independientemente H, alquilo-(C₁-C₆), haloalquilo-(C₁-C₆), alqueno-(C₂-C₆), alquino-(C₂-C₆), cicloalquilo-(C₃-C₇) o cicloalquilo-(C₃-C₇)- alquilo-(C₁-C₆);

m, n, p, q, s y t son cada uno independientemente 0, 1 ó 2;

40 r es 0, 1, 2 ó 3;

cada heterocíclico saturado, insaturado o heteroaromático en los radicales arriba mencionados es independientemente un radical heterocíclico que tiene de 3 a 7 átomos en el anillo y 1, 2 ó 3 heteroátomos en el anillo seleccionados del grupo que consiste en N, O y S;

45 cada heterocíclico saturado en los radicales arriba mencionados es independientemente un radical heterocíclico saturado con 3 a 7 átomos de anillo y 1, 2 ó 3 heteroátomos en el anillo seleccionados del grupo que consiste en N, O, S y P, y

cada arilo de los radicales arriba mencionados es independientemente un radical aromático mono-, bi- o policíclico, o una sal de los mismos aceptable como pesticida.

[0004] Estos compuestos tienen propiedades pesticidas valiosas.

5 **[0005]** La presente invención también comprende cualquier estereoisómero, enantiómero, isómero geométrico, y mezclas de estos.

10 **[0006]** Por el término "sales aceptables como pesticidas" se entienden sales, aniones o cationes conocidos y aceptados en la técnica para la formación de sales para uso pesticida. Algunas sales adecuadas con bases, por ejemplo formadas por compuestos de fórmula (I) que contienen un grupo ácido carboxílico, que incluyen metal alcalino (por ejemplo sodio y potasio), metal alcalino-térreo (por ejemplo calcio y magnesio), sales de amonio y amina (por ejemplo dietanolamina, trietanolamina, octilamina, morfolina y dioctilmetilamina). Algunas sales de adición ácidas adecuadas, por ejemplo formadas por compuestos de fórmula (I) que contienen un grupo amino, incluyen sales con ácidos inorgánicos, por ejemplo hidrocloreatos, sulfatos, fosfatos y nitratos y sales con ácidos orgánicos, por ejemplo ácido acético.

15 **[0007]** La expresión "uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en" en la definición ha de entenderse en el sentido en cada caso como uno o más radicales idénticos o diferentes seleccionados del grupo establecido de radicales, a menos se expresen expresamente limitaciones específicas.

[0008] En la presente descripción, incluyendo las reivindicaciones adjuntas, los sustituyentes antes mencionados tienen los siguientes significados:

Átomo halógeno significa fluoro, cloro, bromo o iodo.

20 El término "halo" delante del nombre de un radical significa que este radical está parcialmente o completamente halogenado, es decir, substituido por f, Cl, Br, o I, en cualquier combinación, preferentemente por f o Cl.

Los grupos alquilo y porciones de estos (a no ser que se defina de otro modo) pueden ser lineales- o ramificados.

25 La expresión "alquilo-(C₁-C₆)" debe entenderse como un radical de hidrocarburo no-ramificado o ramificado que tiene 1, 2, 3, 4, 5 o 6 átomos de carbono, tales como, por ejemplo un radical metilo, etilo, propilo, isopropilo, 1-butilo, 2-butilo, 2- metilpropilo o tert-butilo.

Los radicales alquilo y también en grupos compuestos, a no ser que se defina de otro modo, preferentemente tienen de 1 a 4 átomos de carbono.

30 "haloalquilo-(C₁-C₆)" significa un grupo alquilo mencionado por la expresión "alquilo-(C₁-C₆)" donde uno o más átomos de hidrógeno están substituidos por el mismo número de átomos halógenos idénticos o diferentes, tales como el monohaloalquilo, perhaloalquilo, CF₃, CHF₂, CH₂F, CHFCH₃, CF₃CH₂, CF₃CF₂, CHF₂CF₂, CH₂FCHCl, CH₂Cl, CCl₃, CHCl₂ o CH₂CH₂Cl.

"Alcoxi-(C₁-C₆)" significa un grupo alcoxi cuya cadena de carbonos tiene el significado dado por la expresión "alquilo-(C₁-C₆)". "Haloalcoxi" es, por ejemplo, OCF₃, OCHF₂, OCH₂F, CF₃CF₂O, OCH₂CF₃ u OCH₂CH₂Cl.

35 "Alquenoil-(C₂-C₆)" significa una cadena de carbonos no-cíclica no-ramificada o ramificada que tiene un número de átomos de carbono que corresponde a este intervalo establecido y que contiene al menos un doble enlace que puede estar localizado en cualquier posición del radical insaturado respectivo. "Alquenoil-(C₂-C₆)" indica consecuentemente, por ejemplo, el grupo vinilo, alilo, 2-metil-2- propenilo, 2-butenilo, pentenilo, 2-metilpentenilo o el hexenilo.

40 "Alquiniil-(C₂-C₆)" significa una cadena de carbonos no-cíclica no-ramificada o ramificada que tiene un número de átomos de carbono que corresponde a este intervalo establecido y que contiene un triple enlace que puede estar localizado en cualquier posición del radical insaturado respectivo. "Alquiniil-(C₂-C₆)" indica consecuentemente, por ejemplo, el grupo propargilo, 1-metil-2-propinilo, 2-butinilo o 3-butinilo.

Los ciclogrupos alquilo preferentemente tienen de tres a siete átomos de carbono en el anillo y están opcionalmente substituidos por halógeno o alquilo.

45 La expresión "cicloalquilo-(C₃-C₇)-alquilo-(C₁-C₆)" significa un grupo alquilo - (C₁-C₆) que está substituido por un anillo cicloalquilo-(C₃-C₇).

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

un ejemplo de alquilo substituido por cicloalquilo es el Ciclopropilmetilo;

un ejemplo de alquilo sustituido por alcoxi es metoximetilo (CH_2OCH_3); y

un ejemplo de alquilo sustituido por alquiltio es metiltiometilo (CH_2SCH_3).

"Ariilo- alquilo-($\text{C}_1\text{-C}_6$)" significa un radical alquilo-($\text{C}_1\text{-C}_6$) que está sustituido por un radical ariilo.

5 Un " heterociclilo- alquilo-($\text{C}_1\text{-C}_6$) saturado" significa un radical alquilo-($\text{C}_1\text{-C}_6$) que está sustituido por un radical heterociclilo saturado.

" alcoxi- ($\text{C}_1\text{-C}_6$)- (CH_2O)_r- alquilo-($\text{C}_1\text{-C}_6$)" significa un radical alquilo-($\text{C}_1\text{-C}_6$) que está sustituido por un radical

" alcoxi- ($\text{C}_1\text{-C}_6$)- (CH_2O)_r, por ejemplo un radical alcoxialquilo, alcoxialcoxialquilo o alcoxialcoxialcoxialquilo.

La expresión "OCO alquilo-($\text{C}_1\text{-C}_6$)" significa un radical alquilcarboniloxi -($\text{C}_1\text{-C}_6$)-. La expresión "OCO₂

alquilo-($\text{C}_1\text{-C}_6$)" significa un radical alcoxicarboniloxi-($\text{C}_1\text{-C}_6$).

10 La expresión "OCO alquilo-($\text{C}_1\text{-C}_6$)-OCO alquilo-($\text{C}_1\text{-C}_6$)" significa un radical alquilcarboniloxialquilcarboniloxi - ($\text{C}_1\text{-C}_6$).

Ariilo indica un sistema aromático mono-, bi-o policíclicos, por ejemplo, fenilo, naftilo, tetrahidronaftilo, indenilo, indanilo, pentalenilo, fluorenilo y similares, preferentemente fenilo. Los grupos ariilo pueden estar sin sustituir o

sustituidos por uno o más radicales (preferiblemente 1, 2 ó 3 radicales).

15 Un radical "heterociclilo saturado" contiene preferentemente uno o más, en particular 1, 2 o 3, heteroátomos en el anillo heterocíclico, preferentemente seleccionado del grupo constituido por N, O y S y P (estando los átomos de S opcionalmente en los estados de oxidación SO u SO₂); es preferentemente un radical heterociclilo alifático que tiene de 3 a 7 átomos en el anillo. El radical "heterociclilo saturado" puede ser, por ejemplo, oxiranilo, oxetanilo, oxolanilo (= tetrahidrofurilo), oxanilo, pirrolidilo, piperidilo, piperazinilo, dioxolanilo, oxazolinilo, isoxazolinilo, oxazolidinilo, 20 isoxazolidinilo o morfolinilo.

El radical "heterociclilo saturado" puede ser no sustituido o sustituido, preferentemente por uno o varios radicales (preferentemente 1, 2 o 3 radicales)

25 Un radical "heterociclilo saturado, no-saturado o heteroaromático " contiene preferentemente uno o más, en particular 1, 2 o 3, heteroátomos en el anillo heterocíclico, preferentemente seleccionado del grupo constituido por N, O y S (estando los átomos de S opcionalmente en los estados de oxidación SO u SO₂); es preferentemente un radical heterociclilo alifático que tiene de 3 a 7 átomos cíclicos o un radical heteroaromático que tiene de 5 a 7 átomos cíclicos. El radical heterocíclico puede ser, por ejemplo, un radical heteroaromático o anillo (heteroarilo) tal como, por ejemplo, un sistema aromático mono-, bi- o policíclico en el que al menos 1 anillo contiene uno o más heteroátomos, por ejemplo piridilo, pirimidinilo, piridazinilo, pirazinilo, triazinilo, tienilo, tiazolilo, tiadiazolilo, oxazolilo, 30 isoxazolilo, furilo, pirrolilo, pirazolilo, imidazolilo y triazolilo, o es un radical parcialmente o totalmente hidrogenado tal como el oxiranilo, oxetanilo, oxolanilo (= tetrahidrofurilo), oxanilo, pirrolidilo, piperidilo, piperazinilo, dioxolanilo, oxazolinilo, isoxazolinilo, oxazolidinilo, isoxazolidinilo y morfolinilo. El radical "heterociclilo saturado, no-saturado o heteroaromático " puede ser no sustituido o sustituido, preferentemente por uno o varios radicales (preferentemente 1, 2 o 3 radicales).

35 **[0009]** El término plagas significa plagas de artrópodos (incluyendo insectos y arácnidos) y helmintos (incluyendo nemátodos).

[0010] En las definiciones preferidas siguientes se debe entender en general que donde los símbolos no se definen específicamente deben entenderse tal como se describió previamente en la descripción.

[0011] Preferentemente R¹ es CN.

40 Preferentemente R² y R^{2a} son cada uno Cl.

Preferentemente R³ y R⁵ son cada uno CF₃.

Preferentemente R⁴ es H o alquilo-($\text{C}_1\text{-C}_6$).

45 Preferentemente R⁶ es alquilo-($\text{C}_2\text{-C}_8$), alquenilo-($\text{C}_4\text{-C}_8$), cicloalquilo-($\text{C}_3\text{-C}_7$)- alquilo-($\text{C}_1\text{-C}_6$) o fenil-alquilo -($\text{C}_1\text{-C}_6$), estando los cuatro últimos grupos mencionados no sustituidos o sustituidos (en las partes alquilo o alquenilo) por uno o varios radicales X-Z; o un radical saturado heterociclilo- alquilo-($\text{C}_1\text{-C}_6$), que está no sustituido o sustituido (en el anillo heterociclilo) por uno o dos radicales Z¹.

[0012] Una clase preferida de compuestos de fórmula (I) son aquellos en los que:

R¹ es CN.

R² y R^{2a} son cada uno Cl.

R³ es CF₃.

5 R⁴ es H, alquilo-(C₁-C₈) donde el último grupo mencionado es no sustituido o sustituido por uno o varios radicales seleccionados del grupo constituido por halógeno, cicloalquilo-(C₃-C₇), CN, NO₂, R⁷, COR⁶, R⁹ y CO₂R⁸;

R⁵ es haloalquilo-(C₁-C₃); y

R⁶ es alquilo-(C₂-C₈), alqueno-(C₄-C₈), cicloalquilo-(C₃-C₇)- alquilo-(C₁-C₆) o fenil-alquilo -(C₁-C₆), estando los 4 últimos grupos mencionados no sustituidos o sustituidos (en las partes alquilo o alqueno) por uno o varios radicales

10 X-Z; o un radical saturado heterociclilo- alquilo-(C₁-C₆), que está no sustituido o sustituido (en el anillo heterociclilo) por uno o dos radicales Z¹;

[0013] Otra clase preferida de compuestos de fórmula (I) son aquellos en los que:

R¹ es CN.

R² y R^{2a} son cada uno Cl.

15 R³ es CF₃.

R⁴ es H o alquilo-(C₁-C₆);

R⁶ es alquilo-(C₂-C₈), alqueno-(C₄-C₈), cicloalquilo-(C₃-C₇)- alquilo-(C₁-C₆) o fenil-alquilo -(C₁-C₆), estando los 4 últimos grupos mencionados no sustituidos o sustituidos (en las partes alquilo o alqueno) por uno o varios radicales

20 X-Z; o un radical saturado heterociclilo- (CH₂), que está no sustituido o sustituido (en el anillo heterociclilo) por uno o más radicales Z¹; y

Z es H, cicloalquilo-(C₃-C₇), alcoxi-(C₁-C₆)- (CH₂O), alquilo-(C₁-C₆) o fenil-[alquilo -(C₁-C₆)]_s, R⁹-[alquilo -(C₁-C₆)]_t, CHO o R¹⁰-CO.

[0014] Otra clase preferida de compuestos de fórmula (I) son aquellos donde:

R¹ es CN.

25 R² y R^{2a} son cada uno Cl.

R³ es CF₃.

R⁴ es H o metilo;

R⁶ es alquilo-(C₂-C₆) o alqueno-(C₄-C₆) cuyos grupos están sustituidos por uno o dos radicales O-Z;

Z es H, alcoxi-(C₁-C₆)- (CH₂O)_r-alquilo-(C₁-C₆), fenil-(CH₂)_s, tetrahidropirano o R¹⁰-CO;

30 fenil-[alquilo -(C₁-C₆)]_s, R⁹-[alquilo -(C₁-C₆)]_t, CHO o R¹⁰-CO.

R¹⁰ es alcoxi-(C₁-C₈), O(CH₂)_qR⁷, fenilo o alquilo-(C₁-C₆) estando el último grupo mencionado no sustituido o sustituido por uno o varios radicales del grupo que consiste en halógeno, alcoxi-(C₁-C₆), CO₂H y CO₂- alquilo-(C₁-C₆),

donde R⁷ es fenilo;

q es 1;

35 r es 0, 1, 2 o 3; y

s es 0 o 1.

[0015] Otra clase preferida de compuestos de fórmula (I) son aquellos donde:

R¹ es CN.

R² y R^{2a} son cada uno Cl.

R³ es CF₃.

R⁴ es H o metilo;

R⁶ es alquilo-(C₂-C₆) sustituidos por uno o dos radicales O-Z;

Z es R¹⁰-CO;

5 R¹⁰ es cicloalquilo-(C₃-C₇), alcoxi-(C₁-C₆) o fenil O(CH₂)_q, O(CH₂)_q- cicloalquilo o piridilo-(C₃-C₇); o alquilo -(C₁-C₆) no sustituido o sustituido por uno o varios radicales del grupo que consiste en halógeno, alcoxi-(C₁-C₆), fenilo, CO₂H y CO₂alquilo-(C₁-C₆); y

q es 0 o 1.

[0016] Otra clase preferida de compuestos de fórmula (I) son aquellos donde:

10 R¹ es CN.

R² y R^{2a} son cada uno Cl.

R³ es CF₃.

R⁴ es H o metilo;

R⁶ es alquilo-(C₂-C₈) sustituido por uno o dos radicales O-Z;

15 Z es H, cicloalquilo-(C₃-C₇), fenil (CH₂)_s o piridilo; y

s es 0, 1 o 2.

[0017] Otra clase preferida de compuestos de fórmula (I) son aquellos donde:

R¹ es CN.

R² y R^{2a} son cada uno Cl.

20 R³ es CF₃.

R⁴ es H o metilo;

R⁶ es un radical saturado heterociclilo -CH₂, donde el radical heterociclilo es oxiranilo, tetrahidrofurano u oxido de 1,3 - dioxo-2-tialanilo-S o S, dióxido de carbono- S, 2-óxido de 1,3,2-dioxafosfolano-2-ol, 2-alcoxi-(C₁-C₆)-1,3, 2-óxido de 2-dioxafosfolano 2-fenil-1,3, 2-óxido de 2-dioxafosfolano, 2-óxido de 2-fenoxi-1,3,2-dioxafosfolano, o donde el radical heterociclilo es el 1,3-dioxolanilo sustituido o no sustituido por uno o más radicales seleccionados del grupo que consiste en alquilo -(C₁-C₆), fenilo, oxo y tioxo; o donde el radical heterociclilo es un ,3-dioxolanilo en el que un anillo de carbono forma un compuesto en espiral con un anillo de ciclohexilo; o donde el radical heterociclilo es el 1,4-dioxanilo no sustituido o sustituido por uno o más radicales oxo, o 1,4 dioxanilo en el que dos átomos de carbono del anillo adyacentes forman un anillo de benceno.

30 **[0018]** Otra clase preferida de compuestos de fórmula (I) son aquellos donde:

R¹ es CN;

R² y R^{2a} son cada uno Cl;

R³ y R⁵ son cada uno CF₃;

R⁴ es metilo;

35 R⁶ es tetrahidropiranilo - (CH₂) sustituido (en el anillo tetrahidropiranilo) por uno o más radicales OCO-alquilo-(C₁-C₆), o dos átomos de carbono del anillo adyacentes forman un anillo 1, 3-dioxolanilo sustituido por uno o más radicales alquilo-(C₁-C₆).

[0019] Otra clase preferida de compuestos de fórmula (I) son aquellos donde:

R¹ es CN;

40 R² y R^{2a} son cada uno Cl;

R³ y R⁵ son cada uno CF₃;

R⁴ es metilo;

R⁶ es alquilo-(C₂-C₈) sustituido por S(O)_m-Z;

5 Z es fenilo, piridilo o pirimidinilo estando el último grupo mencionado no sustituido o sustituido por uno o varios radicales alquilo-(C₁-C₆).

[0020] Otra clase preferida de compuestos de fórmula (I) son aquellos donde:

R¹ es CN;

R² y R^{2a} son cada uno Cl;

R³ y R⁵ son cada uno CF₃;

10 R⁴ es metilo;

R⁶ es alquilo-(C₁-C₆) sustituido por NR¹¹-Z;

R¹¹ es H o alquilo-(C₁-C₆);

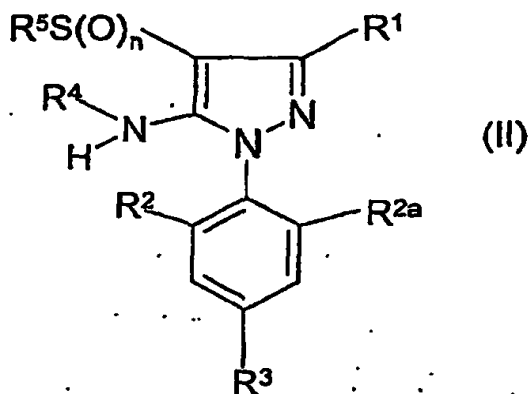
Z es R¹⁰-CO;

15 R¹⁰ es alcoxi-(C₁-C₆); o NR¹¹-Z juntos forman un anillo pirrolidinilo o piperidinilo, cuyos anillos están no sustituidos o sustituidos por uno o más grupos oxo;

[0021] Los compuestos de fórmula general (I) pueden ser preparados por la aplicación o adaptación de procedimientos conocidos (es decir procedimientos hasta ahora utilizados o descritos en la literatura química).

20 [0022] En la descripción de procesos siguiente cuando los símbolos que aparecen en las fórmulas no se definen específicamente, se entiende que están "tal como se ha definido más arriba" de acuerdo con la primera definición de cada símbolo en la descripción.

[0023] Según otra característica de la invención los compuestos de fórmula (I) donde R¹, R², R^{2a}, R³, R⁴, R⁵, R⁸ y n son tales como se han definido más arriba, se pueden preparar por la reacción de un compuesto de fórmula (II):



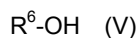
donde los diferentes valores son tales como se han más arriba, con un agente acilante de fórmula (III) o (IV):

25 R⁶-O-CO-L (III)

(R⁶-O-CO-2-O (IV)

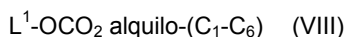
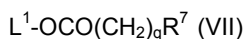
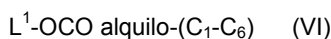
30 donde R⁶ es tal como se ha definido más arriba y L es un grupo saliente, en general halógeno y preferentemente Cloro, y una base; la base es preferentemente una base orgánica tal como una amina terciaria, por ejemplo trietilamina o etildiisopropilamina, o piridina, opcionalmente en presencia de un catalizador tal como 4-dimetilaminopiridina. La reacción se lleva a cabo generalmente con un disolvente tal como tetrahidrofurano, dioxano o acetonitrilo, a una temperatura de 0° C a 100° C.

[0024] Según otra característica de la invención los compuestos de fórmula (I) donde R^1 , R^2 , R^{2a} , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 y n son tales como se han definido más arriba, la reacción de un compuesto de fórmula (II) tal como se ha definido arriba, con fosgeno y un compuesto de fórmula (V) ;

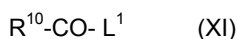
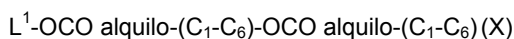
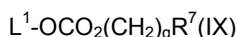


5 donde R^6 es tal como se ha definido más arriba, en presencia de una base; la base es preferentemente una base orgánica tal como una amina terciaria, por ejemplo trietilamina o etildiisopropilamina, o piridina, opcionalmente en presencia de un catalizador tal como 4-dimetilaminopiridina. La reacción se lleva a cabo generalmente con un disolvente tal como tetrahidrofurano o tolueno, a una temperatura de 0° C a 50° C.

10 **[0025]** Según otra característica de la invención los compuestos de fórmula (I) donde R^6 es alquilo-(C₂-C₈), alqueno-(C₄-C₈), cicloalquilo-(C₃-C₇)- alquilo-(C₁-C₆) o arilo- alquilo -(C₁-C₆), estando los 4 últimos grupos mencionados no sustituidos o sustituidos (en las partes alquilo o alqueno) por uno o varios radicales X-Z; o un radical saturado heterociclilo- alquilo-(C₁-C₆), que está no sustituido o sustituido (en el anillo heterociclilo) por uno o más radicales Z¹; X es O; Z es R^{10} -CO y Z¹ es OCO alquilo-(C₁-C₆), OCO(CH₂)_qR⁷, OCO₂ alquilo-(C₁-C₆), OCO₂CH₂R⁷ o OCO alquilo-(C₁-C₆)-OCO alquilo-(C₁-C₆), pueden ser preparados por la reacción de un compuesto
15 correspondiente de fórmula (II) donde Z es OH o Z¹ es OH, con un agente acilante de fórmula (VI), (VII), (VIII), (IX), (X) o (XI):



20



25 donde R^7 y R^{10} son tal como se definen en la reivindicación 1 y L1 es un grupo saliente, y una base. La base es preferentemente una base orgánica tal como una amina terciaria, por ejemplo trietilamina o etildiisopropilamina, o piridina, opcionalmente en presencia de un catalizador tal como 4-dimetilaminopiridina. La reacción se lleva a cabo generalmente con un disolvente tal como tetrahidrofurano, dioxano o acetonitrilo, a una temperatura de 0° C a 100° C.

30 **[0026]** Según otra característica de la invención los compuestos de fórmula (I) donde R^6 es alquilo-(C₂-C₈), alqueno-(C₄-C₈), cicloalquilo-(C₃-C₇)- alquilo-(C₁-C₆) o arilo- alquilo (C₁-C₆), estando los 4 últimos grupos mencionados no sustituidos o sustituidos (en las partes alquilo o alqueno) por dos grupos adyacentes OH; o un radical saturado heterociclilo- alquilo-(C₁-C₆), cuyos grupos están no sustituidos o sustituidos (en el anillo heterociclilo) por dos grupos adyacentes OH pueden ser preparados por hidrólisis de un derivado de acetal correspondiente (preferentemente el derivado de acetal cíclico 2,2-dimetiloxolanilo). La hidrólisis se realiza generalmente mediante un ácido fuerte tal como ácido clorhídrico, en un disolvente tal como un alcohol, por ejemplo,
35 etanol, a una temperatura de 0° C a 100° C.

40 **[0027]** Según otra característica de la invención los compuestos de fórmula (I) donde n es 1 ó 2, y R^1 , R^2 , R^{2a} , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 y n son tales como se han definido más arriba, se pueden preparar por oxidación del compuesto correspondiente en el que n es 0 o 1. La oxidación se realiza generalmente mediante un perácido tal como 3-cloroperbenzoico en un disolvente tal como diclorometano o 1,2-dicloroetano, a una temperatura de 0° C a la temperatura de reflujo del disolvente.

45 **[0028]** Los conjuntos de compuestos de la fórmula (I) que se pueden sintetizar mediante el proceso mencionado anteriormente también se pueden preparar de una manera paralela, y esto se realiza manualmente o de una manera semiautomática o totalmente automatizada. En este caso, es posible por ejemplo, automatizar el proceso de la reacción, el "work-up" o la purificación de los productos o de los intermedios. En total, esto debe entenderse que significa un procedimiento tal como se describe, por ejemplo, por S.H. DeWitt en "Annual Reports in Combinatorial Chemistry and Molecular Diversity: Automated Synthesis", Volumen 1, Verlag Escom 1997, páginas 69 a 77.

50 **[0029]** Se pueden utilizar un conjunto de aparatos comercialmente disponibles como los ofrecidos por, por ejemplo, Stem Corporation, Woodrolfe Road, Tollesbury, Essex, CM9 8SE, Inglaterra o H+P LaborTechnik GmbH, Bruckmannring 28, 85764 Oberschleißheim, Alemania o Radleys, Shirehill, Saffron Walden, Essex, Inglaterra, para el procedimiento en paralelo de la reacción y "work-up". Para la purificación en paralelo de compuestos de la fórmula

(I), o de intermedios obtenidos durante la preparación, se pueden utilizar entre otros, aparatos de cromatografía, por ejemplo, los de ISCO, Inc., 4700 Superior Street, Lincoln, NE 68504, Estados Unidos.

5 **[0030]** Los aparatos mencionados conducen a un procedimiento modular en el que las etapas individuales del proceso están automatizadas, pero las operaciones manuales se deben realizar entre las etapas del proceso. Esto se puede evitar mediante la utilización de sistemas de automatización semiintegrados o totalmente integrados, donde los módulos de automatización en cuestión son operador por ejemplo, robots. Dichos sistemas de automatización se puede obtener, por ejemplo, de Zymark Corporation, Zymark Center, Hopkinton, MA 01748, Estados Unidos.

10 **[0031]** Además de lo que se ha descrito aquí, los compuestos de la fórmula (I) se pueden prepara en parte o totalmente mediante métodos en soporte de fase sólida. Para este objetivo. Las etapas intermedias sintéticas o todas las etapas intermedias de la síntesis o de una síntesis adaptada para adecuar el procedimiento en cuestión están unidas a una resina sintética. Los métodos de síntesis en soporte de fase sólida se describen ampliamente en la literatura especializada, por ejemplo, Barry A. Bunin in "The Combinatorial index", Academic Press, 1998.

15 **[0032]** La utilización de métodos de síntesis en soporte de fase sólida permite una serie de protocolos que son conocidos de la literatura y que, a su vez, se pueden realizar manualmente o de una manera automatizada. Por ejemplo, el "método de la bolsita de té" (Houghten, US 4.631.211; Houghten et al., Proc. Natl. Acad. Sci, 1985, 82, 5131-5135), en el que se utilizan los productos por IRORI, 11149 North Torrey Pines Road, La Jolla, CA 92037, USA, pueden se semiautomatizado. La automatización de las síntesis en paralelo en soporte de fase sólida se realiza satisfactoriamente, por ejemplo, mediante aparatos por Argonaut TeCHnologies, Inc., 887 Industrial Road, 20 San Carlos, CA 94070, Estados Unidos o MultiSynTeCH GmbH, Wullener Feld 4, 58454 Witten, Alemania.

[0033] La preparación de los procesos descritos en la presente invención produce compuestos de la fórmula (I) en forma de conjuntos de sustancias que se denominan bibliotecas. La presente invención también se refiere a bibliotecas que comprenden por lo menos dos compuestos de la fórmula (I).

25 **[0034]** Los compuestos de fórmula (II), (III), (IV), (V), (VI), (VII), (VIII), (IX), (X) son conocidos o se pueden preparar mediante métodos conocidos.

[0035] Los ejemplos siguientes no limitativos ilustran la preparación de los compuestos de fórmula (I).

Ejemplos químicos

30 **[0036]** Los espectros NMR se realizaron en deuterocloroformo a no ser que se precise lo contrario, y los cambios se dan en ppm. En los ejemplos siguientes, las cantidades (y también los porcentajes) están basados en peso, a no ser que se precise lo contrario.

Ejemplo 1

(2,2-Dimetil-1,3-dioxolan-4-il)metil[1-(2,6-dicloro-4-trifluorometilfenil)-3-ciano-4-trifluorometilsulfinilpirazol-5-il]-N-metilcarbamato

35 **[0037]** A una solución de 1-(2,6-dicloro-4-trifluorometilfenilo)-3-ciano-4-trifluorometilsulfonylpirazole (3.0 g, 6.65 mmol) 2,2-dimetil-4-hidroxi-1,3-dioxolano (1,14 g, 8,6 mmol), diisopropilamina (2,56 g, 19,8 mmol) y 4-dimetilaminopiridina (0,24 g, 1,96 mmol) en tetrahidrofurano (50 ml) una solución en tolueno de fosgeno (4,6 g, 20%, 9,3 mmol) a 0-5° C. La mezcla se agitó a 20 ° C durante 24 horas. El workup extractivo (acetato de heptanoetil, agua) y la cromatografía dieron el producto del título (Compuesto 17-11, 3.54 g) como un aceite, 1 H-RMN: 1,32 y 1,37 (6H), 3,11 (3H), 3,63 (1 H), 4.03, 4.15 y 4.24 (2H), 7,80 (2H), 19F-RMN: -64,3; -72,6 a -73,5 (amplio).

40 Ejemplo 2

2,3-Dihidroxi-1-propil[1-(2,6-dicloro-4-trifluorometilfenil)-3-ciano-4-trifluorometilsulfinilpirazol-5-il]-N-metilcarbamato

45 **[0038]** A una mezcla de (2,2-dimetil-1,3-dioxolan-4-il) metil 1 - (2,6-dicloro-4-trifluorometilfenil)-3-ciano-4-(trifluorometilsulfinilpirazol-5-il) metilcarbamato (2,5 g, 4,1 mmol) en etanol (40 ml) se añadió ácido clorhídrico concentrado (0,41 g, 37%, 4,1 mmol). La mezcla se dejó a 20 ° C durante 24 horas. El workup extractivo (heptanoacetato de etilo, agua) dio el producto del título (El compuesto de número 13 a 02, 1,90 g) como un aceite espeso, 1H-RMN: 2,77 y 3,32 (1 H), 3,07 (3H), 3,50, 3,60, 3,88 (1H), 4,19 (2H), 7,82 (2H), 19F-RMN: -64,3; -72,8 (amplio).

Ejemplo 3

2,3-Dipropionilpropil [1-(2,6-dicloro-4-trifluorometilfenil)-3-ciano-4-trifluorometilsulfinilpirazol-5-il]-N-metilcarbamato

[0039] Se añadió anhídrido de ácido propiónico (0,55 g, 4,2 mmol) a una mezcla de 2,3-dihidroxiopropilo (0,80 g, 1,41 mmol), trietilamina (0,42 g, 4,2 mmol) y 4-dimetilaminopiridina (0,05 g, 0,4 mmol) en tetrahidrofurano (5 ml). La mezcla se calentó en condiciones de reflujo durante 7 horas. El workup extractivo (heptano-acetato de etilo, agua) dio el producto del título (El compuesto de número 8.9, 1.02 g) como un aceite; 1H-RMN: 1,13 y 2,32 (5H), 3,07 (3H), 4.07, 4.19, 4.37 (2H), 5,22 (1H), 7,80 (2H), 19F-RMN: -63,8; -72,2 a -73,6 (amplio).

Ejemplo de referencia 4

2-Metilthioetil [1-(2,6-dicloro-4-trifluorometilfenil)-3-ciano-4-trifluorometilsulfinilpirazol-5-il]-N-metilcarbamato

[0040] A una mezcla de 1 - (2,6-dicloro-4-trifluorometilfenil)-3-ciano-5-metilamino-4-trifluorometilsulfinilpirazole (0,60 g, 1,3 mmol) y una solución en tolueno de fosgeno (20%, 0,85 g, 1,7 mmol) en tetrahidrofurano (8 ml) se añadió una solución de metilthioetanol (0,13 g, 1,46 mmol), diisopropiletilamina (0,51 g, 4,0 mmol) y 4-dimetilaminopiridina (0,05 g, 0,4 mmol) en tetrahidrofurano (10 ml) a 0-5° C. La mezcla se agitó a 20 ° C durante 15 horas, luego en condiciones de reflujo durante 1 hora. El workup extractivo (heptano-acetato de etilo, agua) y la cromatografía dieron el producto del título (El número compuesto 24 a 02, 0,57 g) como un aceite; 1H-RMN: 2,08 (3H), 2,66 (2H), 3,10 (3H), 4,24 (2H), 7,80 (2H), 19F-RMN: -64,3; -72,7 (amplio).

[0041] Los siguientes compuestos preferidos mostrados en las tablas 1 a 25 también forman parte de la presente invención, y podían o se pueden preparar de acuerdo con, o análogamente a, los ejemplos 1 a 4 mencionados más arriba o los procedimientos generales mencionados más arriba. Allá donde se omiten los subíndices tras los átomos se entenderá que sí los hay, por ejemplo CH2 significa CH₂.

[0042] En las tablas Me significa metilo, Et significa etilo, Pr significa propilo, Bu significa butilo, C₅H₁₁ significa n-pentilo, C₆H₁₃ significa n-hexilo, C₂H₄ significa etileno (-CH₂CH₂-), cC₃H₅ significa ciclopropilo, NHC₃H₆ significa propileneamino (-CH₂CH₂CH₂NH -), y Ph significa fenilo. En la tabla 9, N (C₂H₄SMe) C₂H₄ significa una fracción CH₂CH₂N (CH₂CH₂SCH₃) -.

Los valores de desplazamiento de los espectros 19F-RMN se dan en ppm.

"Cpd No" significa número de compuesto.

[0043] En las tablas siguientes aquellos compuestos marcados con un asterisco (*) están incluidos solamente como ejemplos de referencia.

Tabla I: Compuestos de fórmula (I) en los que los sustituyentes tienen los siguientes significados:

| R ¹ es CN; R ² y R ^{2a} son cada uno Cl; R ³ y R ⁵ son cada uno CF ₃ ; R ⁴ es H; R ⁶ es CH ₂ CH ₂ OZ | | | |
|--|--|---|------------------|
| Cpd No | Z | n | mp. °C, NMR(ppm) |
| 01-01 | H | 0 | |
| 01-02 | H | 1 | 19F:-63.8;-73.5 |
| 01-03 | H | 2 | |
| *01-04 | CH ₃ | 0 | 19F:-43.4;-63.7 |
| *01-05 | CH ₃ | 1 | |
| *01-06 | CH ₃ | 2 | |
| *01-07 | C ₂ H ₅ | 0 | |
| *01-08 | C ₂ H ₅ | 1 | |
| *01-09 | C ₂ H ₅ | 2 | |
| 01-10 | C ₂ H ₄ OCH ₃ | 0 | |
| 01-11 | C ₂ H ₄ OCH ₃ | 1 | |
| 01-12 | C ₂ H ₄ OCH ₃ | 2 | |

ES 2 371 922 T3

| | | | |
|--------|----------------------|---|-------------------|
| 01-13 | C2H4OC2H5 | 0 | |
| 01-14 | C2H4OC2H5 | 1 | |
| 01-15 | C2H4OC2H5 | 2 | |
| 01-16 | C2H4OC2H4OCH3 | 0 | |
| 01-17 | C2H4OC2H4OCH3 | 1 | |
| 01-18 | C2H4OC2H4OCH3 | 2 | |
| 01-19 | C2H4OC2H4OC2H4OCH3 | 0 | |
| 01-20 | C2H4OC2H4OC2H4OCH3 | 1 | |
| 01-21 | C2H4OC2H4OC2H4OCH3 | 2 | |
| 01-22 | C2H4(OC2H4)3OCH3 | 0 | |
| 01-23 | C2H4(OC2H4)3OCH3 | 1 | |
| 01-24 | C2H4(OC2H4)3OCH3 | 2 | |
| 01-25 | C6H5 | 0 | |
| 01-26 | C6H5 | 1 | |
| 01-27 | C6H5 | 2 | |
| 01-28 | CH2C6H5 | 0 | |
| 01-29 | CH2C6H5 | 1 | |
| 01-30 | CH2C6H5 | 2 | |
| *01-31 | 2-Tetrahidropiraniil | 0 | |
| *01-32 | 2-Tetrahidropiraniil | 1 | 19F: -63.8; -72.6 |
| *01-33 | 2-Tetrahidropiraniil | 2 | |
| 01-34 | CO-CH3 | 0 | |
| 01-35 | CO-CH3 | 1 | |
| 01-36 | CO-CH3 | 2 | |
| 01-37 | CO-C2H5 | 0 | |
| 01-38 | CO-C2H5 | 1 | |
| 01-39 | CO-C2H5 | 2 | |
| 01-40 | COC6H5 | 0 | |
| 01-41 | COC6H5 | 1 | |
| 01-42 | COC6H5 | 2 | |
| 01-43 | CO-OCH3 | 0 | |
| 01-44 | CO-OCH3 | 1 | |
| 01-45 | CO-OCH3 | 2 | |

ES 2 371 922 T3

| | | | |
|-------|-------------|---|--|
| 01-46 | CO-OC2H5 | 0 | |
| 01-47 | CO-OC2H5 | 1 | |
| 01-48 | CO-OC2H5 | 2 | |
| 01-49 | CO-OCH2C6H5 | 0 | |
| 01-50 | CO-OCH2C6H5 | 1 | |
| 01-51 | CO-OCH2C6H5 | 2 | |
| 01-52 | COC2H4COOH | 0 | |
| 01-53 | COC2H4COOH | 1 | |
| 01-54 | COC2H4COOH | 2 | |
| 01-55 | COC2H4COOMe | 0 | |
| 01-56 | COC2H4COOMe | 1 | |
| 01-57 | COC2H4COOMe | 2 | |
| 01-58 | COC2H4COOEt | 0 | |
| 01-59 | COC2H4COOEt | 1 | |
| 01-60 | COC2H4COOEt | 2 | |
| 01-61 | COCF3 | 0 | |
| 01-62 | COCF3 | 1 | |
| 01-63 | COCF3 | 2 | |
| 01-64 | COCH2OCH3 | 0 | |
| 01-65 | COCH2OCH3 | 1 | |
| 01-66 | COCH2OCH3 | 2 | |
| 01-67 | COCH2OC2H5 | 0 | |
| 01-68 | COCH2OC2H5 | 1 | |
| 01-69 | COCH2OC2H5 | 2 | |

ES 2 371 922 T3

Tabla 2: Compuestos de fórmula (I) en los que los sustituyentes tienen los siguientes significados:

| R ¹ es CN; R ² y R ^{2a} son cada uno Cl; R ³ y R ⁵ son cada uno CF ₃ ; R ⁴ es Me; R ⁶ es CH ₂ CH ₂ OZ | | | |
|---|--|---|---------------------------------|
| Cpd No | Z | n | mp. °C, NMR(ppm) |
| 02-01 | H | 0 | |
| 02-02 | H | 1 | ¹⁹ F: -64.3; -72.7 |
| 02-03 | H | 2 | |
| *02-04 | CH ₃ | 0 | ¹⁹ F: -43.0; -63.8 |
| *02-05 | CH ₃ | 1 | |
| *02-06 | CH ₃ | 2 | |
| *02-07 | C ₂ H ₅ | 0 | |
| *02-08 | C ₂ H ₅ | 1 | |
| *02-09 | C ₂ H ₅ | 2 | |
| 02-10 | C ₂ H ₄ OCH ₃ | 0 | |
| 02-11 | C ₂ H ₄ OCH ₃ | 1 | |
| 02-12 | C ₂ H ₄ OCH ₃ | 2 | |
| 02-13 | C ₂ H ₄ OC ₂ H ₅ | 0 | |
| 02-14 | C ₂ H ₄ OC ₂ H ₅ | 1 | |
| 02-15 | C ₂ H ₄ OC ₂ H ₅ | 2 | |
| 02-16 | C ₂ H ₄ OC ₂ H ₄ OCH ₃ | 0 | |
| 02-17 | C ₂ H ₄ OC ₂ H ₄ OCH ₃ | 1 | ¹⁹ F: -63.8; -73.0 |
| 02-18 | C ₂ H ₄ OC ₂ H ₄ OCH ₃ | 2 | |
| 02-19 | C ₂ H ₄ OC ₂ H ₄ OC ₂ H ₄ OCH ₃ | 0 | |
| 02-20 | C ₂ H ₄ OC ₂ H ₄ OC ₂ H ₄ OCH ₃ | 1 | ¹⁹ F: -63.8; -72.9br |
| 02-21 | C ₂ H ₄ OC ₂ H ₄ OC ₂ H ₄ OCH ₃ | 2 | |
| 02-22 | C ₂ H ₄ (OC ₂ H ₄) ₃ OCH ₃ | 0 | |
| 02-23 | C ₂ H ₄ (OC ₂ H ₄) ₃ OCH ₃ | 1 | |
| 02-24 | C ₂ H ₄ (OC ₂ H ₄) ₃ OCH ₃ | 2 | |
| 02-25 | C ₆ H ₅ | 0 | |
| 02-26 | C ₆ H ₅ | 1 | |
| 02-27 | C ₆ H ₅ | 2 | |
| 02-28 | CH ₂ C ₆ H ₅ | 0 | |
| 02-29 | CH ₂ C ₆ H ₅ | 1 | |

ES 2 371 922 T3

| | | | |
|--------|---|----|---------------------------|
| 02-30 | CH ₂ C ₆ H ₅ | 2 | |
| *02-31 | 2-Tetrahidropyranil | 0 | |
| *02-32 | 2-Tetrahidropyranil | 1 | 19F:-63.8;-72.1 a 73.0,br |
| *02-33 | 2-Tetrahidropyranil | 2 | |
| 02-34 | CO-CH ₃ | 0 | |
| 02-35 | CO-CH ₃ | 1 | 19F:-63.8;-72.9br |
| 02-36 | CO-CH ₃ | 2 | |
| 02-37 | CO-C ₂ H ₅ | 0 | |
| 02-38 | CO-C ₂ H ₅ | 1 | |
| 02-39 | CO-C ₂ H ₅ | 2 | |
| 02-40 | COC ₆ H ₅ | 0 | |
| 02-41 | COC ₆ H ₅ | 1 | 19F:-63.8;-72.0 a 73.0 |
| 02-42 | COC ₆ H ₅ | 2 | |
| 02-43 | CO-OCH ₃ | 0 | |
| 02-44 | CO-OCH ₃ | 1 | |
| 02-45 | CO-OCH ₃ | 2 | |
| 02-46 | CO-OC ₂ H ₅ | 0 | |
| 02-47 | CO-OC ₂ H ₅ | 1 | |
| 02-48 | CO-OC ₂ H ₅ | 2 | |
| 02-49 | CO-OCH ₂ C ₆ H ₅ | 0 | |
| 02-50 | CO-OCH ₂ C ₆ H ₅ | 1 | |
| 02-51 | CO-OCH ₂ C ₆ H ₅ | 2 | |
| 02-52 | COC ₂ H ₄ COOH | 0 | |
| 02-53 | COC ₂ H ₄ COOH | 1 | 19F:-64.3;-73.3br |
| 02-54 | COC ₂ H ₄ COOH | 2 | |
| 02-55 | COC ₂ H ₄ COOMe | 0 | |
| 02-56 | COC ₂ H ₄ COOMe | 1 | |
| 02-57 | COC ₂ H ₄ COOMe | 2 | |
| 02-58 | COC ₂ H ₄ COOEt | 10 | |
| 02-59 | COC ₂ H ₄ COOEt | 1 | |
| 02-60 | COC ₂ H ₄ COOEt | 2 | |
| 02-61 | COCF ₃ | 0 | |
| 02-62 | COCF ₃ | 1 | |

ES 2 371 922 T3

| | | | |
|-------|--|---|--|
| 02-63 | COCF ₃ | 2 | |
| 02-64 | COCH ₂ OCH ₃ | 0 | |
| 02-65 | COCH ₂ OCH ₃ | 1 | |
| 02-66 | COCH ₂ OCH ₃ | 2 | |
| 02-67 | COCH ₂ OC ₂ H ₅ | 0 | |
| 02-68 | COCH ₂ OC ₂ H ₅ | 1 | |
| 02-69 | COCH ₂ OC ₂ H ₅ | 2 | |

Tabla 3: Compuestos de fórmula (I) en los que los sustituyentes tienen los siguientes significados:

R¹ es CN; R² y R^{2a} son cada uno Cl; R³ y R⁵ son cada uno CF₃; R⁴ es Me; R⁶ es CH₂CH₂CH₂OZ

| Cpd No | Z | n | mp. °C, NMR(ppm) |
|--------|--|---|------------------|
| 03-01 | H | 0 | |
| 03-02 | H | 1 | |
| 03-03 | H | 2 | |
| *03-04 | CH ₃ | 0 | |
| *03-05 | CH ₃ | 1 | |
| *03-06 | CH ₃ | 2 | |
| *03-07 | C ₂ H ₅ | 0 | |
| *03-08 | C ₂ H ₅ | 1 | |
| *03-09 | C ₂ H ₅ | 2 | |
| 03-10 | C ₂ H ₄ OCH ₃ | 0 | |
| 03-11 | C ₂ H ₄ OCH ₃ | 1 | |
| 03-12 | C ₂ H ₄ OCH ₃ | 2 | |
| 03-13 | C ₂ H ₄ OC ₂ H ₅ | 0 | |
| 03-14 | C ₂ H ₄ OC ₂ H ₅ | 1 | |
| 03-15 | C ₂ H ₄ OC ₂ H ₅ | 2 | |
| 03-16 | C ₂ H ₄ OC ₂ H ₄ OCH ₃ | 0 | |
| 03-17 | C ₂ H ₄ OC ₂ H ₄ OCH ₃ | 1 | |
| 03-18 | C ₂ H ₄ OC ₂ H ₄ OCH ₃ | 2 | |
| 03-19 | C ₂ H ₄ OC ₂ H ₄ OC ₂ H ₄ OCH ₃ | 0 | |
| 03-20 | C ₂ H ₄ OC ₂ H ₄ OC ₂ H ₄ OCH ₃ | 1 | |
| 03-21 | C ₂ H ₄ OC ₂ H ₄ OC ₂ H ₄ OCH ₃ | 2 | |
| 03-22 | C ₂ H ₄ (OC ₂ H ₄) ₃ OCH ₃ | 0 | |

ES 2 371 922 T3

| | | | |
|--------|---------------------|---|-----------------|
| 03-23 | C2H4(OC2H4)3OCH3 | 1 | |
| 03-24 | C2H4(OC2H4)3OCH3 | 2 | |
| 03-25 | C6H5 | 0 | |
| 03-26 | C6H5 | 1 | 19F:-63.8;-72.6 |
| 03-27 | C6H5 | 2 | |
| 03-28 | CH2C6H5 | 0 | |
| 03-29 | CH2C6H5 | 1 | |
| 03-30 | CH2C6H5 | 2 | |
| *03-31 | 2-Tetrahidropyranil | 0 | |
| *03-32 | 2-Tetrahidropyranil | 1 | |
| *03-33 | 2-Tetrahidropyranil | 2 | |
| 03-34 | CO-CH3 | 0 | |
| 03-35 | CO-CH3 | 1 | 19F:-63.8;-72.5 |
| 03-36 | CO-CH3 | 2 | |
| 03-37 | CO-C2H5 | 0 | |
| 03-38 | CO-C2H5 | 1 | |
| 03-39 | CO-C2H5 | 2 | |
| 03-40 | COC6H5 | 0 | |
| 03-41 | COC6H5 | 1 | |
| 03-42 | COC6H5 | 2 | |
| 03-43 | CO-OCH3 | 0 | |
| 03-44 | CO-OCH3 | 1 | |
| 03-45 | CO-OCH3 | 2 | |
| 03-46 | CO-OC2H5 | 0 | |
| 03-47 | CO-OC2H5 | 1 | |
| 03-48 | CO-OC2H5 | 2 | |
| 03-49 | CO-OCH2C6H5 | 0 | |
| 03-50 | CO-OCH2C6H5 | 1 | |
| 03-51 | CO-OCH2C6H5 | 2 | |
| 03-52 | COC2H4COOH | 0 | |
| 03-53 | COC2H4COOH | 1 | |
| 03-54 | COC2H4COOH | 2 | |
| 03-55 | COC2H4COOMe | 0 | |

ES 2 371 922 T3

| | | | |
|-------|-------------|---|--|
| 03-56 | COC2H4COOMe | 1 | |
| 03-57 | COC2H4COOMe | 2 | |
| 03-58 | COC2H4COOEt | 0 | |
| 03-59 | COC2H4COOEt | 1 | |
| 03-60 | COC2H4COOEt | 2 | |
| 03-61 | COCF3 | 0 | |
| 03-62 | COCF3 | 1 | |
| 03-63 | COCF3 | 2 | |
| 03-64 | COCH2OCH3 | 0 | |
| 03-65 | COCH2OCH3 | 1 | |
| 03-66 | COCH2OCH3 | 2 | |
| 03-67 | COCH2OC2H5 | 0 | |
| 03-68 | COCH2OC2H5 | 1 | |
| 03-69 | COCH2OC2H5 | 2 | |

Tabla 4: Compuestos de fórmula (I) en los que los sustituyentes tienen los siguientes significados:

R¹ es CN; R² y R^{2a} son cada uno Cl; R³ y R⁵ son cada uno CF₃; R⁴ es Me; R⁶ es CH₂C(Me)₂CH₂OZ

| Cpd No | Z | n | mp. °C, NMR(ppm) |
|--------|-----------|---|------------------|
| 04-01 | H | 0 | |
| 04-02 | H | 1 | |
| 04-03 | H | 2 | |
| *04-04 | CH3 | 0 | |
| *04-05 | CH3 | 1 | |
| *04-06 | CH3 | 2 | |
| *04-07 | C2H5 | 0 | |
| *04-08 | C2H5 | 1 | |
| *04-09 | C2H5 | 2 | |
| 04-10 | C2H4OCH3 | 0 | |
| 04-11 | C2H4OCH3 | 1 | |
| 04-12 | C2H4OCH3 | 2 | |
| 04-13 | C2H4OC2H5 | 0 | |
| 04-14 | C2H4OC2H5 | 1 | |
| 04-15 | C2H4OC2H5 | 2 | |

ES 2 371 922 T3

| | | | |
|--------|---------------------|----|-------------------------|
| 04-16 | C2H4OC2H4OCH3 | 0 | |
| 04-17 | C2H4OC2H4OCH3 | 1 | |
| 04-18 | C2H4OC2H4OCH3 | 2 | |
| 04-19 | C2H4OC2H4OC2H4OCH3 | 0 | |
| 04-20 | C2H4OC2H4OC2H4OCH3 | 1 | |
| 04-21 | C2H4OC2H4OC2H4OCH3 | 2 | |
| 04-22 | C2H4(OC2H4)3OCH3 | 0 | |
| 04-23 | C2H4(OC2H4)3OCH3 | 11 | |
| 04-24 | C2H4(OC2H4)3OCH3 | 2 | |
| 04-25 | C6H5 | 0 | |
| 04-26 | C6H5 | 1 | |
| 04-27 | C6H5 | 2 | |
| 04-28 | CH2C6H5 | 0 | |
| 04-29 | CH2C6H5 | 1 | |
| 04-30 | CH2C6H5 | 2 | |
| *04-31 | 2-Tetrahidropyranil | 0 | |
| *04-32 | 2-Tetrahidropyranil | 1 | |
| *04-33 | 2-Tetrahidropyranil | 2 | |
| 04-34 | CO-CH3 | 0 | |
| 04-35 | CO-CH3 | 1 | 19F:-63.8;-72.1to73.2br |
| 04-36 | CO-CH3 | 2 | |
| 04-37 | CO-C2H5 | 0 | |
| 04-38 | CO-C2H5 | 1 | |
| 04-39 | CO-C2H5 | 2 | |
| 04-40 | COC6H5 | 0 | |
| 04-41 | COC6H5 | 1 | |
| 04-42 | COC6H5 | 2 | |
| 04-43 | CO-OCH3 | 0 | |
| 04-44 | CO-OCH3 | 1 | |
| 04-45 | CO-OCH3 | 2 | |
| 04-46 | CO-OC2H5 | 0 | |
| 04-47 | CO-OC2H5 | 1 | |
| 04-48 | CO-OC2H5 | 2 | |

| | | | |
|-------|---|----|--|
| 04-49 | CO-OCH ₂ C ₆ H ₅ | 10 | |
| 04-50 | CO-OCH ₂ C ₆ H ₅ | 1 | |
| 04-51 | CO-OCH ₂ C ₆ H ₅ | 2 | |
| 04-52 | COC ₂ H ₄ COOH | 0 | |
| 04-53 | COC ₂ H ₄ COOH | 1 | |
| 04-54 | COC ₂ H ₄ COOH | 2 | |
| 04-55 | COC ₂ H ₄ COOMe | 0 | |
| 04-56 | COC ₂ H ₄ COOMe | 1 | |
| 04-57 | COC ₂ H ₄ COOMe | 2 | |
| 04-58 | COC ₂ H ₄ COOEt | 0 | |
| 04-59 | COC ₂ H ₄ COOEt | 1 | |
| 04-60 | COC ₂ H ₄ COOEt | 2 | |
| 04-61 | COCF ₃ | 0 | |
| 04-62 | COCF ₃ | 1 | |
| 04-63 | COCF ₃ | 2 | |
| 04-64 | COCH ₂ OCH ₃ | 0 | |
| 04-65 | COCH ₂ OCH ₃ | 1 | |
| 04-66 | COCH ₂ OCH ₃ | 2 | |
| 04-67 | COCH ₂ OC ₂ H ₅ | 0 | |
| 04-68 | COCH ₂ OC ₂ H ₅ | 1 | |
| 04-69 | COCH ₂ OC ₂ H ₅ | 2 | |

Tabla 5: Compuestos de fórmula (I) en los que los sustituyentes tienen los siguientes significados:

| R ¹ es CN; R ² y R ^{2a} son cada uno Cl; R ³ y R ⁶ son cada uno CF ₃ ; R ⁴ es H; R ⁶ es CH ₂ CH=CHCH ₂ OZ | | | |
|---|-------------------------------|---|------------------|
| Cpd No | Z | n | mp. °C, NMR(ppm) |
| 05-01 | H | 0 | |
| 05-02 | H | 1 | |
| 05-03 | H | 2 | |
| *05-04 | CH ₃ | 0 | |
| *05-05 | CH ₃ | 1 | |
| *05-06 | CH ₃ | 2 | |
| *05-07 | C ₂ H ₅ | 0 | |
| *05-08 | C ₂ H ₅ | 1 | |

ES 2 371 922 T3

| | | | |
|--------|---------------------|---|-------------------|
| 05-09 | C2H5 | 2 | |
| 05-10 | C2H4OCH3 | 0 | |
| 05-11 | C2H4OCH3 | 1 | |
| 05-12 | C2H4OCH3 | 2 | |
| 05-13 | C2H4OC2H5 | 0 | |
| 05-14 | C2H4OC2H5 | 1 | |
| 05-15 | C2H4OC2H5 | 2 | |
| 05-16 | C2H4OC2H4OCH3 | 0 | |
| 05-17 | C2H4OC2H4CH3 | 1 | |
| 05-18 | C2H4OC2H4OCH3 | 2 | |
| 05-19 | C2H46C2H4OC2H4OCH3 | 0 | |
| 05-20 | C2H40C2H40C2H40CH3 | 1 | |
| 05-21 | C2H4OC2H4OC2H4OCH3 | 2 | |
| 05-22 | C2H4(OC2H4)30CH3 | 0 | |
| 05-23 | C2H4(OC2H4)30CH3 | 1 | |
| 05-24 | C2H4(OC2H4)30CH3 | 2 | |
| 05-25 | C6H5 | 0 | |
| 05-26 | C6H5 | 1 | |
| 05-27 | C6H5 | 2 | |
| 05-28 | CH2C6H5 | 0 | |
| 05-29 | CH2C6H5 | 1 | |
| 05-30 | CH2C6H5 | 2 | |
| *05-31 | 2-Tetrahidropyranil | 0 | |
| *05-32 | 2-Tetrahidropyranil | 1 | |
| *05-33 | 2-Tetrahidropyranil | 2 | |
| 05-34 | CO-CH3 | 0 | |
| 05-35 | CO-CH3 | 1 | |
| 05-36 | CO-CH3 | 2 | |
| 05-37 | CO-C2H5 | 0 | |
| 05-38 | CO-C2H5 | 1 | 19F:-63.6;-72.5br |
| 05-39 | CO-C2H5 | 2 | |
| 05-40 | COC6H5 | 0 | |
| 05-41 | COC6H5 | 1 | |

ES 2 371 922 T3

| | | | |
|-------|-------------|---|--|
| 05-42 | COC6H5 | 2 | |
| 05-43 | CO-OCH3 | 0 | |
| 05-44 | CO-OCH3 | 1 | |
| 05-45 | CO-OCH3 | 2 | |
| 05-46 | CO-OC2H5 | 0 | |
| 05-47 | CO-OC2H5 | 1 | |
| 05-48 | CO-OC2H5 | 2 | |
| 05-49 | CO-OCH2C6H5 | 0 | |
| 05-50 | CO-OCH2C6H5 | 1 | |
| 05-51 | CO-OCH2C6H5 | 2 | |
| 05-52 | COC2H4COOH | 0 | |
| 05-53 | COC2H4COOH | 1 | |
| 05-54 | COC2H4COOH | 2 | |
| 05-55 | COC2H4COOMe | 0 | |
| 05-56 | COC2H4COOMe | 1 | |
| 05-57 | COC2H4COOMe | 2 | |
| 05-58 | COC2H4COOEt | 0 | |
| 05-59 | COC2H4COOEt | 1 | |
| 05-60 | COC2H4COOEt | 2 | |
| 05-61 | COCF3 | 0 | |
| 05-62 | COCF3 | 1 | |
| 05-63 | COCF3 | 2 | |
| 05-64 | COCH2OCH3 | 0 | |
| 05-65 | COCH2OCH3 | 1 | |
| 05-66 | COCH2OCH3 | 2 | |
| 05-67 | COCH2OC2H5 | 0 | |
| 05-68 | COCH2OC2H5 | 1 | |
| 05-69 | COCH2OC2H5 | 2 | |

Tabla 6: Compuestos de fórmula (I) en los que los sustituyentes tienen los siguientes significados:

| R ¹ es CN; R ² y R ^{2a} son cada uno Cl; R ³ y R ⁵ son cada uno CF ₃ ; R ⁴ es Me; R ⁶ es CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ OZ | | | |
|---|--|---|------------------|
| Cpd No | Z | n | mp. °C, NMR(ppm) |
| 06-01 | H | 0 | |
| 06-02 | H | 1 | |
| 06-03 | H | 2 | |
| *06-04 | CH ₃ | 0 | |
| *06-05 | CH ₃ | 1 | |
| *06-06 | CH ₃ | 2 | |
| *06-07 | C ₂ H ₅ | 0 | |
| *06-08 | C ₂ H ₅ | 1 | |
| *06-09 | C ₂ H ₅ | 2 | |
| 06-10 | C ₂ H ₄ OCH ₃ | 0 | |
| 06-11 | C ₂ H ₄ OCH ₃ | 1 | |
| 06-12 | C ₂ H ₄ OCH ₃ | 2 | |
| 06-13 | C ₂ H ₄ OC ₂ H ₅ | 0 | |
| 06-14 | C ₂ H ₄ OC ₂ H ₅ | 1 | |
| 06-15 | C ₂ H ₄ OC ₂ H ₅ | 2 | |
| 06-16 | C ₂ H ₄ OC ₂ H ₄ OCH ₃ | 0 | |
| 06-17 | C ₂ H ₄ OC ₂ H ₄ OCH ₃ | 1 | |
| 06-18 | C ₂ H ₄ OC ₂ H ₄ OCH ₃ | 2 | |
| 06-19 | C ₂ H ₄ OC ₂ H ₄ OC ₂ H ₄ OCH ₃ | 0 | |
| 06-20 | C ₂ H ₄ OC ₂ H ₄ OC ₂ H ₄ OCH ₃ | 1 | |
| 06-21 | C ₂ H ₄ OC ₂ H ₄ OC ₂ H ₄ OCH ₃ | 2 | |
| 06-22 | C ₂ H ₄ (OC ₂ H ₄) ₃ OCH ₃ | 0 | |
| 06-23 | C ₂ H ₄ (OC ₂ H ₄) ₃ OCH ₃ | 1 | |
| 06-24 | C ₂ H ₄ (OC ₂ H ₄) ₃ OCH ₃ | 2 | |
| 06-25 | C ₆ H ₅ | 0 | |
| 06-26 | C ₆ H ₅ | 1 | |
| 06-27 | C ₆ H ₅ | 2 | |
| 06-28 | CH ₂ C ₆ H ₅ | 0 | |
| 06-29 | CH ₂ C ₆ H ₅ | 1 | |

ES 2 371 922 T3

| | | | |
|--------|---|---|--|
| 06-30 | CH ₂ C ₆ H ₅ | 2 | |
| *06-31 | 2-Tetrahidropyranil | 0 | |
| *06-32 | 2-Tetrahidropyranil | 1 | |
| *06-33 | 2-Tetrahidropyranil | 2 | |
| 06-34 | CO-CH ₃ | 0 | |
| 06-35 | CO-CH ₃ | 1 | |
| 06-36 | CO-CH ₃ | 2 | |
| 06-37 | CO-C ₂ H ₅ | 0 | |
| 06-38 | CO-C ₂ H ₅ | 1 | |
| 06-39 | CO-C ₂ H ₅ | 2 | |
| 06-40 | COC ₆ H ₅ | 0 | |
| 06-41 | COC ₆ H ₅ | 1 | |
| 06-42 | COC ₆ H ₅ | 2 | |
| 06-43 | CO-OCH ₃ | 0 | |
| 06-44 | CO-OCH ₃ | 1 | |
| 06-45 | CO-OCH ₃ | 2 | |
| 06-46 | CO-OC ₂ H ₅ | 0 | |
| 06-47 | CO-OC ₂ H ₅ | 1 | |
| 06-48 | CO-OC ₂ H ₅ | 2 | |
| 06-49 | CO-OCH ₂ C ₆ H ₅ | 0 | |
| 06-50 | CO-OCH ₂ C ₆ H ₅ | 1 | |
| 06-51 | CO-OCH ₂ C ₆ H ₅ | 2 | |
| 06-52 | COC ₂ H ₄ COOH | 0 | |
| 06-53 | COC ₂ H ₄ COOH | 1 | |
| 06-54 | COC ₂ H ₄ COOH | 2 | |
| 06-55 | COC ₂ H ₄ COOMe | 0 | |
| 06-56 | COC ₂ H ₄ COOMe | 1 | |
| 06-57 | COC ₂ H ₄ COOMe | 2 | |
| 06-58 | COC ₂ H ₄ COOEt | 0 | |
| 06-59 | COC ₂ H ₄ COOEt | 1 | |
| 06-60 | COC ₂ H ₄ COOEt | 2 | |
| 06-61 | COCF ₃ | 0 | |
| 06-62 | COCF ₃ | 1 | |

| | | | |
|-------|------------|---|--|
| 06-63 | COCF3 | 2 | |
| 06-64 | COCH2OCH3 | 0 | |
| 06-65 | COCH2OCH3 | 1 | |
| 06-66 | COCH2OCH3 | 2 | |
| 06-67 | COCH2OC2H5 | 0 | |
| 06-68 | COCH2OC2H5 | 1 | |
| 06-69 | COCH2OC2H5 | 2 | |

Tabla 7: Compuestos de fórmula (I) en los que los sustituyentes tienen los siguientes significados:

| R ¹ es CN; R ² y R ^{2a} son cada uno Cl; R ³ y R ⁶ son cada uno CF ₃ ; R ⁴ es Me; R ⁶ es CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ CH ₂ OZ | | | |
|---|--------------------|----|------------------|
| Cpd No | Z | n | mp. °C, NMR(ppm) |
| 07-01 | H | 0 | |
| 07-02 | H | 1 | |
| 07-03 | H | 2 | |
| *07-04 | CH3 | 0 | |
| *07-05 | CH3 | 1 | |
| *07-06 | CH3 | 2 | |
| *07-07 | C2H5 | 0 | |
| *07-08 | C2H5 | 1 | |
| *07-09 | C2H5 | 2 | |
| 07-10 | C2H4OCH3 | 10 | |
| 07-11 | C2H4OCH3 | 1 | |
| 07-12 | C2H4OCH3 | 2 | |
| 07-13 | C2H4OC2H5 | 0 | |
| 07-14 | C2H4OC2H5 | 1 | |
| 07-15 | C2H4OC2H5 | 2 | |
| 07-16 | C2H4OC2H4OCH3 | 0 | |
| 07-17 | C2H4OC2H4OCH3 | 1 | |
| 07-18 | C2H4OC2H4OCH3 | 2 | |
| 07-19 | C2H4OC2H4OC2H4OCH3 | 0 | |
| 07-20 | C2H4OC2H4OC2H4OCH3 | 1 | |
| 07-21 | C2H4OC2H4OC2H4OCH3 | 2 | |

ES 2 371 922 T3

| | | | |
|--------|---------------------|---|--|
| 07-22 | C2H4(OC2H4)3OCH3 | 0 | |
| 07-23 | C2H4(OC2H4)3OCH3 | 1 | |
| 07-24 | C2H4(OC2H4)3OCH3 | 2 | |
| 07-25 | C6H5 | 0 | |
| 07-26 | C6H5 | 1 | |
| 07-27 | C6H5 | 2 | |
| 07-28 | CH2C6H5 | 0 | |
| 07-29 | CH2C6H5 | 1 | |
| 07-30 | CH2C6H5 | 2 | |
| *07-31 | 2-Tetrahidropyranil | 0 | |
| *07-32 | 2-Tetrahidropyranil | 1 | |
| *07-33 | 2-Tetrahidropyranil | 2 | |
| 07-34 | CO-CH3 | 0 | |
| 07-35 | CO-CH3 | 1 | |
| 07-36 | CO-CH3 | 2 | |
| 07-37 | CO-C2H5 | 0 | |
| 07-38 | CO-C2H5 | 1 | |
| 07-39 | CO-C2H5 | 2 | |
| 07-40 | COC6H5 | 0 | |
| 07-41 | COC6H5 | 1 | |
| 07-42 | COC6H5 | 2 | |
| 07-43 | CO-OCH3 | 0 | |
| 07-44 | CO-OCH3 | 1 | |
| 07-45 | CO-OCH3 | 2 | |
| 07-46 | CO-OC2H5 | 0 | |
| 07-47 | CO-OC2H5 | 1 | |
| 07-48 | CO-OC2H5 | 2 | |
| 07-49 | CO-OCH2C6H5 | 0 | |
| 07-50 | CO-OCH2C6H5 | 1 | |
| 07-51 | CO-OCH2C6H5 | 2 | |
| 07-52 | COC2H4COOH | 0 | |
| 07-53 | COC2H4COOH | 1 | |
| 07-54 | COC2H4COOH | 2 | |

| | | | |
|-------|-------------|---|--|
| 07-55 | COC2H4COOMe | 0 | |
| 07-56 | COC2H4COOMe | 1 | |
| 07-57 | COC2H4COOMe | 2 | |
| 07-58 | COC2H4COOEt | 0 | |
| 07-59 | COC2H4COOEt | 1 | |
| 07-60 | COC2H4COOEt | 2 | |
| 07-61 | COCF3 | 0 | |
| 07-62 | COCF3 | 1 | |
| 07-63 | COCF3 | 2 | |
| 07-64 | COCH2OCH3 | 0 | |
| 07-65 | COCH2OCH3 | 1 | |
| 07-66 | COCH2OCH3 | 2 | |
| 07-67 | COCH2OC2H5 | 0 | |
| 07-68 | COCH2OC2H5 | 1 | |
| 07-69 | COCH2OC2H5 | 2 | |

Tabla 8: Compuestos de fórmula (I) en los que los sustituyentes tienen los siguientes significados:

R^1 es CN; R^2 and R^{2a} son cada uno Cl; R^3 and R^5 are each CF_3 ; R^4 es H; R^6 es $CH_2CH(OZ)CH_2OZ$ and Z es COR^{10}

| Cpd No | R^{10} | n | mp. °C, NMR(ppm) |
|--------|----------|---|------------------|
| 08-01 | H | 0 | |
| 08-02 | H | 1 | |
| 08-03 | H | 2 | |
| 08-04 | CH3 | 0 | |
| 08-05 | CH3 | 1 | |
| 08-06 | CH3 | 2 | |
| 08-07 | C2H5 | 0 | |
| 08-08 | C2H5 | 1 | |
| 08-09 | C2H5 | 2 | |
| 08-10 | C3H7 | 0 | |
| 08-11 | C3H7 | 1 | |
| 08-12 | C3H7 | 2 | |
| 08-13 | iC3H7 | 0 | |

ES 2 371 922 T3

| | | | |
|-------|------------|---|--|
| 08-14 | iC3H7 | 1 | |
| 08-15 | iC3H7 | 2 | |
| 08-16 | tBu | 0 | |
| 08-17 | tBu | 1 | |
| 08-18 | tBu | 2 | |
| 08-19 | C4H9 | 0 | |
| 08-20 | C4H9 | 1 | |
| 08-21 | C4H9 | 2 | |
| 08-22 | C5H11 | 0 | |
| 08-23 | C5H11 | 1 | |
| 08-24 | C5H11 | 2 | |
| 08-25 | C6H13 | 0 | |
| 08-26 | C6H13 | 1 | |
| 08-27 | C6H13 | 2 | |
| 08-28 | c-C3H5 | 0 | |
| 08-29 | c-C3H5 | 1 | |
| 08-30 | c-C3H5 | 2 | |
| 08-31 | c-C4H7 | 0 | |
| 08-32 | c-C4H7 | 1 | |
| 08-33 | c-C4H7 | 2 | |
| 08-34 | c-C5H9 | 0 | |
| 08-35 | c-C5H9 | 1 | |
| 08-36 | c-C5H9 | 2 | |
| 08-37 | c-C6H11 | 0 | |
| 08-38 | c-C6H11 | 1 | |
| 08-39 | c-C6H11 | 2 | |
| 08-40 | CH2C6H5 | 0 | |
| 08-41 | CH2C6H5 | 1 | |
| 08-42 | CH2C6H5 | 2 | |
| 08-43 | CH2CH2C6H5 | 0 | |
| 08-44 | CH2CH2C6H5 | 1 | |
| 08-45 | CH2CH2C6H5 | 2 | |
| 08-46 | C6H5 | 0 | |

ES 2 371 922 T3

| | | | |
|-------|------------|---|--|
| 08-47 | C6H5 | 1 | |
| 08-48 | C6H5 | 2 | |
| 08-49 | 3-Pyridyl | 0 | |
| 08-50 | 3-Pyridyl | 1 | |
| 08-51 | 3-Pyridyl | 2 | |
| 08-52 | OCH3 | 0 | |
| 08-53 | OCH3 | 1 | |
| 08-54 | OCH3 | 2 | |
| 08-55 | OC2H5 | 0 | |
| 08-56 | OC2H5 | 1 | |
| 08-57 | OC2H5 | 2 | |
| 08-58 | OC3H7 | 0 | |
| 08-59 | OC3H7 | 1 | |
| 08-60 | OC3H7 | 2 | |
| 08-61 | OiC3H7 | 0 | |
| 08-62 | OiC3H7 | 1 | |
| 08-63 | OiC3H7 | 2 | |
| 08-64 | OC4H9 | 0 | |
| 08-65 | OC4H9 | 1 | |
| 08-66 | OC4H9 | 2 | |
| 08-67 | OCH2C6H5 | 0 | |
| 08-68 | OCH2C6H5 | 1 | |
| 08-69 | OCH2C6H5 | 2 | |
| 08-70 | OCH2cC3H5 | 0 | |
| 08-71 | OCH2cC3H5 | 1 | |
| 08-72 | OCH2cC3H5 | 2 | |
| 08-73 | OCH2cC5H9 | 0 | |
| 08-74 | OCH2cC5H9 | 1 | |
| 08-75 | OCH2cC5H9 | 2 | |
| 08-76 | OCH2cC6H11 | 0 | |
| 08-77 | OCH2cC6H11 | 1 | |
| 08-78 | OCH2cC6H11 | 2 | |
| 08-79 | OcC5H9 | 0 | |

ES 2 371 922 T3

| | | | |
|--------|-------------|---|--|
| 08-80 | OcC5H9 | 1 | |
| 08-81 | OcC5H9 | 2 | |
| 08-82 | OcC6H11 | 0 | |
| 08-83 | OcC6H11 | 1 | |
| 08-84 | OcC6H11 | 2 | |
| 08-85 | CH2CH2COOH | 0 | |
| 08-86 | CH2CH2COOH | 1 | |
| 08-87 | CH2CH2COOH | 2 | |
| 08-88 | CH2CH2COOMe | 0 | |
| 08-89 | CH2CH2COOMe | 1 | |
| 08-90 | CH2CH2COOMe | 2 | |
| 08-91 | CH2CH2COOEt | 0 | |
| 08-92 | CH2CH2COOEt | 1 | |
| 08-93 | CH2CH2COOEt | 2 | |
| 08-94 | C3H6COOH | 0 | |
| 08-95 | C3H6COOH | 1 | |
| 08-96 | C3H6COOH | 2 | |
| 08-97 | C3H6COOMe | 0 | |
| 08-98 | C3H6COOMe | 1 | |
| 08-99 | C3H6COOMe | 2 | |
| 08-100 | C3H6COOEt | 0 | |
| 08-101 | C3H6COOEt | 1 | |
| 08-102 | C3H6COOEt | 2 | |
| 08-103 | CF3 | 0 | |
| 08-104 | CF3 | 1 | |
| 08-105 | CF3 | 2 | |
| 08-106 | CH2OCH3 | 0 | |
| 08-107 | CH2OCH3 | 1 | |
| 08-108 | CH2OCH3 | 2 | |
| 08-109 | CH2OC2H5 | 0 | |
| 08-110 | CH2OC2H5 | 1 | |
| 08-111 | CH2OC2H5 | 2 | |

Tabla 9: Compuestos de fórmula (I) en los que los sustituyentes tienen los siguientes significados:

| R ¹ es CN; R ² y R ^{2a} son cada uno Cl; R ³ y R ⁵ son cada uno CF ₃ ; R ⁴ es Me; R ⁶ es CH ₂ CH(OZ)CH ₂ OZ y Z es COR ¹⁰ | | | |
|--|---------------------------------|---|-------------------------|
| Cpd No | R ¹⁰ | n | mp. °C, NMR(ppm) |
| 09-01 | H | 0 | |
| 09-02 | H | 1 | |
| 09-03 | H | 2 | |
| 09-04 | CH ₃ | 0 | |
| 09-05 | CH ₃ | 1 | 19F:-63.8;-72.2 a -73.2 |
| 09-06 | CH ₃ | 2 | |
| 09-07 | C ₂ H ₅ | 0 | |
| 09-08 | C ₂ H ₅ | 1 | 19F:-63.8;-72.2 a -73.6 |
| 09-09 | C ₂ H ₅ | 2 | |
| 09-10 | C ₃ H ₇ | 0 | |
| 09-11 | C ₃ H ₇ | 1 | |
| 09-12 | C ₃ H ₇ | 2 | |
| 09-13 | iC ₃ H ₇ | 0 | |
| 09-14 | iC ₃ H ₇ | 1 | |
| 09-15 | iC ₃ H ₇ | 2 | |
| 09-16 | tBu | 0 | |
| 09-17 | tBu | 1 | |
| 09-18 | tBu | 2 | |
| 09-19 | C ₄ H ₉ | 0 | |
| 09-20 | C ₄ H ₉ | 1 | |
| 09-21 | C ₄ H ₉ | 2 | |
| 09-22 | C ₅ H ₁₁ | 0 | |
| 09-23 | C ₅ H ₁₁ | 1 | |
| 09-24 | C ₅ H ₁₁ | 2 | |
| 09-25 | C ₆ H ₁₃ | 0 | |
| 09-26 | C ₆ H ₁₃ | 1 | |
| 09-27 | C ₆ H ₁₃ | 2 | |
| 09-28 | c-C ₃ H ₅ | 0 | |
| 09-29 | c-C ₃ H ₅ | 1 | |

ES 2 371 922 T3

| | | | |
|-------|------------|---|--------------------------------------|
| 09-30 | c-C3H5 | 2 | |
| 09-31 | c-C4H7 | 0 | |
| 09-32 | c-C4H7 | 1 | |
| 09-33 | c-C4H7 | 2 | |
| 09-34 | c-C5H9 | 0 | |
| 09-35 | c-C5H9 | 1 | |
| 09-36 | c-C5H9 | 2 | |
| 09-37 | c-C6H11 | 0 | |
| 09-38 | c-C6H11 | 1 | |
| 09-39 | c-C6H11 | 2 | |
| 09-40 | CH2C6H5 | 0 | |
| 09-41 | CH2C6H5 | 1 | 19F:-63.8;-72.2br |
| 09-42 | CH2C6H5 | 2 | |
| 09-43 | CH2CH2C6H5 | 0 | |
| 09-44 | CH2CH2C6H5 | 1 | |
| 09-45 | CH2CH2C6H5 | 2 | |
| 09-46 | C6H5 | 0 | |
| 09-47 | C6H5 | 1 | 19F:-63.8;-72.1 ^a 73.8,br |
| 09-48 | C6H5 | 2 | |
| 09-49 | 3-Pyridyl | 0 | |
| 09-50 | 3-Pyridyl | 1 | |
| 09-51 | 3-Pyridyl | 2 | |
| 09-52 | OCH3 | 0 | |
| 09-53 | OCH3 | 1 | |
| 09-54 | OCH3 | 2 | |
| 09-55 | OC2H5 | 0 | |
| 09-56 | OC2H5 | 1 | |
| 09-57 | OC2H5 | 2 | |
| 09-58 | OC3H7 | 0 | |
| 09-59 | OC3H7 | 1 | |
| 09-60 | OC3H7 | 2 | |
| 09-61 | OiC3H7 | 0 | |
| 09-62 | OiC3H7 | 1 | |

ES 2 371 922 T3

| | | | |
|-------|-------------|---|--|
| 09-63 | OiC3H7 | 2 | |
| 09-64 | OC4H9 | 0 | |
| 09-65 | OC4H9 | 1 | |
| 09-66 | OC4H9 | 2 | |
| 09-67 | OCH2C6H5 | 0 | |
| 09-68 | OCH2C6H5 | 1 | |
| 09-69 | OCH2C6H5 | 2 | |
| 09-70 | OCH2cC3H5 | 0 | |
| 09-71 | OCH2cC3H5 | 1 | |
| 09-72 | OCH2cC3H5 | 2 | |
| 09-73 | OCH2cC5H9 | 0 | |
| 09-74 | OCH2cC5H9 | 1 | |
| 09-75 | OCH2cC5H9 | 2 | |
| 09-76 | OCH2cC6H11 | 0 | |
| 09-77 | OCH2cC6H11 | 1 | |
| 09-78 | OCH2cC6H11 | 2 | |
| 09-79 | OcC5H9 | 0 | |
| 09-80 | OcC5H9 | 1 | |
| 09-81 | OcC5H9 | 2 | |
| 09-82 | OcC6H11 | 0 | |
| 09-83 | OcC6H11 | 1 | |
| 09-84 | OcC6H11 | 2 | |
| 09-85 | CH2CH2COOH | 0 | |
| 09-86 | CH2CH2COOH | 1 | |
| 09-87 | CH2CH2COOH | 2 | |
| 09-88 | CH2CH2COOMe | 0 | |
| 09-89 | CH2CH2COOMe | 1 | |
| 09-90 | CH2CH2COOMe | 2 | |
| 09-91 | CH2CH2COOEt | 0 | |
| 09-92 | CH2CH2COOEt | 1 | |
| 09-93 | CH2CH2COOEt | 2 | |
| 09-94 | C3H6COOH | 0 | |
| 09-95 | C3H6COOH | 1 | |

| | | | |
|--------|-----------|---|--|
| 09-96 | C3H6COOH | 2 | |
| 09-97 | C3H6COOMe | 0 | |
| 09-98 | C3H6COOMe | 1 | |
| 09-99 | C3H6COOMe | 2 | |
| 09-100 | C3H6COOEt | 0 | |
| 09-101 | C3H6COOEt | 1 | |
| 09-102 | C3H6COOEt | 2 | |
| 09-103 | CF3 | 0 | |
| 09-104 | CF3 | 1 | |
| 09-105 | CF3 | 2 | |
| 09-106 | CH2OCH3 | 0 | |
| 09-107 | CH2OCH3 | 1 | |
| 09-108 | CH2OCH3 | 2 | |
| 09-109 | CH2OC2H5 | 0 | |
| 09-110 | CH2OC2H5 | 1 | |
| 09-111 | CH2OC2H5 | 2 | |

Tabla 10: Compuestos de fórmula (I) en los que los sustituyentes tienen los siguientes significados:

R^1 es CN; R^2 y R^{2a} son cada uno Cl; R^3 y R^5 son cada uno CF_3 ; R^4 es H; R^6 es $CH(CH_2OZ)CH_2OZ$ y Z es COR^{10}

| Cpd No | R^{10} | n | mp. °C, NMR(ppm) |
|--------|----------|---|------------------|
| 10-01 | H | 0 | |
| 10-02 | H | 1 | |
| 10-03 | H | 2 | |
| 10-04 | CH3 | 0 | |
| 10-05 | CH3 | 1 | |
| 10-06 | CH3 | 2 | |
| 10-07 | C2H5 | 0 | |
| 10-08 | C2H5 | 1 | |
| 10-09 | C2H5 | 2 | |
| 10-10 | C3H7 | 0 | |
| 10-11 | C3H7 | 1 | |
| 10-12 | C3H7 | 2 | |

ES 2 371 922 T3

| | | | |
|-------|------------|---|--|
| 10-13 | iC3H7 | 0 | |
| 10-14 | iC3H7 | 1 | |
| 10-15 | iC3H7 | 2 | |
| 10-16 | tBu | 0 | |
| 10-17 | tBu | 1 | |
| 10-18 | tBu | 2 | |
| 10-19 | C4H9 | 0 | |
| 10-20 | C4H9 | 1 | |
| 10-21 | C4H9 | 2 | |
| 10-22 | C5H11 | 0 | |
| 10-23 | C5H11 | 1 | |
| 10-24 | C5H11 | 2 | |
| 10-25 | C6H13 | 0 | |
| 10-26 | C6H13 | 1 | |
| 10-27 | C6H13 | 2 | |
| 10-28 | c-C3H5 | 0 | |
| 10-29 | c-C3H5 | 1 | |
| 10-30 | c-C3H5 | 2 | |
| 10-31 | c-C4H7 | 0 | |
| 10-32 | c-C4H7 | 1 | |
| 10-33 | c-C4H7 | 2 | |
| 10-34 | c-C5H9 | 0 | |
| 10-35 | c-C5H9 | 1 | |
| 10-36 | c-C5H9 | 2 | |
| 10-37 | c-C6H11 | 0 | |
| 10-38 | c-C6H11 | 1 | |
| 10-39 | c-C6H11 | 2 | |
| 10-40 | CH2C6H5 | 0 | |
| 10-41 | CH2C6H5 | 1 | |
| 10-42 | CH2C6H5 | 2 | |
| 10-43 | CH2CH2C6H5 | 0 | |
| 10-44 | CH2CH2C6H5 | 1 | |
| 10-45 | CH2CH2C6H5 | 2 | |

ES 2 371 922 T3

| | | | |
|-------|------------|---|--|
| 10-46 | C6H5 | 0 | |
| 10-47 | C6H5 | 1 | |
| 10-48 | C6H5 | 2 | |
| 10-49 | 3-Pyridyl | 0 | |
| 10-50 | 3-Pyridyl | 1 | |
| 10-51 | 3-Pyridyl | 2 | |
| 10-52 | OCH3 | 0 | |
| 10-53 | OCH3 | 1 | |
| 10-54 | OCH3 | 2 | |
| 10-55 | OC2H5 | 0 | |
| 10-56 | OC2H5 | 1 | |
| 10-57 | OC2H5 | 2 | |
| 10-58 | OC3H7 | 0 | |
| 10-59 | OC3H7 | 1 | |
| 10-60 | OC3H7 | 2 | |
| 10-61 | OiC3H7 | 0 | |
| 10-62 | OiC3H7 | 1 | |
| 10-63 | OiC3H7 | 2 | |
| 10-64 | OC4H9 | 0 | |
| 10-65 | OC4H9 | 1 | |
| 10-66 | OC4H9 | 2 | |
| 10-67 | OCH2C6H5 | 0 | |
| 10-68 | OCH2C6H5 | 1 | |
| 10-69 | OCH2C6H5 | 2 | |
| 10-70 | OCH2cC3H5 | 0 | |
| 10-71 | OCH2cC3H5 | 1 | |
| 10-72 | OCH2cC3H5 | 2 | |
| 10-73 | OCH2cC5H9 | 0 | |
| 10-74 | OCH2cC5H9 | 1 | |
| 10-75 | OCH2cC5H9 | 2 | |
| 10-76 | OCH2cC6H11 | 0 | |
| 10-77 | OCH2cC6H11 | 1 | |
| 10-78 | OCH2cC6H11 | 2 | |

ES 2 371 922 T3

| | | | |
|--------|-------------|---|--|
| 10-79 | OcC5H9 | 0 | |
| 10-80 | OcC5H9 | 1 | |
| 10-81 | OcC5H9 | 2 | |
| 10-82 | OcC6H11 | 0 | |
| 10-83 | OcC6H11 | 1 | |
| 10-84 | OcC6H11 | 2 | |
| 10-85 | CH2CH2COOH | 0 | |
| 10-86 | CH2CH2COOH | 1 | |
| 10-87 | CH2CH2COOH | 2 | |
| 10-88 | CH2CH2COOMe | 0 | |
| 10-89 | CH2CH2COOMe | 1 | |
| 10-90 | CH2CH2COOMe | 2 | |
| 10-91 | CH2CH2COOEt | 0 | |
| 10-92 | CH2CH2COOEt | 1 | |
| 10-93 | CH2CH2COOEt | 2 | |
| 10-94 | C3H6COOH | 0 | |
| 10-95 | C3H6COOH | 1 | |
| 10-96 | C3H6COOH | 2 | |
| 10-97 | C3H6COOMe | 0 | |
| 10-98 | C3H6COOMe | 1 | |
| 10-99 | C3H6COOMe | 2 | |
| 10-100 | C3H6COOEt | 0 | |
| 10-101 | C3H6COOEt | 1 | |
| 10-102 | C3H6COOEt | 2 | |
| 10-103 | CF3 | 0 | |
| 10-104 | CF3 | 1 | |
| 10-105 | CF3 | 2 | |
| 10-106 | CH2OCH3 | 0 | |
| 10-107 | CH2OCH3 | 1 | |
| 10-108 | CH2OCH3 | 2 | |
| 10-109 | CH2OC2H5 | 0 | |
| 10-110 | CH2OC2H5 | 1 | |
| 10-111 | CH2OC2H5 | 2 | |

Tabla 11: Compuestos de fórmula (I) en los que los sustituyentes tienen los siguientes significados:

R¹ es CN; R² y R^{2a} son cada uno Cl; R³ y R⁵ son cada uno CF₃; R⁴ es Me; R⁶ es CH(CH₂OZ)CH₂OZ y Z es COR¹⁰

| Cpd No | R ¹⁰ | n | mp. °C, NMR(ppm) |
|--------|---------------------------------|---|------------------|
| 11-01 | H | 0 | |
| 11-02 | H | 1 | |
| 11-03 | H | 2 | |
| 11-04 | CH ₃ | 0 | |
| 11-05 | CH ₃ | 1 | |
| 11-06 | CH ₃ | 2 | |
| 11-07 | C ₂ H ₅ | 0 | |
| 11-08 | C ₂ H ₅ | 1 | |
| 11-09 | C ₂ H ₅ | 2 | |
| 11-10 | C ₃ H ₇ | 0 | |
| 11-11 | C ₃ H ₇ | 1 | |
| 11-12 | C ₃ H ₇ | 2 | |
| 11-13 | iC ₃ H ₇ | 0 | |
| 11-14 | iC ₃ H ₇ | 1 | |
| 11-15 | iC ₃ H ₇ | 2 | |
| 11-16 | tBu | 0 | |
| 11-17 | tBu | 1 | |
| 11-18 | tBu | 2 | |
| 11-19 | C ₄ H ₉ | 0 | |
| 11-20 | C ₄ H ₉ | 1 | |
| 11-21 | C ₄ H ₉ | 2 | |
| 11-22 | C ₅ H ₁₁ | 0 | |
| 11-23 | C ₅ H ₁₁ | 1 | |
| 11-24 | C ₅ H ₁₁ | 2 | |
| 11-25 | C ₆ H ₁₃ | 0 | |
| 11-26 | C ₆ H ₁₃ | 1 | |
| 11-27 | C ₆ H ₁₃ | 2 | |
| 11-28 | c-C ₃ H ₅ | 0 | |

ES 2 371 922 T3

| | | | |
|-------|------------|---|--|
| 11-29 | c-C3H5 | 1 | |
| 11-30 | c-C3H5 | 2 | |
| 11-31 | c-C4H7 | 0 | |
| 11-32 | c-C4H7 | 1 | |
| 11-33 | c-C4H7 | 2 | |
| 11-34 | c-C5H9 | 0 | |
| 11-35 | c-C5H9 | 1 | |
| 11-36 | c-C5H9 | 2 | |
| 11-37 | c-C6H11 | 0 | |
| 11-38 | c-C6H11 | 1 | |
| 11-39 | c-C6H11 | 2 | |
| 11-40 | CH2C6H5 | 0 | |
| 11-41 | CH2C6H5 | 1 | |
| 11-42 | CH2C6H5 | 2 | |
| 11-43 | CH2CH2C6H5 | 0 | |
| 11-44 | CH2CH2C6H5 | 1 | |
| 11-45 | CH2CH2C6H5 | 2 | |
| 11-46 | C6H5 | 0 | |
| 11-47 | C6H5 | 1 | |
| 11-48 | C6H5 | 2 | |
| 11-49 | 3-Pyridyl | 0 | |
| 11-50 | 3-Pyridyl | 1 | |
| 11-51 | 3-Pyridyl | 2 | |
| 11-52 | OCH3 | 0 | |
| 11-53 | OCH3 | 1 | |
| 11-54 | OCH3 | 2 | |
| 11-55 | OC2H5 | 0 | |
| 11-56 | OC2H5 | 1 | |
| 11-57 | OC2H5 | 2 | |
| 11-58 | OC3H7 | 0 | |
| 11-59 | OC3H7 | 1 | |
| 11-60 | OC3H7 | 2 | |
| 11-61 | OiC3H7 | 0 | |

ES 2 371 922 T3

| | | | |
|-------|-------------|---|--|
| 11-62 | OiC3H7 | 1 | |
| 11-63 | OiC3H7 | 2 | |
| 11-64 | OC4H9 | 0 | |
| 11-65 | OC4H9 | 1 | |
| 11-66 | OC4H9 | 2 | |
| 11-67 | OCH2C6H5 | 0 | |
| 11-68 | OCH2C6H5 | 1 | |
| 11-69 | OCH2C6H5 | 2 | |
| 11-70 | OCH2cC3H5 | 0 | |
| 11-71 | OCH2cC3H5 | 1 | |
| 11-72 | OCH2cC3H5 | 2 | |
| 11-73 | OCH2cC5H9 | 0 | |
| 11-74 | OCH2cC5H9 | 1 | |
| 11-75 | OCH2cC5H9 | 2 | |
| 11-76 | OCH2cC6H11 | 0 | |
| 11-77 | OCH2cC6H11 | 1 | |
| 11-78 | OCH2cC6H11 | 2 | |
| 11-79 | OcC5H9 | 0 | |
| 11-80 | OcC5H9 | 1 | |
| 11-81 | OcC5H9 | 2 | |
| 11-82 | OcC6H11 | 0 | |
| 11-83 | OcC6H11 | 1 | |
| 11-84 | OcC6H11 | 2 | |
| 11-85 | CH2CH2COOH | 0 | |
| 11-86 | CH2CH2COOH | 1 | |
| 11-87 | CH2CH2COOH | 2 | |
| 11-88 | CH2CH2COOMe | 0 | |
| 11-89 | CH2CH2COOMe | 1 | |
| 11-90 | CH2CH2COOMe | 2 | |
| 11-91 | CH2CH2COOEt | 0 | |
| 11-92 | CH2CH2COOEt | 1 | |
| 11-93 | CH2CH2COOEt | 2 | |
| 11-94 | C3H6COOH | 0 | |

| | | | |
|--------|-----------|----|--|
| 11-95 | C3H6COOH | 1 | |
| 11-96 | C3H6COOH | 2 | |
| 11-97 | C3H6COOMe | 0 | |
| 11-98 | C3H6COOMe | 1 | |
| 11-99 | C3H6COOMe | 2 | |
| 11-100 | C3H6COOEt | 0 | |
| 11-101 | C3H6COOEt | 1 | |
| 11-102 | C3H6COOEt | 2 | |
| 11-103 | CF3 | 0 | |
| 11-104 | CF3 | 1 | |
| 11-105 | CF3 | 2 | |
| 11-106 | CH2OCH3 | 0 | |
| 11-107 | CH2OCH3 | 1 | |
| 11-108 | CH2OCH3 | 2 | |
| 11-109 | CH2OC2H5 | 0 | |
| 11-110 | CH2OC2H5 | 1 | |
| 11-111 | CH2OC2H5 | 12 | |

Tabla 12: Compuestos de fórmula (I) en los que los sustituyentes tienen los siguientes significados:

R^1 es CN; R^2 y R^{2a} son cada uno Cl; R^3 and R^5 son cada uno CF_3 ; R^4 es H; R^6 es $CH_2CH(OZ)CH_2OZ$

| Cpd No | Z | n | mp. °C, NMR(ppm) |
|--------|------|---|------------------|
| 12-01 | H | 0 | |
| 12-02 | H | 1 | |
| 12-03 | H | 2 | |
| *12-04 | CH3 | 0 | |
| *12-05 | CH3 | 1 | |
| *12-06 | CH3 | 2 | |
| *12-07 | C2H5 | 0 | |
| *12-08 | C2H5 | 1 | |
| *12-09 | C2H5 | 2 | |
| *12-10 | C3H7 | 0 | |
| *12-11 | C3H7 | 1 | |
| *12-12 | C3H7 | 2 | |

ES 2 371 922 T3

| | | | |
|--------|------------|----|--|
| *12-13 | iC3H7 | 0 | |
| *12-14 | iC3H7 | 1 | |
| *12-15 | iC3H7 | 2 | |
| *12-16 | tBu | 0 | |
| *12-17 | tBu | 1 | |
| *12-18 | tBu | 2 | |
| *12-19 | C4H9 | 0 | |
| *12-20 | C4H9 | 1 | |
| *12-21 | C4H9 | 2 | |
| *12-22 | C5H11 | 0 | |
| *12-23 | C5H11 | 1 | |
| *12-24 | C5H11 | 2 | |
| *12-25 | C6H13 | 0 | |
| *12-26 | C6H13 | 1 | |
| *12-27 | C6H13 | 2' | |
| *12-28 | c-C3H5 | 0 | |
| *12-29 | c-C3H5 | 1 | |
| *12-30 | c-C3H5 | 2 | |
| *12-31 | c-C4H7 | 0 | |
| *12-32 | c-C4H7 | 1 | |
| *12-33 | c-C4H7 | 2 | |
| *12-34 | c-C5H9 | 0 | |
| *12-35 | c-C5H9 | 1 | |
| *12-36 | c-C5H9 | 2 | |
| *12-37 | c-C6H11 | 0 | |
| *12-38 | c-C6H11 | 1 | |
| *12-39 | c-C6H11 | 2 | |
| 12-40 | CH2C6H5 | 0 | |
| 12-41 | CH2C6H5 | 1 | |
| 12-42 | CH2C6H5 | 2 | |
| 12-43 | CH2CH2C6H5 | 0 | |
| 12-44 | CH2CH2C6H5 | 1 | |
| 12-45 | CH2CH2C6H5 | 2 | |

ES 2 371 922 T3

| | | | |
|-------|-----------|---|--|
| 12-46 | C6H5 | 0 | |
| 12-47 | C6H5 | 1 | |
| 12-48 | C6H5 | 2 | |
| 12-49 | 3-Pyridyl | 0 | |
| 12-50 | 3-Pyridyl | 1 | |
| 12-51 | 3-Pyridyl | 2 | |

Tabla 13: Compuestos de fórmula (I) en los que los sustituyentes tienen los siguientes significados:

| R ¹ es CN; R ² y R ^{2a} son cada uno Cl; R ³ y R ⁵ son cada uno CF ₃ ; R ⁴ es Me; R ⁶ es CH ₂ CH(OZ)CH ₂ OZ | | | |
|---|--------------------------------|---|------------------|
| Cpd No | Z | n | mp. °C, NMR(ppm) |
| 13-01 | H | 0 | 19F:-43.1;-64.2 |
| 13-02 | H | 1 | 119F:-64.3;-72.8 |
| 13-03 | H | 2 | |
| *13-04 | CH ₃ | 0 | |
| *13-05 | CH ₃ | 1 | |
| *13-06 | CH ₃ | 2 | |
| *13-07 | C ₂ H ₅ | 0 | |
| *13-08 | C ₂ H ₅ | 1 | |
| *13-09 | C ₂ H ₅ | 2 | |
| *13-10 | C ₃ H ₇ | 0 | |
| *13-11 | C ₃ H ₇ | 1 | |
| *13-12 | C ₃ H ₇ | 2 | |
| *13-13 | iC ₃ H ₇ | 0 | |
| *13-14 | iC ₃ H ₇ | 1 | |
| *13-15 | iC ₃ H ₇ | 2 | |
| *13-16 | tBu | 0 | |
| *13-17 | tBu | 1 | |
| *13-18 | tBu | 2 | |
| *13-19 | C ₄ H ₉ | 0 | |
| *13-20 | C ₄ H ₉ | 1 | |
| *13-21 | C ₄ H ₉ | 2 | |
| *13-22 | C ₅ H ₁₁ | 0 | |

ES 2 371 922 T3

| | | | |
|--------|------------|---|--|
| *13-23 | C5H11 | 1 | |
| *13-24 | C5H11 | 2 | |
| *13-25 | C6H13 | 0 | |
| *13-26 | C6H13 | 1 | |
| *13-27 | C6H13 | 2 | |
| *13-28 | c-C3H5 | 0 | |
| *13-29 | c-C3H5 | 1 | |
| *13-30 | c-C3H5 | 2 | |
| *13-31 | c-C4H7 | 0 | |
| *13-32 | c-C4H7 | 1 | |
| *13-33 | c-C4H7 | 2 | |
| *13-34 | c-C5H9 | 0 | |
| *13-35 | c-C5H9 | 1 | |
| *13-36 | c-C5H9 | 2 | |
| *13-37 | c-C6H11 | 0 | |
| *13-38 | c-C6H11 | 1 | |
| *13-39 | c-C6H11 | 2 | |
| 13-40 | CH2C6H5 | 0 | |
| 13-41 | CH2C6H5 | 1 | |
| 13-42 | CH2C6H5 | 2 | |
| 13-43 | CH2CH2C6H5 | 0 | |
| 13-44 | CH2CH2C6H5 | 1 | |
| 13-45 | CH2CH2C6H5 | 2 | |
| 13-46 | C6H5 | 0 | |
| 13-47 | C6H5 | 1 | |
| 13-48 | C6H5 | 2 | |
| 13-49 | 3-Pyridyl | 0 | |
| 13-50 | 3-Pyridyl | 1 | |
| 13-51 | 3-Pyridyl | 2 | |

Tabla 14: Compuestos de fórmula (I) en los que los sustituyentes tienen los siguientes significados:

| R ¹ es CN; R ² y R ^{2a} son cada uno Cl; R ³ y R ⁵ son cada uno CF ₃ ; R ⁴ es H; R ⁶ es CH(CH ₂ OZ)CH ₂ OZ | | | |
|--|---------------------------------|---|------------------|
| Cpd No | Z | n | mp. °C, NMR(ppm) |
| 14-01 | H | 0 | |
| 14-02 | H | 1 | |
| 14-03 | H | 2 | |
| *14-04 | CH ₃ | 0 | |
| *14-05 | CH ₃ | 1 | |
| *14-06 | CH ₃ | 2 | |
| *14-07 | C ₂ H ₅ | 0 | |
| *14-08 | C ₂ H ₅ | 1 | |
| *14-09 | C ₂ H ₅ | 2 | |
| *14-10 | C ₃ H ₇ | 0 | |
| *14-11 | C ₃ H ₇ | 1 | |
| *14-12 | C ₃ H ₇ | 2 | |
| *14-13 | iC ₃ H ₇ | 0 | |
| *14-14 | iC ₃ H ₇ | 1 | |
| *14-15 | iC ₃ H ₇ | 2 | |
| *14-16 | tBu | 0 | |
| *14-17 | tBu | 1 | |
| *14-18 | tBu | 2 | |
| *14-19 | C ₄ H ₉ | 0 | |
| *14-20 | C ₄ H ₉ | 1 | |
| *14-21 | C ₄ H ₉ | 2 | |
| *14-22 | C ₅ H ₁₁ | 0 | |
| *14-23 | C ₅ H ₁₁ | 1 | |
| *14-24 | C ₅ H ₁₁ | 2 | |
| *14-25 | C ₆ H ₁₃ | 0 | |
| *14-26 | C ₆ H ₁₃ | 1 | |
| *14-27 | C ₆ H ₁₃ | 2 | |
| *14-28 | c-C ₃ H ₅ | 0 | |
| *14-29 | c-C ₃ H ₅ | 1 | |

| | | | |
|--------|------------|---|--|
| *14-30 | c-C3H5 | 2 | |
| *14-31 | c-C4H7 | 0 | |
| *14-32 | c-C4H7 | 1 | |
| *14-33 | c-C4H7 | 2 | |
| *14-34 | c-C5H9 | 0 | |
| *14-35 | c-C5H9 | 1 | |
| *14-36 | c-C5H9 | 2 | |
| *14-37 | c-C6H11 | 0 | |
| *14-38 | c-C6H11 | 1 | |
| *14-39 | c-C6H11 | 2 | |
| 14-40 | CH2C6H5 | 0 | |
| 14-41 | CH2C6H5 | 1 | |
| 14-42 | CH2C6H5 | 2 | |
| 14-43 | CH2CH2C6H5 | 0 | |
| 14-44 | CH2CH2C6H5 | 1 | |
| 14-45 | CH2CH2C6H5 | 2 | |
| 14-46 | C6H5 | 0 | |
| 14-47 | C6H5 | 1 | |
| 14-48 | C6H5 | 2 | |
| 14-49 | 3-Pyridyl | 0 | |
| 14-50 | 3-Pyridyl | 1 | |
| 14-51 | 3-Pyridyl | 2 | |

Tabla 15: Compuestos de fórmula (I) en los que los sustituyentes tienen los siguientes significados:

| R ¹ es CN; R ² y R ^{2a} son cada uno Cl; R ³ y R ⁵ son cada uno CF ₃ ; R ⁴ es Me; R ⁶ es CH(CH ₂ OZ)CH ₂ OZ | | | |
|---|-------------------------------|---|----------------------------------|
| Cpd No | Z | n | mp. °C, NMR(ppm) |
| 15-01 | H | 0 | |
| 15-02 | H | 1 | |
| 15-03 | H | 2 | |
| *15-04 | CH ₃ | 0 | |
| *15-05 | CH ₃ | 1 | ¹⁹ F: -63.9; -73.6 br |
| *15-06 | CH ₃ | 2 | |
| *15-07 | C ₂ H ₅ | 0 | |

ES 2 371 922 T3

| | | | |
|--------|---------|----|---------------------|
| *15-08 | C2H5 | 1 | 19F:-64.3; -74.1 br |
| *15-09 | C2H5 | 2 | |
| *15-10 | C3H7 | 0 | |
| *15-11 | C3H7 | 1 | |
| *15-12 | C3H7 | 2 | |
| *15-13 | iC3H7 | 0 | |
| *15-14 | iC3H7 | 1 | |
| *15-15 | iC3H7 | 2 | |
| *15-16 | tBu | 0 | |
| *15-17 | tBu | 1 | |
| *15-18 | tBu | 2 | |
| *15-19 | C4H9 | 0 | |
| *15-20 | C4H9 | 1 | |
| *15-21 | C4H9 | 2 | |
| *15-22 | C5H11 | 0 | |
| *15-23 | C5H11 | 1 | |
| *15-24 | C5H11 | 2 | |
| *15-25 | C6H13 | 0 | |
| *15-26 | C6H13 | 1 | |
| *15-27 | C6H13 | 2 | |
| *15-28 | c-C3H5 | 0 | |
| *15-29 | c-C3H5 | 1 | |
| *15-30 | c-C3H5 | 2 | |
| *15-31 | c-C4H7 | 0 | |
| *15-32 | c-C4H7 | 1 | |
| *15-33 | c-C4H7 | 2 | |
| *15-34 | c-C5H9 | 0 | |
| *15-35 | c-C5H9 | 1 | |
| *15-36 | c-C5H9 | 2 | |
| *15-37 | c-C6H11 | 10 | |
| *15-38 | c-C6H11 | 1 | |
| *15-39 | c-C6H11 | 2 | |
| 15-40 | CH2C6H5 | 0 | |

| | | | |
|-------|---|---|---------------------|
| 15-41 | CH ₂ C ₆ H ₅ | 1 | 19F:-63.2; -72.9 br |
| 15-42 | CH ₂ C ₆ H ₅ | 2 | |
| 15-43 | CH ₂ CH ₂ C ₆ H ₅ | 0 | |
| 15-44 | CH ₂ CH ₂ C ₆ H ₅ | 1 | |
| 15-45 | CH ₂ CH ₂ C ₆ H ₅ | 2 | |
| 15-46 | C ₆ H ₅ | 0 | |
| 15-47 | C ₆ H ₅ | 1 | |
| 15-48 | C ₆ H ₅ | 2 | |
| 15-49 | 3-Pyridyl | 0 | |
| 15-50 | 3-Pyridyl | 1 | |
| 15-51 | 3-Pyridyl | 2 | |

Tabla 16: Compuestos de fórmula (I) en los que los sustituyentes tienen los siguientes significados:

R¹ es CN; R² y R^{2a} son cada uno Cl; R³ y R⁵ son cada uno CF₃; R⁴ es H; R⁶ es

| Cpd No | Y | n | mp. °C, NMR(ppm) |
|--------|-----------------------|---|------------------|
| 16-01 | O | 0 | |
| 16-02 | O | 1 | |
| 16-03 | O | 2 | |
| 16-04 | O-CH ₂ -O | 0 | |
| 16-05 | O-CH ₂ -O | 1 | |
| 16-06 | O-CH ₂ -O | 2 | |
| 16-07 | O-CHMe-O | 0 | |
| 16-08 | O-CHMe-O | 1 | |
| 16-09 | O-CHMe-O | 2 | |
| 16-10 | O-CMe ₂ -O | 0 | |
| 16-11 | O-CMe ₂ -O | 1 | 19F:-64.2;-74.0 |


ES 2 371 922 T3

| | | | |
|-------|--|---|--|
| 16-12 | O-CMe ₂ -O | 2 | |
| 16-13 | O-cC ₆ H ₁₀ -O | 0 | |
| 16-14 | O-cC ₆ H ₁₀ -O | 1 | |
| 16-15 | O-cC ₆ H ₁₀ -O | 2 | |
| 16-16 | O-CHPh-O | 0 | |
| 16-17 | O-CHPh-O | 1 | |
| 16-18 | O-CHPh-O | 2 | |
| 16-19 | O-CO-O | 0 | |
| 16-20 | O-CO-O | 1 | |
| 16-21 | O-CO-O | 2 | |
| 16-22 | O-CS-O | 0 | |
| 16-23 | O-CS-O | 1 | |
| 16-24 | O-CS-O | 2 | |
| 16-25 | O-COCO-O | 0 | |
| 16-26 | O-COCO-O | 1 | |
| 16-27 | O-COCO-O | 2 | |
| 16-28 | O-C ₂ H ₄ -O | 0 | |
| 16-29 | O-C ₂ H ₄ -O | 1 | |
| 16-30 | O-C ₂ H ₄ -O | 2 | |
| 16-31 | O-1,2-C ₆ H ₄ -O | 0 | |
| 16-32 | O-1,2-C ₆ H ₄ -O | 1 | |
| 16-33 | O-1,2-C ₆ H ₄ -O | 2 | |
| 16-34 | O-CH ₂ CH ₂ | 0 | |
| 16-35 | O-CH ₂ CH ₂ | 1 | |
| 16-36 | O-CH ₂ CH ₂ | 2 | |
| 16-37 | CH ₂ CH ₂ O | 0 | |
| 16-38 | CH ₂ CH ₂ O | 1 | |
| 16-39 | CH ₂ CH ₂ O | 2 | |
| 16-40 | O-SO-O | 0 | |
| 16-41 | O-SO-O | 1 | |
| 16-42 | O-SO-O | 2 | |
| 16-43 | O-SO ₂ -O | 0 | |
| 16-44 | O-SO ₂ -O | 1 | |

| | | | |
|-------|----------------------|---|--|
| 16-45 | O-SO ₂ -O | 2 | |
| 16-46 | O-PO(OH)-O | 0 | |
| 16-47 | O-PO(OH)-O | 1 | |
| 16-48 | O-PO(OH)-O | 2 | |
| 16-49 | O-PO(OMe)-O | 0 | |
| 16-50 | O-PO(OMe)-O | 1 | |
| 16-51 | O-PO(OMe)-O | 2 | |
| 16-52 | O-PO(OEt)-O | 0 | |
| 16-53 | O-PO(OEt)-O | 1 | |
| 16-54 | O-PO(OEt)-O | 2 | |
| 16-55 | O-PO(Ph)-O | 0 | |
| 16-56 | O-PO(Ph)-O | 1 | |
| 16-57 | O-PO(Ph)-O | 2 | |
| 16-58 | O-PO(OPh)-O | 0 | |
| 16-59 | O-PO(OPh)-O | 1 | |
| 16-60 | O-PO(OPh)-O | 2 | |

Tabla 17: Compuestos de fórmula (I) en los que los sustituyentes tienen los siguientes significados:

R¹ es CN; R² y R^{2a} son cada uno Cl; R³ y R⁵ son cada uno CF₃; R⁴ es Me; R⁶ es



| Cpd No | Y | n | mp. °C, NMR(ppm) |
|--------|-----------------------|---|--|
| 17-01 | O | 0 | |
| 17-02 | O | 1 | |
| 17-03 | O | 2 | |
| 17-04 | O-CH ₂ -O | 0 | |
| 17-05 | O-CH ₂ -O | 1 | |
| 17-06 | O-CH ₂ -O | 2 | |
| 17-07 | O-CHMe-O | 0 | |
| 17-08 | O-CHMe-O | 1 | |
| 17-09 | O-CHMe-O | 2 | |
| 17-10 | O-CMe ₂ -O | 0 | ¹⁹ F: -43.2; -64.2 |
| 17-11 | O-CMe ₂ -O | 1 | ¹⁹ F: -64.3; -72.6 to -73.5 |

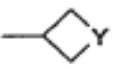
ES 2 371 922 T3

| | | | |
|-------|--|---|--|
| 17-12 | O-CMe ₂ -O | 2 | |
| 17-13 | O-cC ₆ H ₁₀ -O | 0 | |
| 17-14 | O-cC ₆ H ₁₀ -O | 1 | |
| 17-15 | O-cC ₆ H ₁₀ -O | 2 | |
| 17-16 | O-CHPh-O | 0 | |
| 17-17 | O-CHPh-O | 1 | |
| 17-18 | O-CHPh-O | 2 | |
| 17-19 | O-CO-O | 0 | |
| 17-20 | O-CO-O | 1 | ¹⁹ F: -64.3; -72.9 to -74.3 |
| 17-21 | O-CO-O | 2 | |
| 17-22 | O-CS-O | 0 | |
| 17-23 | O-CS-O | 1 | |
| 17-24 | O-CS-O | 2 | |
| 17-25 | O-COCO-O | 0 | |
| 17-26 | O-COCO-O | 1 | |
| 17-27 | O-COCO-O | 2 | |
| 17-28 | O-C ₂ H ₄ -O | 0 | |
| 17-29 | O-C ₂ H ₄ -O | 1 | |
| 17-30 | O-C ₂ H ₄ -O | 2 | |
| 17-31 | O-1,2-C ₆ H ₄ -O | 0 | |
| 17-32 | O-1,2-C ₆ H ₄ -O | 1 | ¹⁹ F: -64.3; -72.6 to -73.5 |
| 17-33 | O-1,2-C ₆ H ₄ -O | 2 | |
| 17-34 | O-CH ₂ CH ₂ | 0 | |
| 17-35 | O-CH ₂ CH ₂ | 1 | |
| 17-36 | O-CH ₂ CH ₂ | 2 | |
| 17-37 | CH ₂ CH ₂ O | 0 | |
| 17-38 | CH ₂ CH ₂ O | 1 | |
| 17-39 | CH ₂ CH ₂ O | 2 | |
| 17-40 | O-SO-O | 0 | |
| 17-41 | O-SO-O | 1 | |
| 17-42 | O-SO-O | 2 | |
| 17-43 | O-SO ₂ -O | 0 | |
| 17-44 | O-SO ₂ -O | 1 | |

| | | | |
|-------|----------------------|---|--|
| 17-45 | O-SO ₂ -O | 2 | |
| 17-46 | O-PO(OH)-O | 0 | |
| 17-47 | O-PO(OH)-O | 1 | |
| 17-48 | O-PO(OH)-O | 2 | |
| 17-49 | O-PO(OMe)-O | 0 | |
| 17-50 | O-PO(OMe)-O | 1 | |
| 17-51 | O-PO(OMe)-O | 2 | |
| 17-52 | O-PO(OEt)-O | 0 | |
| 17-53 | O-PO(OEt)-O | 1 | |
| 17-54 | O-PO(OEt)-O | 2 | |
| 17-55 | O-PO(Ph)-O | 0 | |
| 17-56 | O-PO(Ph)-O | 1 | |
| 17-57 | O-PO(Ph)-O | 2 | |
| 17-58 | O-PO(OPh)-O | 0 | |
| 17-59 | O-PO(OPh)-O | 1 | |
| 17-60 | O-PO(OPh)-O | 2 | |

Tabla 18: Compuestos de fórmula (I) en los que los sustituyentes tienen los siguientes significados:

R¹ es CN; R² y R^{2a} son cada uno Cl; R³ y R⁵ son cada uno CF₃; R⁴ es H; R⁶ es



| Cpd No | Y | n | mp. °C, NMR(ppm) |
|--------|-----------------------|---|------------------|
| 18-01 | O | 0 | |
| 18-02 | O | 1 | |
| 18-03 | O | 2 | |
| 18-04 | O-CH ₂ -O | 0 | |
| 18-05 | O-CH ₂ -O | 1 | |
| 18-06 | O-CH ₂ -O | 2 | |
| 18-07 | O-CHMe-O | 0 | |
| 18-08 | O-CHMe-O | 1 | |
| 18-09 | O-CHMe-O | 2 | |
| 18-10 | O-CMe ₂ -O | 0 | |
| 18-11 | O-CMe ₂ -O | 1 | |


ES 2 371 922 T3

| | | | |
|-------|--|---|--|
| 18-12 | O-CMe ₂ -O | 2 | |
| 18-13 | O-cC ₆ H ₁₀ -O | 0 | |
| 18-14 | O-cC ₆ H ₁₀ -O | 1 | |
| 18-15 | O-cC ₆ H ₁₀ -O | 2 | |
| 18-16 | O-CHPh-O | 0 | |
| 18-17 | O-CHPh-O | 1 | |
| 18-18 | O-CHPh-O | 2 | |
| 18-19 | O-CO-O | 0 | |
| 18-20 | O-CO-O | 1 | |
| 18-21 | O-CO-O | 2 | |
| 18-22 | O-CS-O | 0 | |
| 18-23 | O-CS-O | 1 | |
| 18-24 | O-CS-O | 2 | |
| 18-25 | O-COCO-O | 0 | |
| 18-26 | O-COCO-O | 1 | |
| 18-27 | O-COCO-O | 2 | |
| 18-28 | O-C ₂ H ₄ -O | 0 | |
| 18-29 | O-C ₂ H ₄ -O | 1 | |
| 18-30 | O-C ₂ H ₄ -O | 2 | |
| 18-31 | O-1,2-C ₆ H ₄ -O | 0 | |
| 18-32 | O-1,2-C ₆ H ₄ -O | 1 | |
| 18-33 | O-1,2-C ₆ H ₄ -O | 2 | |
| 18-34 | O-CH ₂ CH ₂ | 0 | |
| 18-35 | O-CH ₂ CH ₂ | 1 | |
| 18-36 | O-CH ₂ CH ₂ | 2 | |
| 18-37 | CH ₂ OCH ₂ | 0 | |
| 18-38 | CH ₂ OCH ₂ | 1 | |
| 18-39 | CH ₂ OCH ₂ | 2 | |
| 18-40 | O-SO-O | 0 | |
| 18-41 | O-SO-O | 1 | |
| 18-42 | O-SO-O | 2 | |
| 18-43 | O-SO ₂ -O | 0 | |
| 18-44 | O-SO ₂ -O | 1 | |

| | | | |
|-------|----------------------|---|--|
| 18-45 | O-SO ₂ -O | 2 | |
| 18-46 | O-PO(OH)-O | 0 | |
| 18-47 | O-PO(OH)-O | 1 | |
| 18-48 | O-PO(OH)-O | 2 | |
| 18-49 | O-PO(OMe)-O | 0 | |
| 18-50 | O-PO(OMe)-O | 1 | |
| 18-51 | O-PO(OMe)-O | 2 | |
| 18-52 | O-PO(OEt)-O | 0 | |
| 18-53 | O-PO(OEt)-O | 1 | |
| 18-54 | O-PO(OEt)-O | 2 | |
| 18-55 | O-PO(Ph)-O | 0 | |
| 18-56 | O-PO(Ph)-O | 1 | |
| 18-57 | O-PO(Ph)-O | 2 | |
| 18-58 | O-PO(OPh)-O | 0 | |
| 18-59 | O-PO(OPh)-O | 1 | |
| 18-60 | O-PO(OPh)-O | 2 | |
| 18-61 | OCH ₂ | 0 | |
| 18-62 | OCH ₂ | 1 | |
| 18-63 | OCH ₂ | 2 | |

Tabla 19: Compuestos de fórmula (I) en los que los sustituyentes tienen los siguientes significados:

R¹ es CN; R² y R^{2a} son cada uno Cl; R³ y R⁵ son cada uno CF₃; R⁴ es Me; R⁶ es



| Cpd No | Y | n | mp. °C, NMR(ppm) |
|--------|----------------------|---|------------------|
| 19-01 | O | 0 | |
| 19-02 | O | 1 | |
| 19-03 | O | 2 | |
| 19-04 | O-CH ₂ -O | 0 | |
| 19-05 | O-CH ₂ -O | 1 | |
| 19-06 | O-CH ₂ -O | 2 | |
| 19-07 | O-CHMe-O | 0 | |
| 19-08 | O-CHMe-O | 1 | |

ES 2 371 922 T3

| | | | |
|-------|--|---|--|
| 19-09 | O-CHMe-O | 2 | |
| 19-10 | O-CMe ₂ -O | 0 | |
| 19-11 | O-CMe ₂ -O | 1 | |
| 19-12 | O-CMe ₂ -O | 2 | |
| 19-13 | O-cC ₆ H ₁₀ -O | 0 | |
| 19-14 | O-cC ₆ H ₁₀ -O | 1 | |
| 19-15 | O-cC ₆ H ₁₀ -O | 2 | |
| 19-16 | O-CHPh-O | 0 | |
| 19-17 | O-CHPh-O | 1 | |
| 19-18 | O-CHPh-O | 2 | |
| 19-19 | O-CO-O | 0 | |
| 19-20 | O-CO-O | 1 | |
| 19-21 | O-CO-O | 2 | |
| 19-22 | O-CS-O | 0 | |
| 19-23 | O-CS-O | 1 | |
| 19-24 | O-CS-O | 2 | |
| 19-25 | O-COCO-O | 0 | |
| 19-26 | O-COCO-O | 1 | |
| 19-27 | O-COCO-O | 2 | |
| 19-28 | O-C ₂ H ₄ -O | 0 | |
| 19-29 | O-C ₂ H ₄ -O | 1 | |
| 19-30 | O-C ₂ H ₄ -O | 2 | |
| 19-31 | O-1,2-C ₆ H ₄ -O | 0 | |
| 19-32 | O-1,2-C ₆ H ₄ -O | 1 | |
| 19-33 | O-1,2-C ₆ H ₄ -O | 2 | |
| 19-34 | O-CH ₂ CH ₂ | 0 | |
| 19-35 | O-CH ₂ CH ₂ | 1 | |
| 19-36 | O-CH ₂ CH ₂ | 2 | |
| 19-37 | CH ₂ OCH ₂ | 0 | |
| 19-38 | CH ₂ OCH ₂ | 1 | |
| 19-39 | CH ₂ OCH ₂ | 2 | |
| 19-40 | O-SO-O | 0 | |
| 19-41 | O-SO-O | 1 | |

| | | | |
|-------|----------------------|---|--|
| 19-42 | O-SO-O | 2 | |
| 19-43 | O-SO ₂ -O | 0 | |
| 19-44 | O-SO ₂ -O | 1 | |
| 19-45 | O-SO ₂ -O | 2 | |
| 19-46 | O-PO(OH)-O | 0 | |
| 19-47 | O-PO(OH)-O | 1 | |
| 19-48 | O-PO(OH)-O | 2 | |
| 19-49 | O-PO(OMe)-O | 0 | |
| 19-50 | O-PO(OMe)-O | 1 | |
| 19-51 | O-PO(OMe)-O | 2 | |
| 19-52 | O-PO(OEt)-O | 0 | |
| 19-53 | O-PO(OEt)-O | 1 | |
| 19-54 | O-PO(OEt)-O | 2 | |
| 19-55 | O-PO(Ph)-O | 0 | |
| 19-56 | O-PO(Ph)-O | 1 | |
| 19-57 | O-PO(Ph)-O | 2 | |
| 19-58 | O-PO(OPh)-O | 0 | |
| 19-59 | O-PO(OPh)-O | 1 | |
| 19-60 | O-PO(OPh)-O | 2 | |
| 19-61 | OCH ₂ | 0 | |
| 19-62 | OCH ₂ | 1 | |
| 19-63 | OCH ₂ | 2 | |

Tabla 20: Compuestos de fórmula (I) en los que los sustituyentes tienen los siguientes significados:

R¹ es CN; R² y R^{2a} son cada uno Cl; R³ y R⁶ son cada uno CF₃; R⁴ es Me; R⁶ es CH₂CH₂CH(OZ)CH₂OZ

| Cpd No | Z | n | mp.°C, NMR(ppm) |
|--------|-----------------|---|------------------------------|
| 20-01 | H | 0 | |
| 20-02 | H | 1 | ¹⁹ F:-64.2; -72.7 |
| 20-03 | H | 2 | |
| *20-04 | CH ₃ | 0 | |
| *20-05 | CH ₃ | 1 | |
| *20-06 | CH ₃ | 2 | |

ES 2 371 922 T3

| | | | |
|--------|---------------------|---|------------------------------|
| *20-07 | C2H5 | 0 | |
| *20-08 | C2H5 | 1 | |
| *20-09 | C2H5 | 2 | |
| 20-10 | C2H4OCH3 | 0 | |
| 20-11 | C2H4OCH3 | 1 | |
| 20-12 | C2H4OCH3 | 2 | |
| 20-13 | C2H4OC2H5 | 0 | |
| 20-14 | C2H4OC2H5 | 1 | |
| 20-15 | C2H4OC2H5 | 2 | |
| 20-16 | C2H4OC2H4OCH3 | 0 | |
| 20-17 | C2H4OC2H4OCH3 | 1 | |
| 20-18 | C2H4OC2H4OCH3 | 2 | |
| 20-19 | C2H4OC2H4OC2H4OCH3 | 0 | |
| 20-20 | C2H4OC2H4OC2H4OCH3 | 1 | |
| 20-21 | C2H4OC2H4OC2H4OCH3 | 2 | |
| 20-22 | C2H4(OC2H4)3OCH3 | 0 | |
| 20-23 | C2H4(OC2H4)3OCH3 | 1 | |
| 20-24 | C2H4(OC2H4)3OCH3 | 2 | |
| 20-25 | C6H5 | 0 | |
| 20-26 | C6H5 | 1 | |
| 20-27 | C6H5 | 2 | |
| 20-28 | CH2C6H5 | 0 | |
| 20-29 | CH2C6H5 | 1 | |
| 20-30 | CH2C6H5 | 2 | |
| *31 | 2-Tetrahidropyranil | 0 | |
| *20-32 | 2-Tetrahidropyranil | 1 | |
| *20-33 | 2-Tetrahidropyranil | 2 | |
| 20-34 | CO-CH3 | 0 | |
| 20-35 | CO-CH3 1 | 1 | 19F: -64.3; -72.6 to 73.2 br |
| 20-36 | CO-CH3 | 2 | |
| 20-37 | CO-C2H5 | 0 | |
| 20-38 | CO-C2H5 1 | 1 | 19F: -63.8; -72.6 br |
| 20-39 | CO-C2H5 | 2 | |

ES 2 371 922 T3

| | | | |
|-------|-------------|---|--|
| 20-40 | COC6H5 | 0 | |
| 20-41 | COC6H5 | 1 | |
| 20-42 | COC6H5 | 2 | |
| 20-43 | CO-OCH3 | 0 | |
| 20-44 | CO-OCH3 | 1 | |
| 20-45 | CO-OCH3 | 2 | |
| 20-46 | CO-OC2H5 | 0 | |
| 20-47 | CO-OC2H5 | 1 | |
| 20-48 | CO-OC2H5 | 2 | |
| 20-49 | CO-OCH2C6H5 | 0 | |
| 20-50 | CO-OCH2C6H5 | 1 | |
| 20-51 | CO-OCH2C6H5 | 2 | |
| 20-52 | COC2H4COOH | 0 | |
| 20-53 | COC2H4COOH | 1 | |
| 20-54 | COC2H4COOH | 2 | |
| 20-55 | COC2H4COOMe | 0 | |
| 20-56 | COC2H4COOMe | 1 | |
| 20-57 | COC2H4COOMe | 2 | |
| 20-58 | COC2H4COOEt | 0 | |
| 20-59 | COC2H4COOEt | 1 | |
| 20-60 | COC2H4COOEt | 2 | |
| 20-61 | COCF3 | 0 | |
| 20-62 | COCF3 | 1 | |
| 20-63 | COCF3 | 2 | |
| 20-64 | COCH2OCH3 | 0 | |
| 20-65 | COCH2OCH3 | 1 | |
| 20-66 | COCH2OCH3 | 2 | |
| 20-67 | COCH2OC2H5 | 0 | |
| 20-68 | COCH2OC2H5 | 1 | |
| 20-69 | COCH2OC2H5 | 2 | |

ES 2 371 922 T3

Tabla 21: Compuestos de fórmula (I) en los que los sustituyentes tienen los siguientes significados:

R¹ es CN; R² y R^{2a} son cada uno Cl; R³ y R⁵ son cada uno CF₃; R⁴ es Me; R⁶ es CH₂CH(Me)CH(CH₂OZ)₂

| Cpd No | Z | n | mp.°C, NMR(ppm) |
|--------|--------------------|---|--------------------------|
| 21-01 | H | 0 | |
| 21-02 | H | 1 | 19F:-63.8;-72.3to73.1,br |
| 21-03 | H | 2 | |
| *21-04 | CH3 | 0 | |
| *21-05 | CH3 | 1 | |
| *21-06 | CH3 | 2 | |
| *21-07 | C2H5 | 0 | |
| *21-08 | C2H5 | 1 | |
| *21-09 | C2H5 | 2 | |
| 21-10 | C2H4OCH3 | 0 | |
| 21-11 | C2H4OCH3 | 1 | |
| 21-12 | C2H4OCH3 | 2 | |
| 21-13 | C2H4OC2H5 | 0 | |
| 21-14 | C2H4OC2H5 | 1 | |
| 21-15 | C2H4OC2H5 | 2 | |
| 21-16 | C2H4OC2H4OCH3 | 0 | |
| 21-17 | C2H4OC2H4OCH3 | 1 | |
| 21-18 | C2H4OC2H4OCH3 | 2 | |
| 21-19 | C2H4OC2H4OC2H4OCH3 | 0 | |
| 21-20 | C2H4OC2H4OC2H4OCH3 | 1 | |
| 21-21 | C2H4OC2H4OC2H4OCH3 | 2 | |
| 21-22 | C2H4(OC2H4)3OCH3 | 0 | |
| 21-23 | C2H4(OC2H4)3OCH3 | 1 | |
| 21-24 | C2H4(OC2H4)3OCH3 | 2 | |
| 21-25 | C6H5 | 0 | |
| 21-26 | C6H5 | 1 | |
| 21-27 | C6H5 | 2 | |
| 21-28 | CH2C6H5 | 0 | |

ES 2 371 922 T3

| | | | |
|--------|---------------------|---|------------------------|
| 21-29 | CH2C6H5 | 1 | |
| 21-30 | CH2C6H5 | 2 | |
| *21-31 | 2-Tetrahidropyranil | 0 | |
| *21-32 | 2-Tetrahidropyranil | 1 | |
| *21-33 | 2-Tetrahidropyranil | 2 | |
| 21-34 | CO-CH3 | 0 | |
| 21-35 | CO-CH3 | 1 | 19F:-64.2;-72.6to-74.2 |
| 21-36 | CO-CH3 | 2 | |
| 21-37 | CO-C2H5 | 0 | |
| 21-38 | CO-C2H5 | 1 | 19F:-64.2;-72.6to-74.2 |
| 21-39 | CO-C2H5 | 2 | |
| 21-40 | COC6H5 | 0 | |
| 21-41 | COC6H5 | 1 | |
| 21-42 | COC6H5 | 2 | 2 |
| 21-43 | CO-OCH3 | 0 | |
| 21-44 | CO-OCH3 | 1 | |
| 21-45 | CO-OCH3 2 | 2 | |
| 21-46 | CO-OC2H5 | 0 | |
| 21-47 | CO-OC2H5 | 1 | |
| 21-48 | CO-OC2H5 | 2 | |
| 21-49 | CO-OCH2C6H5 | 0 | |
| 21-50 | CO-OCH2C6H5 | 1 | |
| 21-51 | CO-OCH2C6H5 | 2 | |
| 21-52 | COC2H4COOH | 0 | |
| 21-53 | COC2H4COOH | 1 | |
| 21-54 | COC2H4COOH | 2 | |
| 21-55 | COC2H4COOMe | 0 | |
| 21-56 | COC2H4COOMe | 1 | |
| 21-57 | COC2H4COOMe | 2 | |
| 21-58 | COC2H4COOEt | 0 | |
| 21-59 | COC2H4COOEt | 1 | |
| 21-60 | COC2H4COOEt | 2 | |
| 21-61 | COCF3 | 0 | |

| | | | |
|-------|------------|---|--|
| 21-62 | COCF3 | 1 | |
| 21-63 | COCF3 | 2 | |
| 21-64 | COCH2OCH3 | 0 | |
| 21-65 | COCH2OCH3 | 1 | |
| 21-66 | COCH2OCH3 | 2 | |
| 21-67 | COCH2OC2H5 | 0 | |
| 21-68 | COCH2OC2H5 | 1 | |
| 21-69 | COCH2OC2H5 | 2 | |

Tabla 22: Compuestos de fórmula (I) en los que los sustituyentes tienen los siguientes significados:

R¹ es CN; R² y R^{2a} son cada uno Cl; R³ y R⁵ son cada uno CF₃; R⁴ es Me; R⁶ es un anillo de tetrahidrofurano-3-yl sustituido por Z¹

| Cpd No | Z ¹ | n | mp. °C, NMR(ppm) |
|--------|--------------------------|----|------------------|
| 22-01 | 4-OH | 0 | |
| 22-02 | 4-OH | 1 | |
| 22-03 | 4-OH | 2 | |
| 22-04 | 4-OCH3 | 0 | |
| 22-05 | 4-OCH3 | 1 | |
| 22-06 | 4-OCH3 | 2 | |
| 22-07 | 4-OC2H5 | 0 | |
| 22-08 | 4-OC2H5 | 1 | |
| 22-09 | 4-OC2H5 | 2 | |
| 22-10 | 4-OC6H5 | 0 | |
| 22-11 | 4-OC6H5 | 1 | |
| 22-12 | 4-OC6H5 | 2 | |
| 22-13 | 4-OCH2C6H5 | 0 | |
| 22-14 | 4-OCH2C6H5 | 1 | |
| 22-15 | 4-OCH2C6H5 | 12 | |
| 22-16 | 4-O(2-Tetrahidropyranil) | 0 | |
| 22-17 | 4-O(2-Tetrahidropyranil) | 1 | |
| 22-18 | 4-O(2-Tetrahidropyranil) | 2 | |
| 22-19 | 4-O-COCH3 | 0 | |
| 22-20 | 4-O-COCH3 | 1 | |

ES 2 371 922 T3

| | | | |
|-------|--|---|----------------------------|
| 22-21 | 4-O-COCH3 | 2 | |
| 22-22 | 4-O-COC2H5 | 0 | |
| 22-23 | 4-O-COC2H5 | 1 | |
| 22-24 | 4-O-COC2H5 | 2 | |
| 22-25 | 4-O-COC6H5 | 0 | |
| 22-26 | 4-O-COC6H5 | 1 | |
| 22-27 | 4-O-COC6H5 | 2 | |
| 22-28 | 4-O-COCH2Ph | 0 | |
| 22-29 | 4-O-COCH2Ph | 1 | |
| 22-30 | 4-O-COCH2Ph | 2 | |
| 22-31 | 4-O-COOCH3 | 0 | |
| 22-32 | 4-O-COOCH3 | 1 | |
| 22-33 | 4-O-COOCH3 | 2 | |
| 22-34 | 4-O-COOC2H5 | 0 | |
| 22-35 | 4-O-COOC2H5 | 1 | |
| 22-36 | 4-O-COOC2H5 | 2 | |
| 22-37 | 4-O-COOCH2Ph | 0 | |
| 22-38 | 4-O-COOCH2Ph | 1 | |
| 22-39 | 4-O-COOCH2Ph | 2 | |
| 22-40 | 2-(2,2-dimetil-1,3-dioxolan-4-yl)-4,5-dimetilmetilenedioxi | 0 | |
| 22-41 | 2-(2,2-dimetil-1,3-dioxolan-4-yl)-4,5-dimetilmetilenedioxi | 1 | 19F:-63.8;-71.6 to 74.6 br |
| 22-42 | 2-(2,2-dimetil-1,3-dioxolan-4-yl)-4,5-dimetilmetilenedioxi | 2 | |
| 22-43 | 2-(1,2-diacetoxi-etil)-4,5-diacetoxi | 0 | |
| 22-44 | 2-(1,2-diacetoxi-etil)-4,5-diacetoxi | 1 | |
| 22-45 | 2-(1,2-diacetoxi-etil)-4,5-diacetoxi | 2 | |

Tabla 23: Compuestos de fórmula (I) en los que los sustituyentes tienen los siguientes significados:

R¹ es CN; R² y R^{2a} son cada uno Cl; R³ y R⁵ son cada uno CF₃; R⁴ es Me; R⁶ es un anillo de tetrahidropirano-2-yl sustituido por Z¹

| Cpd No | Z ¹ | n | mp. °C, NMR(ppm) |
|--------|---|---|------------------------------|
| 23-01 | 3,4-(dimetilmetilenedioxi)-5,6-(dimetilmetilenedioxi) | 0 | |
| 23-02 | 3,4-(dimetilmetilenedioxi)-5,6-(dimetilmetilenedioxi) | 1 | 19F:-63.9;-73.3 br |
| 23-03 | 3,4-(dimetilmetilenedioxi)-5,6-(dimetilmetilenedioxi) | 2 | |
| 23-04 | 3,4,5,6-tetra(acetyloxi) | 0 | |
| 23-05 | 3,4,5,6-tetra(acetyloxi) | 1 | |
| 23-06 | 3,4,5,6-tetra(acetyloxi) | 2 | |
| 23-07 | 2,3-(dimetilmetilenedioxi)-4,5-(dimetilmetilenedioxi) | | |
| 23-08 | 2,3-(dimetilmetilenedioxi)-4,5-(dimetilmetilenedioxi) | 1 | 19F:-64.3; -71.5 to 72.8, br |
| 23-09 | 2,3-(dimetilmetilenedioxi)-4,5-(dimetilmetilenedioxi) | 2 | |
| 23-10 | 2,3,4,5-tetra(acetyloxi) | 0 | |
| 23-11 | 2,3,4,5-tetra(acetyloxi) | 1 | |
| 23-12 | 2,3,4,5-tetra(acetyloxi) | 2 | |

Tabla 24: Compuestos de fórmula (I) en los que los sustituyentes tienen los siguientes significados:

R¹ es CN; R² y R^{2a} son cada uno Cl; R³ y R⁵ son cada uno CF₃; R⁴ es Me; R⁶ es alquilo-(C₂-C₈)-S(O)_m-Z

| Cpd No | R ⁶ | n | mp. °C, NMR(ppm) |
|--------|---|---|----------------------|
| *24-01 | CH ₂ CH ₂ SCH ₃ | 0 | |
| *24-02 | CH ₂ CH ₂ SCH ₃ | 1 | 19F:-64.3; -72.7 |
| *24-03 | CH ₂ CH ₂ SCH ₃ | 2 | |
| *24-04 | CH ₂ CH ₂ SOCH ₃ | 0 | |
| *24-05 | CH ₂ CH ₂ SOCH ₃ | 1 | |
| *24-06 | CH ₂ CH ₂ SOCH ₃ | 2 | |
| *24-07 | CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃ | 0 | |
| *24-08 | CH ₂ CH ₂ SO ₂ CH ₃ | 1 | |
| *24-09 | CH ₂ CH ₂ S ₀ 2CH ₃ | 2 | |
| *24-10 | CH ₂ CH ₂ SC ₂ H ₅ | 0 | |
| *24-11 | CH ₂ CH ₂ SC ₂ H ₅ | 1 | 19F:-63.8; -72.7, br |

ES 2 371 922 T3

| | | | |
|--------|---------------------------------|---|-------------------|
| *24-12 | CH2CH2SC2H5 | 2 | |
| *24-13 | CH2CH2SOC2H5 | 0 | |
| *24-14 | CH2CH2SOC2H5 | 1 | |
| *24-15 | CH2CH2SOC2H5 | 2 | |
| *24-16 | CH2CH2SO2C2H5 | 0 | |
| *24-17 | CH2CH2SO2C2H5 | 1 | |
| *24-18 | CH2CH2SO2C2H5 | 2 | |
| *24-19 | CH2CH2CH2SCH3 | 0 | |
| *24-20 | CH2CH2CH2SCH3 | 1 | 19F: -63.8; -72.6 |
| *24-21 | CH2CH2CH2SCH3 | 2 | |
| *24-22 | CH2CH2CH2SOCH3 | 0 | |
| *24-23 | CH2CH2CH2SOCH3 | 1 | |
| *24-24 | CH2CH2CH2SOCH3 | 2 | |
| *24-25 | CH2CH2CH2SO2CH3 | 0 | |
| *24-26 | CH2CH2CH2SO2CH3 | 1 | |
| *24-27 | CH2CH2CH2SO2CH3 | 2 | |
| 24-28 | CH2CH2SC6H5 | 0 | |
| 24-29 | CH2CH2SC6H5 | 1 | |
| 24-30 | CH2CH2SC6H5 | 2 | |
| 24-31 | CH2CH2SOC6H5 | 0 | |
| 24-32 | CH2CH2SOC6H5 | 1 | |
| 24-33 | CH2CH2SOC6H5 | 2 | |
| 24-34 | CH2CH2SO2C6H5 | 0 | |
| 24-35 | CH2CH2SO2C6H5 | 1 | |
| 24-36 | CH2CH2SO2C6H5 | 2 | |
| 24-37 | CH2CH2S-2-pyridyl | 0 | |
| 24-38 | CH2CH2S-2-pyridyl | 1 | |
| 24-39 | CH2CH2S-2-pyridyl | 2 | |
| 24-40 | CH2CH2S-2-pyrimidinil | 0 | |
| 24-41 | CH2CH2S-2-pyrimidinil | 1 | |
| 24-42 | CH2CH2S-2-pyrimidinil | 2 | |
| 24-43 | CH2CH2S-2-(4,6-Me2-pyrimidinil) | 0 | |

ES 2 371 922 T3

| | | | |
|-------|--|---|------------------|
| 24-44 | CH ₂ CH ₂ S-2-(4,6-Me ₂ -pyrimidinil) | 1 | 19F:-63.8; -72.6 |
| 24-45 | CH ₂ CH ₂ S-2-(4,6-Me ₂ -pyrimidinil) | 2 | |

Tabla 25: Compuestos de fórmula (I) en los que los sustituyentes tienen los siguientes significados:

| R ¹ es CN; R ² y R ^{2a} son cada uno Cl; R ³ y R ⁵ son cada uno CF ₃ ; R ⁴ es Me; R ⁶ es alquilo-(C ₂ -C ₈)-N(R ¹¹)-Z | | | |
|--|---|---|----------------------------|
| Cpd No | R ⁶ | n | mp. °C, NMR(ppm) |
| *25-01 | CH ₂ CH ₂ NMe ₂ | 0 | |
| *25-02 | CH ₂ CH ₂ NMe ₂ | 1 | 19F:-63.8;-72.0 a 73.0, br |
| *25-03 | CH ₂ CH ₂ NMe ₂ | 2 | |
| *25-04 | CH ₂ CH ₂ NEt ₂ | 0 | |
| *25-05 | CH ₂ CH ₂ NEt ₂ | 1 | |
| *25-06 | CH ₂ CH ₂ NEt ₂ | 2 | |
| *25-07 | CH ₂ CH ₂ NnPR ² | 0 | |
| *25-08 | CH ₂ CH ₂ NnPR ² | 1 | |
| *25-09 | CH ₂ CH ₂ NnPR ² | 2 | |
| 25-10 | CH ₂ CH ₂ -pyrrolidinil | 0 | |
| 25-11 | CH ₂ CH ₂ -pyrrolidinil | 1 | |
| 25-12 | CH ₂ CH ₂ -pyrrolidinil | 2 | |
| 25-13 | CH ₂ CH ₂ -piperidinil | 0 | |
| 25-14 | CH ₂ CH ₂ -piperidinil | 1 | |
| 25-15 | CH ₂ CH ₂ -piperidinil | 2 | |
| 25-16 | CH ₂ CH ₂ N(COCH ₂ CH ₂ CO) | 0 | |
| 25-17 | CH ₂ CH ₂ N(COCH ₂ CH ₂ CO) | 1 | 19F:-63.9; -72.1 |
| 25-18 | CH ₂ CH ₂ N(COCH ₂ CH ₂ CO) | 2 | |
| *25-19 | CH ₂ CH ₂ CH ₂ NMe ₂ | 0 | |
| *25-20 | CH ₂ CH ₂ CH ₂ NMe ₂ | 1 | |
| *25-21 | CH ₂ CH ₂ CH ₂ NMe ₂ | 2 | |
| *25-22 | CH ₂ CH ₂ CH ₂ NEt ₂ | 0 | |
| *25-23 | CH ₂ CH ₂ CH ₂ NEt ₂ | 1 | |
| *25-24 | CH ₂ CH ₂ CH ₂ NEt ₂ | 2 | |
| *25-25 | CH ₂ CH ₂ CH ₂ NnPR ² | 0 | |
| *25-26 | CH ₂ CH ₂ CH ₂ NnPR ² | 1 | |

| | | | |
|--------|---|---|---------------------|
| *25-27 | CH ₂ CH ₂ CH ₂ NnPR ² | 2 | |
| 25-28 | CH ₂ CH ₂ CH ₂ -pyrrolidinil | 0 | |
| 25-29 | CH ₂ CH ₂ CH ₂ -pyrrolidinil | 1 | |
| 25-30 | CH ₂ CH ₂ CH ₂ -pyrrolidinil | 2 | |
| 25-31 | CH ₂ CH ₂ CH ₂ -piperidinil | 0 | |
| 25-32 | CH ₂ CH ₂ CH ₂ -piperidinil | 1 | |
| 25-33 | CH ₂ CH ₂ CH ₂ -piperidinil | 2 | |
| 25-34 | CH ₂ CH ₂ CH ₂ N(COCH ₂ CH ₂ CO) | 0 | |
| 25-35 | CH ₂ CH ₂ CH ₂ N(COCH ₂ CH ₂ CO) | | 19F:-64.2; -73.1 br |
| 25-36 | CH ₂ CH ₂ CH ₂ N(COCH ₂ CH ₂ CO) | 2 | |
| 25-37 | CH ₂ CH ₂ NH(CO ₂ tBu) | 0 | |
| 25-38 | CH ₂ CH ₂ NH(CO ₂ tBu) | 1 | 19F:-63.8; -72.2 |
| 25-39 | CH ₂ CH ₂ NH(CO ₂ tBu) | 2 | |
| 25-40 | CH ₂ CH ₂ CH ₂ NH(CO ₂ tBu) | 0 | |
| 25-41 | CH ₂ CH ₂ CH ₂ NH(CO ₂ tBu) | 1 | |
| 125-42 | CH ₂ CH ₂ CH ₂ NH(CO ₂ tBu) | 2 | |

- [0044]** Según otra característica adicional de la presente invención se proporciona un procedimiento para el control de plagas en un lugar que comprende la aplicación en el lugar de una cantidad eficaz de un compuesto de fórmula (I) o de una de sus sales en el que el lugar es la propia plaga un cultivo, un lugar de crecimiento de cultivo, una semilla, el suelo, un producto almacenado, artículos para el hogar, una propiedad o zona del medio ambiente en general. Con esta finalidad, dicho compuesto se utiliza normalmente en la forma de compuesto pesticida (es decir en asociación con diluyentes compatibles o transportadores y/o agentes tensoactivos adecuados para la utilización en composiciones pesticidas), por ejemplo tal como se describirá a continuación.
- [0045]** El término "compuesto de la invención" tal como se emplea a continuación abarca a un derivado de carbamato de aminopirazol sustituido en la posición 5 polar de fórmula (I) tal como se ha definido arriba y o una de sus sales aceptables como pesticida.
- [0046]** Un aspecto de la presente invención tal como se ha definido arriba es un procedimiento para el control de plagas en un lugar. El lugar incluye, por ejemplo, la propia plaga, el lugar (planta, campo, bosque, huerto, vía de agua, el suelo, producto de planta, o similares) donde la plaga reside o se alimenta, o un sitio susceptible de infestación futura por la plaga. Por lo tanto, el compuesto de la invención puede aplicarse directamente a la plaga, al lugar donde reside o se alimenta la plaga, o un lugar susceptible de una infestación futura por la plaga.
- [0047]** Tal como es evidente a partir de los usos pesticidas anteriores, la presente invención proporciona compuestos activos como pesticidas y métodos de uso de dichos compuestos para el control de un conjunto de especies de plagas que incluyen: artrópodos, especialmente insectos o ácaros, o nemátodos de plantas. El compuesto de la presente invención se puede utilizar por tanto de manera ventajosa en usos prácticos, por ejemplo, en cultivos agrícolas u hortícolas, en silvicultura, en medicina veterinaria o en la cría de ganado o en la salud pública.
- [0048]** Los compuestos de la presente invención se pueden utilizar, por ejemplo, en las siguientes aplicaciones y en las siguientes plagas:
- [0049]** Para el control de insectos de tierra, tales como el gusano de la raíz del maíz, termitas (especialmente para la protección de estructuras), gusanos de raíz, gusanos de alambre, gorgojos de raíz, barrenadores del tallo, gusanos cortadores, áfidos de la raíz o larvas. También se pueden utilizar para proporcionar una actividad contra nemátodos patogénicos de plantas, tales como nemátodos de los nódulos, quiste, daga, lesión o del tallo o el bulbo, o contra

ácaros. Para el control de plagas de tierra, por ejemplo, el gusano de la raíz del maíz, los compuestos se aplican de manera ventajosa o se incorporan en una relación eficaz en la tierra en la que se plantan o se van a plantar los cultivos o a las semillas o raíces de las plantas en crecimiento.

5 **[0050]** En el área de la salud pública, los compuestos son especialmente útiles en el control de muchos insectos, especialmente moscas de la porquería u otras plagas de Diptera, tales como, moscas domésticas, moscas de los establos, moscas soldados, moscas del cuerno, moscas del venado, tábanos, mosquitos pequeños, "punkies", moscas prietas, o mosquitos.

10 **[0051]** En la protección de productos almacenados, por ejemplo, cereales, incluyendo grano o harina, cacahuets, alimento de animales, madera o utensilios domésticos, por ejemplo, alfombras y tejidos, los compuestos de la presente invención son útiles contra el ataque por artrópodos, más especialmente escarabajos, incluyendo, gorgojos, polillas o ácaros, por ejemplo *Ephestia* spp. (polillas de la harina), *Anthrenus* spp. (escarabajos de alfombra), *Tribolium* spp. (escarabajos de la harina), *Sitophilus* spp. (gorgojos de grano) o *Acarus* spp. (ácaros).

15 **[0052]** En el control de cucarachas, hormigas o termitas o plagas de artrópodos similares en instalaciones domésticas o industriales infestadas o en el control de larvas de mosquitos en canales, pozos, depósitos u otras fuentes de agua corriente o estancada.

[0053] Para el tratamiento de cimientos, estructuras o tierra en la prevención del ataque en la construcción por termitas, por ejemplo, *Reticulitermes* spp., *Heterotermes* spp., *Coptotermes* spp.

20 **[0054]** En la agricultura contra adultos, larvas y huevos de lepidópteros (mariposas y polillas), por ejemplo, *Heliothis* spp. tal como *Heliothis virescens* (gusano cogollero), *Heliothis armigera* y *Heliothis zea*. Contra adultos y larvas de coleópteros (escarabajos), por ejemplo, *Anthonomus* spp., por ejemplo, *grandis* (gorgojo del tallo del algodón), *Leptinotarsa decemlineata* (escarabajo de la patata de Colorado), *Diabrotica* spp. (gusanos de la raíz del maíz). Contra heterópteros (Hemiptera y Homoptera), por ejemplo, *Psylla* spp., *Bemisia* spp., *Trialeurodes* spp., *Aphis* spp., *Myzus* spp., *Megoura viciae*, *Phylloxera* spp., *Nephotettix* spp. (saltamontes de las hojas de arroz), *Nilaparvata* spp.

25 **[0055]** Contra dípteros, por ejemplo, *Musca* spp. Contra Thysanoptera, tales como *Thrips tabaci*. Contra Orthoptera, tales como *Locusta* y *Schistocerca* spp., (langostas y grillos), por ejemplo *Gryllus* spp., y *Acheta* spp., por ejemplo, *Blatta orientalis*, *Periplaneta americana*, *Blatella germanica*, *Locusta migratoria migratorioides*, y *Schistocerca gregaria*. Contra Collembola, por ejemplo, *Periplaneta* spp. y *Blatella* spp. (cucaraCHas). Contra artrópodos de importancia agrícola, tales como Acari (ácaros), por ejemplo, *Tetranychus* spp., y *Panonychus* spp.,

30 **[0056]** Contra nemátodos que atacan plantas o árboles de importancia para la agricultura, silvicultura, u horticultura de forma directa o mediante la expansión de enfermedades bacterianas, virales, por micoplasma o fúngicas de las plantas. Por ejemplo, los nemátodos de nódulos, tales como *Meloidogyne* spp. (por ejemplo, *M. incognita*).

35 **[0057]** En el campo de la medicina veterinaria o la cría de ganado o en el mantenimiento de la salud pública contra artrópodos que son parasitarios de forma interna o externa sobre los vertebrados, particularmente vertebrados de sangre caliente, por ejemplo, animales domésticos, por ejemplo, ternera, oveja, cabra, equinos, cerdos, aves de corral, perros o gatos, por ejemplo *Acarina*, incluyendo garrapatas (por ejemplo, garrapatas de cuerpo blando, incluyendo *Argasidae* spp., por ejemplo, *Argas* spp. y *Ornithodoros* spp. (por ejemplo, *Ornithodoros moubata*); garrapatas de cuerpo duro, incluyendo *Ixodidae* spp., por ejemplo, *Boophilus* spp., por ejemplo, *Boophilus microplus*, *Rhipicephalus* spp., por ejemplo, *Rhipicephalus appendiculatus* y *Rhipicephalus sanguineus*; ácaros (por ejemplo, *Damalinea* spp.); pulgas (por ejemplo, *Ctenocephaluros* spp., por ejemplo, *Ctenocephaluros felis* (pulga del gato) y *Ctenocephaluros canis* (pulga del perro)); piojos, por ejemplo, *Menopon* spp.; Diptera (por ejemplo, *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Musca* spp., *Hypoderma* spp.); Hemiptera.; Dictyoptera (por ejemplo, *Periplaneta* spp., *Blatella* spp.); Hymenoptera; por ejemplo, contra infecciones del tracto gastrointestinal causadas por gusanos nemátodos parasitarios, por ejemplo, miembros de la familia *Trichostrongylidae*.

45 **[0058]** En un aspecto preferido de la presente invención, los compuestos de fórmula (I) se utilizan para el control de parásitos de animales. Preferiblemente, el animal a tratar es un animal de compañía doméstico, tal como un perro o un gato.

[0059] En un aspecto adicional de la presente invención, los compuestos de fórmula (I) o sales o composiciones de los mismos se utilizan para la preparación de medicamentos veterinarios.

50 **[0060]** Otro aspecto de la invención se refiere por lo tanto a la utilización de un compuesto de fórmula (I) o de una de sus sales, o de una composición de estos, para el control de plagas.

[0061] En el uso práctico para el control de artrópodos, especialmente, insectos o ácaros, o helmintos, especialmente plagas de nemátodos de plantas, un método, por ejemplo, comprende aplicar a las plantas o al medio en el que crecen una cantidad eficaz de un compuesto de la presente invención. Para dicho método, el compuesto

- de la presente invención se aplica generalmente al foco en el que va a controlarse la infestación por artrópodos o nemátodos en una relación eficaz en el intervalo de aproximadamente 2 g a aproximadamente 1 kg del compuesto activo por hectárea del foco tratado. En condiciones ideales, dependiendo de la plaga a controlar, una relación inferior puede ofrecer una protección adecuada. Por otro lado, las condiciones climáticas adversas, la resistencia de la plaga u otros factores pueden requerir que el principio activo se utilice en relaciones más elevadas. La relación óptima depende normalmente de una serie de factores, por ejemplo, el tipo de plaga que se controla, el tipo o la etapa de crecimiento de la planta infestada, el espacio entre las hileras o también el método de aplicación. Preferiblemente, un intervalo de relación eficaz del compuesto activo es de aproximadamente 10 g/ha a aproximadamente 400 g/ha, más preferiblemente de aproximadamente 50 g/ha a aproximadamente 200 g/ha.
- 5 **[0062]** Cuando una plaga se encuentra en la tierra, el compuesto activo generalmente en una composición formulada, se distribuye uniformemente sobre el área a tratar (es decir, por ejemplo, tratamiento por difusión o bandas) de cualquier manera práctica y se aplica en relaciones de aproximadamente 10 g/ha a aproximadamente 400 g ai/ha, preferiblemente de aproximadamente 50 g/ha a aproximadamente 200 g ai/ha. Cuando se aplica por inmersión de la raíz a plántulas o irrigación discontinua a plantas, la solución líquida o suspensión contiene de
- 10 aproximadamente 0,075 a aproximadamente 1000 mg al/l, preferiblemente de aproximadamente 25 a aproximadamente 200 mg ai/l. La aplicación se puede realizar, si se desea, al campo o el área de crecimiento del cultivo generalmente o próxima a la semilla o planta a proteger del ataque. El compuesto de la presente invención se puede lavar en la tierra mediante la pulverización con agua sobre el área o se puede dejar a la acción natural de la lluvia. Durante o después de la aplicación, el compuesto formulado, si se desea, se puede distribuir mecánicamente
- 15 en la tierra, por ejemplo mediante arado, disqueo o el uso de cadenas de arrastre. La aplicación puede ser anterior a la plantación, en la plantación o después de la plantación, pero antes o después de que haya brotado.
- [0063]** El compuesto de la presente invención y los métodos del control de plagas con el mismo son particularmente valiosos en la protección del campo, forraje, plantaciones, invernaderos, huertos o cultivos de viñas, de plantas ornamentales, árboles de plantación o forestales, por ejemplo: cereales (tales como, trigo o arroz), algodón,
- 20 hortalizas (tales como, pimientos), cosechas del campo (tales como, remolacha azucarera, soja o colza oleaginosa), cosechas de pradera o forraje (tales como, maíz o sorgo), huertas o arboledas (tales como, de fruto de hueso pepita o cítricos), plantas ornamentales, flores u hortalizas o matas en invernaderos o en jardines o parques, o árboles forestales (tanto de hoja caduca como perenne) en bosques, plantaciones o viveros.
- [0064]** También son valiosos en la protección de madera (en pie, caída, convertida, almacenada o estructural) del ataque, por ejemplo, por moscas de sierra o escarabajos o termitas. Presentan aplicaciones en la protección de productos almacenados, tales como granos, frutas, frutos secos, especies o tabaco, tanto de forma completa, molidos o compuestos en productos, del ataque de polillas, escarabajos, ácaros o gorgojos de grano. También se protegen los productos de animales almacenados, tales como pieles, pelo, lana o plumas de forma natural o convertida (por ejemplo, como alfombras o tejidos) del ataque de polillas o escarabajos, así como carne, pescado o
- 30 granos almacenados del ataque de escarabajos, ácaros o moscas.
- [0065]** Adicionalmente, el compuesto de la presente invención y los métodos de uso del mismo son particularmente valiosos en el control de artrópodos o helmintos que son perjudiciales, o se extienden o actúan como vectores de enfermedades de animales domésticos, por ejemplo, los mencionados anteriormente, y más especialmente en el control de pulgas, ácaros, piojos, pulgas, mosquitos pequeños o moscas por mordedura, molestia o con miiasis. Los compuestos de la presente invención son particularmente útiles en el control de artrópodos o helmintos que están presentes en animales huésped domésticos o que se alimentan de la piel o sobre la misma o chupan la sangre del animal, para cuyo objetivo se pueden administrar de manera oral, parenteral, percutánea o tópica.
- [0066]** Las composiciones descritas a continuación para la aplicación en cultivos en crecimiento o focos en crecimiento de cultivos o como la preparación de la semilla se pueden utilizar, en general, alternativamente, en la
- 45 protección de productos almacenados, utensilios domésticos, propiedades o áreas del medio general. Los medios adecuados de aplicación de los compuestos de la presente invención incluyen: a cultivos en crecimiento como pulverizadores foliares (por ejemplo, como un pulverizador en surcos), polvos, gránulos, vapores o espumas o también como suspensiones de composiciones finamente divididas o encapsuladas; como tratamientos de la tierra o la raíz mediante empapamiento líquido, polvos, gránulos, humos o espumas; a semillas de cultivos mediante la
- 50 aplicación como preparación de semillas, por ejemplo, mediante emulsiones líquidas o polvos;
- a animales infestados o expuestos a la infestación por artrópodos o helmintos, mediante la aplicación oral o tópica de composiciones en las que el principio activo muestra una acción inmediata y/o prolongada durante un periodo de tiempo contra los artrópodos o helmintos, por ejemplo, mediante la incorporación en el alimento o formulaciones farmacéuticas adecuadas ingeribles por vía oral, cebos comestibles, depósitos de sales, suplementos dietético,
- 55 formulaciones de aplicación, pulverizadores, baños, por inmersión, duchas, chorros, polvos, grasas, champús, cremas, embadurnes con cera o sistemas de autotratamiento del ganado;

al medio en general o a localizaciones específicas donde las plagas merodean, incluyendo productos almacenados, madera, utensilios domésticos, o instalaciones domésticas o industriales, como pulverizadores, vapores, polvos, humos, embadurnes de cera, lacas, gránulos o cebos, o en una alimentación por goteo a canales, pozos, depósitos u otras fuentes de agua corriente o estancada.

5 **[0067]** Los compuestos de fórmula (I) son particularmente útiles para el control de parásitos de animales cuando se aplican oralmente, y en un aspecto más preferido de la presente invención los compuestos de fórmula (I) se utilizan para el control de parásitos de animales mediante aplicación oral. Los compuestos de la fórmula (I) o sales de los mismos se pueden administrar antes, durante o después de las comidas. Los compuestos de la fórmula (I) o sales de los mismos se pueden mezclar con un portador y/o alimentos.

10 **[0068]** El compuesto de la fórmula (I) o la sal del mismo se administran de forma oral en una dosis al animal en un intervalo de dosis generalmente de 0,1 a 500 mg/kg del compuesto de la fórmula (I) o sal del mismo por kilogramo de peso corporal animal (mg/kg).

[0069] La frecuencia del tratamiento al animal, preferiblemente el animal doméstico a tratar por el compuesto de la fórmula (I) o sal del mismo es generalmente de aproximadamente una vez por semana a aproximadamente una vez al año, preferiblemente de aproximadamente una vez cada dos semanas a una vez cada tres meses.

15 Se gún otro aspecto preferido de la invención los compuestos de fórmula (I) se utilizan para proporcionar un largo periodo de control efectivo de parásitos de animales tras una aplicación oral única.

[0070] Los compuestos de la presente invención se pueden administrar de manera más ventajosa con otro material eficaz como parasiticida, tal como un endoparasiticida, y/o un ectoparasiticida, y/o un endectoparasiticida. Por ejemplo, dichos compuestos incluyen lactonas macrocíclicas, tales como avermectinas o milbemicinas, por ejemplo, ivermectina, piratel o un regulador del crecimiento en insectos, tal como lufenuron o metopreno.

20 **[0071]** Los compuestos de la fórmula (I) también se pueden utilizar para controlar organismos dañinos en cultivos de plantas conocidas modificadas genéticamente o plantas modificadas genéticamente aún por desarrollar. Como regla, las plantas transgénicas se diferencian por propiedades especialmente ventajosas, por ejemplo por la resistencia a agentes de protección de cultivos particulares, resistencia a enfermedades en plantas o patógenos de enfermedades en plantas, tales como, insectos particulares o microorganismos, tales como hongos, bacterias o virus. Otras propiedades particulares se refieren, por ejemplo, al material cosechado con respecto a la cantidad, calidad, propiedades de almacenamiento, composición y componentes específicos. De este modo, se identifican plantas transgénicas cuando se aumenta el contenido de almidón, o se altera la calidad del almidón, o cuando el material cosechado tiene una composición de ácidos grasos diferente.

25 **[0072]** Se prefiere el uso en cultivos transgénicos económicamente importantes de plantas útiles y ornamentales, por ejemplo, de cereales, tales como, trigo, cebada, centeno, copos de avena, mijo, arroz, yuca y maíz u otros cultivos de remolacha azucarera, algodón, soja, colza oleaginosa, patatas, tomates, guisantes y otro tipo de hortalizas.

30 **[0073]** Cuando se utilizan en cultivos transgénicos, en particular aquellos que presentan resistencia a insectos, se observan frecuentemente efectos, además de los efectos contra organismos dañinos a observar en otros cultivos, que son específicos para la aplicación en el cultivo transgénico en cuestión, por ejemplo, un espectro alterado o específicamente ampliado de plagas que se pueden controlar, o se pueden utilizar relaciones de aplicación alteradas para la aplicación.

35 **[0074]** Por tanto, la presente invención también se refiere al uso de compuestos de la fórmula (I) para el control de organismos dañinos en plantas de cultivos transgénicos.

[0075] Según una característica adicional de la presente invención, se proporciona una composición pesticida que comprende uno o más compuestos de la presente invención, tal como se han definido anteriormente, en asociación con, y preferiblemente dispersados homogéneamente en uno o más diluyentes o portadores y/o agentes tensoactivos compatibles aceptables como pesticidas [es decir, diluyentes o portadores y/o agentes tensoactivos del tipo generalmente aceptado en la técnica como adecuados para el uso en composiciones pesticidas y que son compatibles con compuestos de la presente invención].

40 **[0076]** En la práctica, los compuestos de la presente invención la mayoría de las veces forman parte de composiciones. Estas composiciones se pueden utilizar para controlar artrópodos, especialmente insectos, o nemátodos de plantas o ácaros. Las composiciones pueden ser de cualquier tipo conocido en la técnica adecuado para la aplicación a la plaga deseada en cualquier instalación o área interna o externa. Estas composiciones contienen por lo menos un compuesto de la presente invención como principio activo en combinación o asociación con uno o más de otros componentes compatibles que son, por ejemplo, portadores o diluyentes, adyuvantes, agentes tensoactivos, sólidos o líquidos, o similares, apropiados para el uso deseado y que son agrícolamente o

medicinalmente aceptables. Estas composiciones, que se pueden preparar de cualquier manera conocida en la técnica, forman asimismo parte de la presente invención.

[0077] Los compuestos de la presente invención, en sus formulaciones comercialmente disponibles y en las formas de uso preparadas a partir de estas formulaciones, pueden estar presentes en mezclas con otras sustancias activas, tales como insecticidas, atrayentes, esterilizantes, acaricidas, nematocidas, fungicidas, sustancias reguladoras del crecimiento o herbicidas.

[0078] Los pesticidas incluyen, por ejemplo, ésteres fosfóricos, carbamatos, ésteres carboxílicos, formamidas, compuestos de estaño y materiales producidos por microorganismos.

[0079] Son componentes preferidos en mezclas:

10 Insecticidas / acaricidas / nematocidas:

1. Inhibidores de la Acetilcolinesterasa (ACHE)

[0080] 1.1 carbamatos (por ejemplo alanicarb, aldicarb, aldoxicarb, alixicarb, aminocarb, azametifos, bendiocarb, benfuracarb, bufencarb, butacarb, butocarboxim, butoxicarboxim, carbarilo, carbofuran, carbosulfan, chloetocarb, coumafos, cianofenos, cianofos, dimetilan, etiofencarb, fenobucarb, fenotiocarb, formetanate, furatiocarb, isoprocab, metam-sodio, metiocarb, metomilo, metolcarb, oxamilo, pirimicarb, promecarb, propoxur, tiodicarb, tiofanox, triazamate, trimetacarb, XMC, xililcarb).

[0081] 1.2 organofosfatos (por ejemplo acefato, azametifos, azinfos (-metilo, -etilo), bromofos-etilo, bromfenvinfos (-metilo), butatiofos, cadusafos, carbofenotion, chloretofos, chlorfenvinfos, clormefos, clorpirifos (-metil/-etilo), coumafos, cianofenos, cianofos, demeton-s-metilo, demeton-s-metilsulfon, dialifos, diazinon, diclofention, diclorvos/DDVP, dicrotofos, dimetoate, dimetilvinfos, dioxabenzofos, disulfoton, EPN, etion, etoprofos, etrimfos, famfur, fenamifos, fenitrotion, fensulfotion, fention, flupirazofos, fonofos, formotion, fosmetilan, fostiazato, heptenofos, iodofenos, iprobenfos, isazofos, isofenos, isopropilo o-salicylato, isoxation, malation, mecarbam, metacrifos, metamidofos, metidation, mevinfos, monocrotofos, naled, ometoato, oxidemeton-metilo, paration (-metil/-etilo), fentoato, forato, fosalone, fosmet, fosfamidon, fosfocarb, foxim, pirimifos (-metil/-etilo), profenofos, propafos, propetamfos, protiofos, protoato, piraclofos, piridafention, piridation, quinalfos, sebufos, sulfotep, sulprofos, tebupirimfos, temefos, terbufos, tetraclorvinfos, tiometon, triazofos, triclorfon, vamidotion)

2. Bloqueadores y moduladores de canales de sodio dependientes del voltaje

[0082] 2.1 piretroides (por ejemplo acrinatrin, aletrin (d-cis-trans, d-trans), beta-ciflutrin, bifentrin, bioaletrin, isómero bioaletrin- s-ciclopentil-, bioetanometrin, biopermetrin, bioresmetrin, clovaportrin, cis-cipermetrin, cis-resmetrin, cis-permetrin, clocitrin, cicloprotrin, ciflutrin, cihalotrin, cipermetrin (alfa-, beta-, teta-, zeta-), cifenotrin, DDT, deltametrin, em-pentrin (isómero 1 R), esfenvalerato, etofenprox, fenflutrin, fenpropatrin, fempiritrin, fenvalerato, flubrocitrinato, flucitrinato, flufenprox, flumetrin, fluvalinato, fubfenprox, gamma-cihalotrin, imiprotrin, kadetrin, lambda-cihalotrin, metoflutrin, permetrin (cis-, trans-), fenotrin (isómero 1R-trans), pralletrin, proflutrin, protrifenbute, piresmetrin, resmetrin, RU 15525, silafluofen, tau-fluvalinato, teflutrin, teralletrin, tetrametrin (isómero 1 R), tralome-trin, transflutrin, ZXI 8901, piretrins (piretrum)

[0083] 2.2 oxadiazinas (por ejemplo indoxacarb)

3. Agonistas/antagonistas receptores de acetilcolina

[0084] 3.1 clononictinilos/neonictinoides (por ejemplo acetamiprid, clotianidin, dinotefuran, imidacloprid, nitenpiram, riitiazina, tiacloprid, tiametoxam)

[0085] 3.2 nicotina, bensultap, cartap

4. Moduladores de receptor de acetilcolina

[0086] 4.1 Espinosinas (por ejemplo spinosad)

5. Antagonistas de canal de cloruros controlados por GABA

[0087] 5.1 ciclodieno organoclorados (por ejemplo camfeclor, clordane, endosulfan, gamma-HCH, HCH, heptaclor, lindane, metoxiclor)

[0088] 5.2 fiproles (por ejemplo acetoprople, etiprople, fipronil, vaniliprople)

6. Activadores de canal de cloruro

[0089] 6.1 mectinas (por ejemplo abamectina, avermectina, emamectina, emamectina-benzoato, ivermectina, milbemectina, milbemicina)

7. Miméticos de las hormonas juveniles

[0090] (por ejemplo diofenolan, epofenonane, fenoxicarb, hidroprene, kinoprene, metoprene, piriproxifen, triprene)

5 8. *Agonistas/disruptores de la ecdisona*

[0091] 8.1 Diacilhidrazinas (por ejemplo cromafenozida, halofenozida, metoxifenozida, tebufenozida)

9. *Inhibidores de la biosíntesis de la quitina*

[0092] 9.1 Benzoilureas (por ejemplo bistrifluron, clofluazuron, diflubenzuron, fluazuron, flucicloxuron, flufenoxuron, hexaflumuron, lufenuron, novaluron, noviflumuron, penfluron, teflubenzuron, triflumuron)

10 **[0093]** 9.2 buprofezina

[0094] 9.3 ciromazina

10. *Inhibidores de fosforilación oxidante, disruptores de ATP*

[0095] 10.1 diafentiuron

[0096] 10.2 organotinas (por ejemplo azociclotina, cihexatina, óxido de fenbutatina)

15 11. *Desacopladores de fosforilación oxidantes que actúan por interrupción de gradiente de protón H*

[0097] 11.1 pirroles (por ejemplo clorfenapir)

[0098] 11.2 dinitrofenoles (por ejemplo binapacirt, dinobuton, dinocap, DNOC)

12. *Inhibidores de transporte de electrones Sitio-I*

[0099] 12.1 METEs (por ejemplo fenazaquin, fenpyroximato, pirimidifen, piridaben, tebufenpirad, tolfenpirad)

20 **[0100]** 12.2 hidrametilnona

[0101] 12.3 dicofol

13. *Inhibidores de transporte de electrones Sitio-II*

[0102] 13.1 rotenona

14. *Inhibidores de transporte de electrones Sitio-III*

25 **[0103]** 14.1 Acequinocilo, fluacripirim

15. *Disruptores microbianos de la membrana del intestino de insecto*

[0104] Variedades de bacillus turingiensis

16. Inhibidores de síntesis de grasas

[0105] 16.1 ácidos tetrónicos (por ejemplo spirodiclofen, spiromesifen)

30 **[0106]** 16.2 ácidos tetrámicos [por ejemplo 3-(2,5-dimetilfenilo)-8-metoxi-2-oxo-1-azaspiro[4.5]dec-3-en-4-ilo carbonato de etilo (alias: ácido carbónico, 3-(2,5-dimetilfenilo)-8-metoxi-2-oxo-1-azaspiro[4.5]dec-3-en-4-ilo etilo ester, CAS Reg. No.: 382608-10-8) y ácido carbónico, cis-3-(2,5-dimetilfenilo)-8-metoxi-2-oxo-1-azaspiro[4.5]dec-3-en-4-ilo ester de etilo (CAS Reg. No.: 203313-25-1)]

17. *Carboxamidas*

[0107] (por ejemplo flonicamida)

18. Agonista octopaminérgico

[0108] (por ejemplo amitraz)

19. Inhibidores de ATPasa estimulados por magnesio

[0109] (por ejemplo propargita)

5 20. Ftalamidas

[0110] (por ejemplo N2-[1,1-dimetil-2-(metilsulfonilo)etil]-3-iodo-N1-[2-metil-4-[1,2,2,2-tetrafluoro-1-(trifluorometilo)etil]fenil]-1,2-benzenedicarboxamida (CAS Reg. No.: 272451-65-7), flubendiamida)

21. Análogos de la Nereistoxina

[0111] (por ejemplo oxalato de hidrógeno tiociclám, tiosultap-sodio)

10 22. Hormonas o feromonas Biológicas,

[0112] (por ejemplo azadiractins, Bacillus spec., Beauveria spec., codlemone, Metarrhizium spec., Paecilomyces spec., turingiensin, Verticillium spec.)

23. Compuestos activos con mecanismos desconocidos o no específicos de actino

[0113] 23.1 fumigantes (por ejemplo fosfuro de aluminio, bromuro de metilo, fluoruro de sulfurilo)

15 [0114] 23.2 antinutritivos selectivos (por ejemplo criolita, flonicamida, pimetrozina)

[0115] 23.3 inhibidores de crecimiento de ácaros (por ejemplo clofentezina, etoxazole, hexitiazox)

[0116] 23.4 amidoflomet, benclotiaz, benzoximato, bifenazato, bromopropilato, buprofezin, quinometionat, clordimeform, clorobenzilato, cloropicrin, clotiazoben, cicloprene, cyflumetofen, diciclanil, fenoxacrim, fentrifanil, flubenzimine, flufenerim, flutenzin, gossypure, hidrametilnone, japonilure, metoxadiazona, petróleo, piperonilo butóxido, oleato de Potasio, pirafuprole, piridalilo, piriprole, sulfluramida, tetradifon, tetrasul, triaratene, verbutin,

20

[0117] y también el compuesto 3-metilfenilo propilcarbamato (tsumacida Z), el compuesto 3-(5-cloro-3-piridinilo)-8-(2,2,2-trifluoroetilo)-8-azabicyclo[3.2.1]octano-3-carbonitrilo (CAS Reg. No. 185982-80-3) y el isómero 3-endo correspondiente (CAS Reg. No. 185984-60-5) (cf. WO 96/37494, WO 98/25923), y preparaciones que comprenden extractos de plantas activos como insecticidas, nematodos, hongos o virus.

25 [0118] Ejemplos de agentes de mezclado funguicidas adecuados se pueden seleccionar de la siguiente lista:

Inhibición de síntesis de ácido nucléico:

[0119] benalaxilo, benalaxil-M, bupirimato, quiralexilo, clozilacona, dimetirimol, etirimol, furalaxilo, himexazol, metalaxil- M, ofurace, oxadixilo, ácido oxolinico

Inhibidores de la mitosis y la división celular:

30 [0120] benomilo, carbendazim, dietofencarb, fuberidazol, pencicurona, tiabendazol, tiofanato-metilo, zoxamida

Inhibición de respiración.

[0121] CI: diflumentorim

[0122] CII : boscalida, carboxina, fenfuram, flutolanilo, furametpir, mepronilo, oxicarboxina, pentiopirad, tifulzamid

35 [0123] CIII : azoxistrobina, ciazofamida, dimoxistrobina, enestrobina, famoxadona, fenamidona, fluoxastrobina, cresoxim-metilo, metominostrobin, orisastrobina, piraclostrobina, picoxistrobina

, trifloxistrobina

[0124] Desacoplantes : dinocap, fluazinam

[0125] Inhibición de producción de ATP: acetato de fentina, cloruro de fentina, hidróxido de fentina, siltiofam

Inhibidores de la biosíntesis de aminoácidos y proteínas:

[0126] andoprim, blastidina-S, ciprodinilo, casugamicina, clorhidrato de casugamicina hidratado, mepanipirim, pirimetanilo

Inhibidores de la transducción de señales:

5 [0127] fenpiclonilo, fludioxonilo, quinoxifeno

Inhibidores de la síntesis de lípidos y membranas:

[0128] clozolinato, iprodiona, procimidona, vinclozolina ampropilfos, ampropilfos potásico, edifenfos, iprobenfos (IBP), isoprotilano, pirazofos tolclofos-metilo, bifenilo yodocarb, propamocarb, clorhidrato de propamocarb

Inhibidores de la biosíntesis de ergosterol:

10 [0129] fenhexamida,

azaconazol, bitertanol, bromuconazol, ciproconazol, diclobutrazol, difenoconazol, diniconazol, diniconazol-M, epoxiconazol, etaconazol, fenbuconazol, fluquinconazol, flusilazol, flutriafol, furconazol, furconazol-cis, hexaconazol, imibenconazol, ipconazol, metconazol, miclobutanilo, paclobutrazol, penconazol, propiconazol, protioconazol, simeconazol, tebuconazol, tetraconazol, triadimefona, triadimenol, triticonazol, uniconazol, voriconazol, imazalilo,

15 sulfato de imazalilo, oxpoconazol, fenarimol, flurprimidol, nuarimol, pirifenox, triforina, pefurazoato, procloraz, triflumizol, viniconazol,

aldimorf, dodemorf, acetato de dodemorf, fenpropimorf, tridemorf, fenpropidina, espiroxamina,

naftifina, piributicarb, terbmafina,

Inhibidores de la síntesis de la pared celular:

20 [0130] bentiavalicarb, bialafos, dimetomorf, flumorf, iprovalicarb, polioxinas, polioxorima, validamicina A

Inhibidores de la biosíntesis de la melanina:

[0131] capropamida, diclocimet, fenoxanilo, ftalida, piroquilona, triciclazol,

Inducción de resistencia:

[0132] acibenzolar-S-metilo, probenazol, tiadinilo

25 **Multisitio:**

[0133] captafol, captano, clorotalonilo, sales de cobre tales como: hidróxido de cobre, naftenato de cobre, oxiclورو de cobre, sulfato de cobre, óxido de cobre, oxina cúprica y mezcla de Bordeaux, diclofluanida, ditianona, dodina, base libre de dodina, ferbam, fluorofolpet, guazatina, acetato de guazatina, iminoctadina, besilato de iminoctadinal, triacetato de iminoctadina, mancozeb, mancozeb, maneb, metiram, metiram de cinc, propineb, azufre y preparaciones de azufre que contienen polisulfuro de calcio, tiram, tolilfluanida, zineb, ziram,

30

Mecanismo desconocido:

[0134] amibromdol, bentiazol, betoxazina, capsimicina, carvona, quinometionato, cloropicrina, cufraneb, citlufenamida, cimoxanilo, dazomet, debacarb, diclomezina, diclorofeno, diclorano, difenzoquat, metilsulfato de difenzoquat, difenilamina, etaboxam, ferimzona, flumetover, flusulfamida, fluopicolida, fluoroimida,

35 hexaclorobenceno, sulfato de 8-hidroxiquinolina, irumamicina, metasulfocarb, metrafenona, metilisotiocianato, mildiomicina, natamicina, dimetilditiocarbamato de níquel, nitrotal-isopropilo, octilinona, oxamocarb, oxifentína, pentaclorofenol y sales, 2-fenilfenol y sales, piperalina, propanosina sódica, proquinazida, pirrolnitrina, quintoceno, tecloftalam, tecnaceno, triazoxida, triclámida, zarilamida y 2,3,5,6-tetracloro-4-(metilsulfonil)-piridina, N-(4-cloro-2-nitrofenil)-N-etil-4-metilbenceno-sulfonamida, 2-amino-4-metil-N-fenil-5-tiazolcarboxamida, 2-cloro-N-(2,3-dihidro-

40 1,1,3-trimetil-1H-inden-4-il)-3-piridincarboxamida, 3-[5-(4-clorofenil)-2,3-dimetilisoxazolidin-3-il]piridina, cis-1-(4-clorofenil)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-il)-cicloheptanol, 2,4-dihidro-5-metoxi-2-metil-4-[[[1-[3-(trifluorometil)fenil]etiliden]amino]oxi]metil]fenil]-3H-1,2,3-triazol-3-ona (185336-79-2), 1-(2,3-dihidro-2,2-dimetil-1H-inden-1-il)-1H-imidazol-5-carboxilato de metilo, 3,4,5-tricloro-2,6-piridindicarbonitrilo, 2-[[[ciclopropil-(4-metoxifenil)imino]metil]tio]metil]-alfa-(metoxime-tilen)benzoacetato de metilo, 4-cloro-alfa-propinilo-N-[2-[3-metoxi-

45 4-(2-propinilo)fenil]etil]benzoacetamida, (2S)-N-[2-[4-[[3-(4-clorofenil)-2-propinil]oxi]-3-metoxifenil]etil]-3-metil-2-[(metilsulfonil)amino]butanamida, 5-cloro-7-(4-metilpiperidin-1-il)-6-(2,4,6-trifluorofenil)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina,

5-cloro-6-(2,4,6-trifluorofenil)-N-[(1R)-1,2,2-trimetilpropil]-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-amina, 5-cloro-N-[(1R)-1,2-dimetilpropil]-6-(2,4,6-trifluorofenil)-[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-amina, N-[1-(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)etil]-2,4-dicloronicotinamida, N-(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)metil-2,4-dicloronicotinamida, 2-butoxi-6-yodo-3-propilbenzopiranon-4-ona, N-[(Z)-[(ciclopropilmetoxi)imino]-[6-(difluorometoxi)-2,3-difluorofenil]metil]-2-benzoacetamida, N-(3-etil-3,5,5-trimetilciclohexil)-3-fenilamino-2-hidroxibenzamida, 2-[[[1-[3-(1-fluoro-2-feniletil)oxi]fenil]etiliden]amino]oxi]metil]-alfa-(metoxiimino)-N-metil-alfa-E-benzoacetamida, N-[2-[3-cloro-5-(trifluorometil)piridin-2-il]etil]-2-(trifluorometil)benzamida, N-(3',4'-dicloro-5-fluorobifenil-2-il)-3-(difluoroetil)-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, N-(6-metoxi-3-piridinil)ciclopropanocarboxamida, ácido 1-[(4-metoxifenoxi)metil]-2,2-dimetilpropil-1H-imidazol-1-carboxílico, ácido O-[1-[(4-metoxifenoxi)metil]-2]-dimetilpropil-1H-imidazol-1-carboxílico, 2-(2-[[6-(3-cloro-2-metilfenoxi)-5-fluoropirimidin-4-il]oxi]fenil)-2-(metoxiimino)-N-metilacetamida

[0135] Los componentes mencionados más arriba para combinaciones son conocidos como sustancias activas, varias de las cuales se describen en CH.R Worthing, S.B. Walker, The Pesticide Manual, 13rd Edition, British Crop Protection Council, Farnham 2003.

[0136] Las dosis de utilización efectivas de los compuestos empleados en la invención pueden variar dentro de intervalos amplios, en especial en función de la naturaleza de la plaga a eliminar o el grado de infestación, por ejemplo, de plantaciones con estas plagas. En general, las composiciones según la invención suelen contener de aproximadamente 0.05 hasta aproximadamente 95% (en peso) de uno o más ingredientes activos según la invención, aproximadamente 1 hasta aproximadamente 95% de uno o más transportadores sólidos o líquidos y, opcionalmente, aproximadamente 0.1 hasta aproximadamente 50% de uno o más de otros componentes compatibles, tales como agentes tensoactivos o similares.

[0137] En la presente descripción, el término "transportador" indica un ingrediente orgánico o inorgánico, natural o sintético, con los que se combina el ingrediente activo para facilitar su aplicación, por ejemplo, a la planta, las semillas o al suelo. Por lo tanto, este transportador es en general inerte y debe ser aceptable (por ejemplo, aceptable agrónomicamente, en especial para la planta tratada).

[0138] El transportador puede ser un sólido, por ejemplo, silicatos naturales o sintéticos, sílice, resinas, ceras, fertilizantes sólidos (por ejemplo sales de amonio), minerales naturales del suelo, tales como caolinas, arcillas, talco, tiza, cuarzo, attapulgita, montmorillonita, bentonita o tierra diatómea, o minerales naturales del suelo, tales como sílice, alumina, o silicatos, en especial silicatos de aluminio o magnesio. Como transportadores sólidos para gránulos son adecuados los siguientes: piedras naturales trituradas o fraccionadas tales como calcita, marmol, piedra pómez, sepiolita y dolomita; gránulos sintéticos de comida inorgánica u orgánica; gránulos de material orgánico tales como serrín, cáscaras de coco, mazorcas de maíz, hojas de maíz o tallos de tabaco; kieselguhr, fosfato de tricalcio, corcho pulverizado, negro de carbono absorbente; polímeros solubles en agua, resinas, ceras; o fertilizantes sólidos. Estas composiciones sólidas pueden, si se desea, contener uno o más agentes humidificadores, dispersantes, emulsificadores o colorantes compatibles que, en estado sólido, también sirven como diluyentes.

[0139] El transportador también puede ser líquido, por ejemplo: agua, alcoholes, en especial butanol o glicol, así como sus éteres o ésteres, en especial acetato de metilglicol; cetonas, en especial acetona, ciclohexanona, metiletil cetona, metilisobutilcetona, o isoforona; fracciones de petróleo tales como hidrocarburos de parafina o aromáticos, en especial xilenos o alquilo naftaleno; aceites minerales o vegetales; hidrocarburos alifáticos clorados, en especial tricloroetano o cloruro de metileno; hidrocarburos aromáticos clorados, en especial clorobencenos; disolventes solubles en agua o fuertemente polares tales como dimetilformamida, dimetilo sulfóxido, o N-metilpirrolidona; gases líquidos; o similares o una mezcla de estos.

[0140] El agente tensoactivo puede ser un agente emulsificador, un agente dispersante o un agente humidificador de tipo iónico o no-iónico o una mezcla estos agentes tensoactivos. Entre estos se cuentan por ejemplo, sales de ácidos poli acrílicos, sales de ácidos lignosulfónicos, sales de ácidos fenolesulfónicos o naftalenesulfónicos, policondensados de óxido de etileno con alcoholes grasos o ácidos grasos o ésteres grasos o aminas grasas, fenoles sustituidos (en especial alquilofenoles o arilfenoles), sales de ésteres ácidos sulfosuccínicos, derivados taurinos (en especial alquilo-tauratos), ésteres fosfóricos de alcoholes o de policondensados de óxido de etileno con fenoles, ésteres de ácidos grasos con polioles, o derivados funcionales de sulfato, sulfonato o fosfato de los compuestos mencionados. La presencia de al menos un agente tensoactivo es en general esencial cuando el ingrediente activo y/o el transportador inerte son solamente ligeramente solubles o no solubles y el agente transportador de la composición para la aplicación es agua.

[0141] Las composiciones de la invención pueden contener también otros aditivos tales como adhesivos o colorantes. Se pueden utilizar en las formulaciones adhesivos tales como carboximetilcelulosa o polímeros naturales o sintéticos en la forma de polvos, gránulos o celdas, tales como goma arábiga, alcohol de polivinilo o acetato de polivinilo, fosfolípidos naturales, tales como cefalinas o lecitinas, o fosfolípidos sintéticos. Es posible utilizar colorantes tales como pigmentos inorgánicos, por ejemplo: óxidos de hierro, óxidos de titanio o azul prusiano;

colorantes orgánicos, tales como colorantes de alizarina, azo de metal o de ftalocianina, u oligoelementos tales como sales de hierro, manganeso, boro, cobre, cobalto, molibdeno, o zinc.

5 **[0142]** Por lo tanto, para su aplicación en la agricultura, los compuestos de la invención tienen en general la forma de composiciones, en varias formas líquidas o sólidas. Se pueden utilizar formas sólidas de composiciones tales como polvos (con un contenido del compuesto de la invención de hasta 80%), polvos o gránulos humidificables (incluyendo gránulos dispersables en agua), en especial aquellos obtenidos por extrusión, compactación, impregnación de un transportador granular, o granulación a partir de un polvo (estando el contenido del compuesto de la invención, en estos polvos o gránulos humidificables entre aproximadamente 0.5 y aproximadamente 80%). Se pueden utilizar composiciones sólidas homogéneas o heterogéneas que contienen uno o más compuestos de la
10 invención, por ejemplo gránulos, pellets, briquetas o cápsulas, para tratar aguas estancadas o corrientes durante un periodo de tiempo. Un efecto similar se puede lograr empleando alimentación por goteo o intermitente de concentrados dispersables en agua tal como se describe aquí.

15 **[0143]** Las composiciones líquidas incluyen, por ejemplo, soluciones o suspensiones acuosas o no acuosas (tales como concentrados emulsificables, emulsiones, fluidos, dispersiones, o soluciones) o aerosoles. Las composiciones líquidas también incluyen, en particular, polvos humidificables de concentrados emulsificables, emulsiones, fluidos, dispersiones, aerosoles (o polvo para rociar), pastas o fluidos secos como formas de composiciones líquidas o destinadas a formar composiciones líquidas cuando se aplican, por ejemplo como esprays acuosos (incluyendo volumen bajo y muy bajo) o como nieblas o aerosoles. Las composiciones líquidas, por ejemplo, en la forma de
20 concentrados emulsificables o solubles comprenden en la mayoría de las veces aproximadamente de 5 a aproximadamente 80% en peso del ingrediente activo, mientras que las emulsiones o soluciones listas para su aplicación contienen, en su caso, aproximadamente de 0.01 a aproximadamente 20% del ingrediente activo. Aparte del disolvente, los concentrados emulsificables o solubles pueden contener, cuando sea necesario, aproximadamente de 2 a aproximadamente 50% de aditivos adecuados, tales como estabilizadores, agentes tensoactivos, agentes de penetración, inhibidores de la corrosión, colorantes o adhesivos. Se pueden obtener
25 emulsiones de cualquier concentración buscada, que son en especial adecuadas para su aplicación, por ejemplo, a plantas, a partir de estos concentrados por dilución con agua. Estas composiciones están al alcance de las composiciones que se pueden emplear en la presente invención. Las emulsiones pueden estar en la forma de agua en aceite o aceite en agua y pueden tener una consistencia espesa.

30 **[0144]** Las composiciones líquidas de esta invención pueden ser usadas, además de en los usos normales, en agricultura por ejemplo para tratar sustratos o lugares infestados o que pueden ser infestados por artrópodos (u otras plagas controladas por los compuestos de esta invención) incluyendo establecimientos de almacenamiento o de procesado internos o al aire libre, contenedores o equipos o aguas corrientes o estancadas.

35 **[0145]** Se pueden aplicar todas estas dispersiones o emulsiones acuosas o mezclas para rociado, por ejemplo, a plantaciones mediante cualquier medio apropiado, principalmente por rociado, a velocidades que son en general del orden de aproximadamente 100 a aproximadamente 1,200 litros de mezcla de rociado por hectárea, aunque puede ser mayor o menor (por ejemplo volumen bajo o ultra bajo) dependiendo de las necesidades o de la técnica de aplicación. El compuesto o composiciones según la invención se aplican convenientemente a vegetación y en particular a raíces u hojas que contienen plagas a eliminar. Otro procedimiento de aplicación de los compuestos o composiciones según la invención es por quimigación, es decir, la adición de una formulación que contiene el
40 ingrediente activo para irrigar con agua. Esta irrigación puede ser irrigación por rociado para pesticidas foliares o puede ser irrigación de suelo o subsuelo o para pesticidas sistémicos.

45 **[0146]** Las suspensiones de concentrado, que se pueden aplicar por rociado, se preparan para que produzcan un producto estable fluido que no se deposite (triturado fino) y suelen contener desde aproximadamente 10 a aproximadamente 75% en peso de ingrediente activo, desde aproximadamente 0.5 a aproximadamente 30% de agentes tensoactivos, desde aproximadamente 0.1 a aproximadamente 10% de agentes tixotrópicos, desde aproximadamente 0 a aproximadamente 30% de aditivos adecuados, tales como agentes anti-espuma, inhibidores de la corrosión, estabilizadores, agentes de penetración, adhesivos y, como transportador, agua o un líquido orgánico en el que el ingrediente activo es poco soluble o insoluble algunas sales orgánicas o inorgánicas se pueden disolver en el transportador para evitar la deposición o como anticongelante del agua.

50 **[0147]** Los polvos humidificables (o polvo para rociado) se suelen preparar para que contengan desde aproximadamente 10 a aproximadamente 80% en peso de ingrediente activo, desde aproximadamente 20 a aproximadamente 90% de transportador sólido, desde aproximadamente 0 a aproximadamente 5% de a agente humidificador, desde aproximadamente 3 a aproximadamente 10% de agente dispersante y, cuando sea necesario, desde aproximadamente 0 a aproximadamente 80% de uno o más estabilizadores y/o otros aditivos, tales como
55 agentes de penetración, adhesivos, agentes anti-formación de galletas, colorantes, o similares. Para obtener estos polvos humidificables, el ingrediente activo se mezcla totalmente en un mezclador adecuado con sustancias adicionales que se pueden impregnar sobre un relleno poroso y se tritura utilizando un triturador o molino adecuado. Esto produce polvos humidificables, cuya humidificabilidad y grado de suspensión son ventajosos. Se pueden

suspender en agua para producir cualquier concentración deseada y esta suspensión se puede emplear muy ventajosamente para su aplicación al follaje de plantas.

5 **[0148]** Los "gránulos dispersables en agua (WG)" (gránulos que se dispersan inmediatamente en agua) tienen composiciones que son sustancialmente parecidas a los polvos humidificables. Se pueden preparar por granulación de formulaciones descritas para los polvos humidificables, ya sea mediante camino húmedo (poner en contacto ingrediente activo finamente dividido con un relleno inerte y un poco de agua, por ejemplo de 1 a 20% en peso, o con una solución acuosa de un agente dispersante o de unión, y luego secar y poner máscara), o mediante un camino seco (compactación seguida de triturado y máscara).

10 **[0149]** Las concentraciones y tasa de las composiciones formuladas pueden variar según el procedimiento de aplicación o la naturaleza de las composiciones o utilización de estas. En términos generales, las composiciones para la aplicación para el control de plagas de artrópodos o nematodos de plantas suelen contener desde aproximadamente 0.0001 % a aproximadamente 95%, más especialmente desde aproximadamente 0.0005% a aproximadamente 50% en peso de uno o más compuestos de la invención, o de ingredientes activos totales (es decir los compuestos de la invención, junto con otras sustancias tóxicas para los artrópodos o nematodos de planta, elementos de sinergia, elementos de traza o estabilizadores). Las composiciones empleadas y su tasa de aplicación se seleccionaran para obtener el o los efectos deseados por el granjero, productor de ganado, el médico, o veterinario, el operario del control de plagas u otro experto en la materia.

20 **[0150]** Las composiciones sólidas o líquidas para la aplicación tópica a animales, madera, productos almacenados o bienes domésticos suelen contener desde aproximadamente 0.0005% a aproximadamente 90%, más especialmente desde aproximadamente 0.001 % a aproximadamente 10%, en peso de uno o más compuestos de la invención. Para la administración a animales por vía oral o parenteral, incluyendo composiciones líquidas o sólidas percutáneas, estos suelen contener desde aproximadamente 0.1 % a aproximadamente 90% en peso de uno o más compuestos de la invención. Los alimentos con medicamentos contienen normalmente desde aproximadamente 0.001% a aproximadamente 3% en peso de uno o más compuestos de la invención. Los concentrados o suplementos para el mezclado con alimentos contienen normalmente desde aproximadamente 5% a aproximadamente 90%, preferentemente desde aproximadamente 5% a aproximadamente 50%, en peso de uno o más compuestos de la invención. Los lamederos de sales minerales contienen normalmente desde aproximadamente 0.1% a aproximadamente 10% en peso de uno o más compuestos de fórmula (I) o sales aceptables como pesticidas de estos.

30 **[0151]** Los polvos o composiciones líquidas para su aplicación a ganado, bienes, establecimientos o zonas externas pueden contener desde aproximadamente 0.0001 % a aproximadamente 15%, más especialmente desde aproximadamente 0.005% a aproximadamente 2.0%, en peso, de uno o más compuestos de la invención. Unas concentraciones adecuadas en aguas tratadas están entre aproximadamente 0.0001 ppm y aproximadamente 20 ppm, más especialmente aproximadamente 0.001 ppm a aproximadamente 5.0 ppm de uno o más compuestos de la invención, y se pueden utilizar terapéuticamente en piscifactorías con tiempos de exposición adecuados. Los cebos comestibles pueden contener desde aproximadamente 0.01% a aproximadamente 5%, preferentemente desde aproximadamente 0.01 % a aproximadamente 1.0%, en peso, de uno o más compuestos de la invención.

40 **[0152]** Cuando se administra a vertebrados por vía parenteral, oral o percutánea u otros medios, la dosificación de los compuestos de la invención, dependerá de la especie, edad, o salud del vertebrado y de la naturaleza y grado de infestación actual o potencial por plagas de artrópodos o helmintos. Un única dosis de aproximadamente 0.1 a aproximadamente 100 mg, preferentemente de aproximadamente 2.0 a aproximadamente 20.0 mg, por kg de animal o dosis de aproximadamente 0.01 a aproximadamente 20.0 mg, preferentemente aproximadamente 0.1 a aproximadamente 5.0 mg, por kg de animal por día, para una medicación sostenida, son en general adecuadas por administración oral o parenteral. Mediante la utilización y combinación de dispositivos de liberación sostenida de formulaciones, la dosis diaria requerida durante un periodo de meses se puede administrar a animales de una única vez.

50 **[0153]** Los siguientes EJEMPLOS 2A - 2M de composiciones ilustran composiciones para su utilización contra artrópodos, en especial ácaros o insectos, o nematodos de planta, que comprenden, como ingrediente activo, compuestos de la invención, tales como aquellos descritos ejemplos de preparados. Las composiciones descritas en los EJEMPLOS 2A - 2M pueden ser todos diluidos para dar como resultado una composición que se puede rociar en concentraciones adecuadas para la utilización en el campo. Las descripciones químicas genéricas de los ingredientes (para las cuales todos siguientes porcentajes están en porcentaje en peso), utilizadas en los EJEMPLOS 2A - 2M siguientes, son tal como se muestra a continuación:

| Marca | Descripción química |
|--------------|---|
| Etilan BCP | condensado de Nonilfenol óxido de etileno |
| Soprofor BSU | condensado de Tristirilfenol óxido de etileno |
| Arilan CA | una solución al 70% p/v de dodecilbencenosulfonato de calcio |
| Solvesso 150 | disolvente C ₁₀ aromático ligero |
| 5 Arylan S | dodecilbencenosulfonato de sodio Darvan NO ₂ lignosulfonato de sodio |
| Celite PF | transportador de silicato de magnesio sintético |
| Sopropon T36 | sales de sodio de ácidos policarboxícos |
| Rhodigel 23 | goma xantana polisacarido |
| Bentone 38 | Derivado orgánico de montmorillonite de magnesio |
| 10 Aerosil | Dióxido de sílice microfino |

EJEMPLO 2A

[0154] Un concentrado soluble en agua se prepara con la composición tal como se indica a continuación:

Ingrediente activo 7%

Etilan BCP 10%

15 N-metilpirrolidone 83%

A una solución de Etilan BCP disuelta en una porción de N-metilpirrolidone se le añade el ingrediente activo con calentamiento y mezclado hasya que se disuelve. La solución resultante se completa en volumen con el disolvente restante.

EJEMPLO 2B

20 **[0155]** Un concentrado emulsificable (EC) se prepara con la composición tal como se indica a continuación:

Ingrediente activo 25%(max)

Soprophor BSU 10%

Arylan CA 5%

N-metilpirrolidone 50%

25 Solvesso 150 10%

Los primeros tres componentes se disuelven en N-metilpirrolidone y a esto se le añade luego el Solvesso 150 para llegar al volumen final.

EJEMPLO 2C

[0156] Un polvo humidificable (WP) se prepara con la composición tal como se indica a continuación:

30 Ingrediente activo 40%

Arylan S 2%

Darvan NO₂ 5%

Celite PF 53%

35 Los ingredientes se mezclan y asientan en un molino de martillo a polvo con un tamaño de partícula de menos de 50 micras.

EJEMPLO 2D

[0157] Una formulación fluida acuosa se prepara con la composición tal como se indica a continuación:

Ingrediente activo 40.00%

Etilan BCP 1.00%

Sopropon T360. 0.20%

5 Etilen glicol 5.00%

Rhodigel 230. 0.15%

Agua 53.65%

Los ingredientes se mezclan íntimamente y se asientan en un molino de bolas hasta que se obtiene un tamaño de partícula de menos de 3 micras.

10 EJEMPLO 2E

[0158] Un concentrado de suspensión emulsificable se prepara con la composición tal como se indica a continuación:

Ingrediente activo 30.0%

Etilan BCP 10.0%

15 Bentone 38 0.5%

Solvesso 150 59.5%

Los ingredientes se mezclan íntimamente y se asientan en un molino de bolas hasta que se obtiene un tamaño de partícula de menos de 3 micras.

EJEMPLO 2F

20 **[0159]** Un gránulo dispersable en agua se prepara con la composición tal como se indica a continuación:

Ingrediente activo 30%

Darvan No 2 15%

Arylan S 8%

Celite PF 47%

25 Los ingredientes se mezclan, micronizan en un molino movido por fluido y luego se granula en un pelletizador giratorio mediante rociado con agua (hasta 10%). Los gránulos resultantes se secan en un secador de lecho fluido para retirar el exceso de agua.

EJEMPLO 2G

[0160] Un polvo secante se prepara con la composición tal como se indica a continuación:

30 Ingrediente activo 1 a 10%

Polvo de talco-superfino de 99 a 90%

Los ingredientes se mezclan íntimamente y se asientan lo suficientemente para lograr un polvo fino. Este polvo puede aplicarse al lugar de infestación de artrópodos, por ejemplo en vertederos de rechazo, productos almacenados o bienes o animales domésticos infestados, o con riesgo de ser infestados por, artrópodos para controlarlos por ingestión oral. Unos medios adecuados para distribuir el polvo secante al lugar de infestación de

35 artrópodos incluyen ventiladores mecánicos, manuales o dispositivos automáticos de tratamiento de ganado.

EJEMPLO 2H

[0161] Un cebo comestible se prepara con la composición tal como se indica a continuación:

Ingrediente activo 0.1 a 1.0%

Harina de trigo 80%

Melazas 19.9 a 19%

- 5 Los ingredientes se mezclan íntimamente y se conforman en forma de cebo. Este cebo comestible puede ser distribuido en un lugar, por ejemplo establecimientos domésticos o industriales, por ejemplo cocinas, hospitales o almacenes, o zonas al aire libre, infestados por artrópodos, por ejemplo hormigas, langostas, cucarachas o moscas, para controlar los artrópodos por ingestión oral.

EJEMPLO 2I

- 10 **[0162]** Una formulación de solución se prepara con una composición tal como se indica a continuación:

Ingrediente activo 15%

Sulfóxido de dimetilo 85%

- 15 El ingrediente activo se disuelve en sulfóxido de dimetilo con mezclado y calentamiento si es necesario. Esta solución puede aplicarse de forma percutánea como aplicación por vertido en animales domésticos infestados por artrópodos o, tras esterilización por filtración a través de una membrana de politetrafluoroetileno (0.22 micrómetros de tamaño de poro), por inyección parenteral, a una velocidad de aplicación desde 1.2 a 12 ml de solución por 100 kg de animal.

EJEMPLO 2J

[0163] Un polvo humidificable se prepara con la composición tal como se indica a continuación:

- 20 Ingrediente activo 50%

Etilan BCP 5%

Aerosil 5%

Celite PF 40%

- 25 El Etilan BCP es absorbido sobre el Aerosil que luego se mezcla con los otros ingredientes y asientan en un molino de martillos para dar un polvo humidificable, que se puede diluir con agua a una concentración desde 0.001 % a 2% en peso del compuesto activo y aplicado a un lugar de infestación por artrópodos, por ejemplo, larvas dípteras o nematodos de planta, por rociado, o a animales domésticos infestados por, o con riesgo de infección por artrópodos, por rociado o inmersión, o por administración oral en agua de bebida, para controlar los artrópodos.

EJEMPLO 2K

- 30 **[0164]** Una composición de bolo de liberación lenta se hace a partir de gránulos que contienen los siguientes componentes con porcentajes variables (similares a aquellos descritos para las composiciones previas) dependiendo de las necesidades:

Ingrediente activo

Agente de densidad

- 35 Agente de liberación lenta

Ligante

- 40 Los ingredientes íntimamente mezclados se conforman en gránulos que son comprimidos a modo de bolo con una gravedad de 2 o más. Puede ser administrado oralmente a animales domésticos rumiantes para su retención en el retículo-rumen para proporcionar una liberación lenta y progresiva del compuesto activo durante un periodo de tiempo extendido para control de infestación de animales domésticos rumiantes por artrópodos.

EJEMPLO 2L

[0165] Una composición de liberación lenta en la forma de gránulos, pellets, briquetas o similares puede ser preparada con composiciones tal como siguen:

Ingrediente activo 0.5 a 25%

Cloruro de polivinilo 75 a 99.5%

5 Ftalato de dioctilo (plastificador)

Los componentes se mezclan y son conformados con formas adecuadas por moldeado o fusión-extrusión. Estas composiciones son útiles, por ejemplo, para la adición a agua estancada o para fabricación de collares o etiquetas para las orejas para su fijación a animales domésticos para el control de plagas y liberación lenta.

EJEMPLO 2M

10 **[0168]** Un gránulo dispersable en agua se prepara con la composición tal como se indica a continuación:

Ingrediente activo 85%(máx.)

Polivinilpirrolidone 5%

Arcilla de attapulgita 6%

Lauril Sulfato sodio 2%

15 Glicerina 2%

Los ingredientes se mezclan como lodo con 45% de agua y serán triturados en húmedo hasta un tamaño de partícula de 4 micras, y luego secado por espray para eliminar el agua.

PROCEDIMIENTOS DE USO PESTICIDA

20 **[0170]** Se llevó a cabo el siguiente procedimiento de verificación representativo, empleando compuestos de la invención, para determinar la actividad parasiticida de compuestos de la invención.

PROCEDIMIENTO A: Procedimiento de *screening* para verificar la sistemicidad de compuestos contra Ctenocephaluros felis (Pulga del gato)

25 **[0171]** Un recipiente de test se llenó con 10 adultos de Ctenocephaluros felis. Un cilindro de cristal se cerró en un extremo con un parafilm y se dispuso sobre el recipiente. La solución compuesto de test se pipeteó con sangre bovina y se añadió al cilindro de cristal. Los Ctenocephaluros felis tratados se mantuvieron en este test de perro artificial (sangre 37°C, 40-60 % de humedad relativa; Ctenocephaluros felis 20-22°C, 40-60 % de humedad relativa) y análisis realizado 24 y 48 horas tras la aplicación. Los números de compuesto 09-09, 09-41, 13-02, 15-09, 17-10, 17-11, 17-20, 17-32, 01-04, 02-35, 03-02, 03-26, 20-02, 24-02, 24-11, 24-20, 24-44 y 25-02 dieron al menos 90% de control de Ctenocephaluros felis a una concentración de test de 5ppm o menos.

30 PROCEDIMIENTO B: Procedimiento de para verificar la actividad de contacto contra Rhipicephalus sanguineus (Garrapata marrón del perro)

35 **[0172]** Unas soluciones de los compuestos de test se vertieron sobre papel de filtro, se secaron y el papel de filtro se dispuso en tubos de test y se infestaron con 20-30 larvas (L1) de Rhipicephalus sanguineus y los tubos se cerraron con un clip. Los Rhipicephalus sanguineus tratados se mantuvieron en una cámara climática (25°C, 90% de HR) y se analizó el porcentaje de eficacia 24 horas y 48 horas tras aplicación comparadas con las de control no tratadas. Los números de compuesto 15-09, 17-10 y 23-02 dieron al menos 70% de control de Rhipicephalus sanguineus a una concentración de test de 100ppm.

cicloalquilo-(C₃-C₇), S(O)_pR¹², CN, NO₂, OH, R⁷, R⁹, COR⁸, NR¹³R¹⁴, OR⁸, CO₂H y CO₂R⁸;

R¹¹ es H o R¹⁰; o R¹⁰, R¹¹ y los N átomos enlazados forman un anillo que contiene opcionalmente un átomo adicional de N, O o S y está no sustituido o sustituido por uno o más radicales seleccionados del grupo consistente en halógeno, alquilo-(C₁-C₆) y oxo;

5 R¹² es alquilo-(C₁-C₆) o haloalquilo-(C₁-C₆),

R¹³ y R¹⁴ son cada uno independientemente H, alquilo-(C₁-C₆), haloalquilo-(C₁-C₆), alqueno-(C₂-C₆), alquino-(C₂-C₆), cicloalquilo-(C₃-C₇) o cicloalquilo-(C₃-C₇)- alquilo-(C₁-C₆);

m, n, p, q, s y t son cada uno independientemente 0, 1 ó 2;

r es 0, 1, 2 ó 3;

10 cada heterociclilo saturado, insaturado o heteroaromático en los radicales arriba mencionados es independientemente un radical heterocíclico que tiene de 3 a 7 átomos en el anillo y 1, 2 ó 3 heteroátomos en el anillo seleccionados del grupo que consiste en N, O y S;

cada heterociclilo saturado en los radicales arriba mencionados es independientemente un radical heterocíclico saturado con 3 a 7 átomos de anillo y 1, 2 ó 3 heteroátomos en el anillo seleccionados del grupo que consiste en N, O, S y P, y

15 O, S y P, y

cada arilo de los radicales arriba mencionados es independientemente un radical aromático mono-, bi- o policíclico, o una sal de los mismos aceptable como pesticida.

2. Compuesto o una de sus sales según la reivindicación 1 en el cual R¹ es CN.

3. Compuesto o una de sus sales según la reivindicación 1 o 2 en el cual R³ y R⁵ son cada uno CF₃.

20 4. Compuesto o una de sus sales según cualquiera de las reivindicaciones 1, 2 ó 3 donde:

R¹ es CN;

R² y R^{2a} son cada uno Cl;

R³ es CF₃;

25 R⁴ es H, alquilo-(C₁-C₆) donde el último grupo mencionado es no sustituido o sustituido por uno o varios radicales seleccionados del grupo constituido por halógeno, cicloalquilo-(C₃-C₇), CN, NO₂, R⁷, COR⁸, R⁹ y CO₂R⁸;

R⁵ es haloalquilo-(C₁-C₃); y

30 R⁶ es alquilo-(C₂-C₈), alqueno-(C₄-C₈), cicloalquilo-(C₃-C₇)- alquilo-(C₁-C₆) o fenil-alquilo -(C₁-C₆), estando los 4 últimos grupos mencionados no sustituidos o sustituidos (en las partes alquilo o alqueno) por uno o varios radicales X-Z; o un radical saturado heterociclilo- alquilo-(C₁-C₆), que está no sustituido o sustituido (en el anillo heterociclilo) por uno o dos radicales Z¹;

5. Compuesto o una de sus sales según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 4 donde:

R¹ es CN;

R² y R^{2a} son cada uno Cl;

R³ y R⁵ son cada uno CF₃;

35 R⁴ es H o alquilo-(C₁-C₆);

R⁶ es alquilo-(C₂-C₈), alqueno-(C₄-C₈), cicloalquilo-(C₃-C₇)- alquilo-(C₁-C₆) o fenil-alquilo -(C₁-C₆), estando los 4 últimos grupos mencionados no sustituidos o sustituidos (en las partes alquilo o alqueno) por uno o varios radicales X-Z; o un radical saturado heterociclilo- (CH₂), que está no sustituido o sustituido (en el anillo heterociclilo) por uno o más radicales Z¹; y

40 Z es H, cicloalquilo-(C₃-C₇), alcoxi-(C₁-C₆)- (CH₂O), alquilo-(C₁-C₆) o fenil-[alquilo -(C₁-C₆)]_s, R⁹-[alquilo -(C₁-C₆)]_t, CHO o R¹⁰-CO

donde el último grupo mencionado es no sustituido o sustituido por uno o varios radicales seleccionados del grupo constituido por halógeno, CN, NO₂, R⁷, COR⁸, R⁹ y CO₂R⁸;

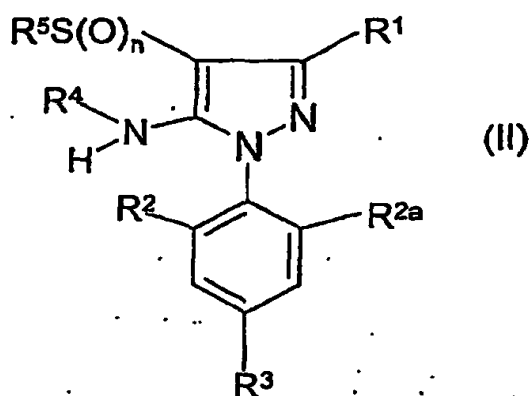
R⁵ es haloalquilo-(C₁-C₃); y

R⁶ es alquilo-(C₂-C₈), alqueno-(C₄-C₈), cicloalquilo-(C₃-C₇)- alquilo-(C₁-C₆) o fenil-alquilo -(C₁-C₆), estando los 4 últimos grupos mencionados no sustituidos o sustituidos (en las partes alquilo o alqueno) por uno o varios radicales X-Z; o un radical saturado heterociclilo- alquilo-(C₁-C₆), que está

no sustituido o sustituido (en el anillo heterociclilo) por uno o más radicales Z¹;

6. Procedimiento de preparación de un compuesto de fórmula (I) o de una de sus sales tal como se definen en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5, comprendiendo dicho procedimiento:

10 a) donde R¹, R², R^{2a}, R³, R⁴, R⁵, R⁶ y n son tales como se han definido en la reivindicación 1, la reacción de un compuesto de fórmula (II):



donde los diferentes valores son tales como se han definido en la reivindicación 1, con un agente acilante de fórmula (III) o (IV):

15 R⁶-O-CO-L (III)

(R⁶-O-CO-2-O (IV)

donde R⁶ es tal como se ha definido en la reivindicación 1 y L es un grupo saliente, y una base; o

b) donde R¹, R², R^{2a}, R³, R⁴, R⁵, R⁶ y n son tales como se han definido en la reivindicación 1, la reacción de un compuesto de fórmula (II) tal como se ha definido arriba, con fosgeno y un compuesto de fórmula (V) ;

20 R⁶-OH (V)

donde R⁶ es tal como se ha definido en la reivindicación 1, en presencia de una base; o

c) donde R⁶ es

alquilo-(C₂-C₈), alqueno-(C₄-C₈), cicloalquilo-(C₃-C₇)- alquilo-(C₁-C₆) o -(C₁-C₆)-arilo- alquilo, estando los 4 últimos grupos mencionados no sustituidos o sustituidos (en las partes alquilo o alqueno) por uno o varios radicales X-Z; o un radical saturado heterociclilo- alquilo-(C₁-C₆), que está no sustituido o sustituido (en el anillo heterociclilo) por uno o más radicales Z¹; X es O; Z es R¹⁰-CO y Z¹ es OCO alquilo-(C₁-C₆), OCO(CH₂)_qR⁷, OCO₂ alquilo-(C₁-C₆), OCO₂CH₂R⁷ o OCO alquilo-(C₁-C₆)-OCO alquilo-(C₁-C₆),

acilar un compuesto correspondiente de fórmula (II) donde Z es OH o Z¹ es OH, con un compuesto de fórmula (VI), (VII), (VIII), (IX), (X) o (XI):

30 L¹-OCO alquilo-(C₁-C₆) (VI)

L¹-OCO(CH₂)_qR⁷ (VII)

L¹-OCO₂ alquilo-(C₁-C₆) (VIII)

L¹-OCO₂(CH₂)_qR⁷ (IX)

L^1 -OCO alquilo-(C₁-C₆)-OCO alquilo-(C₁-C₆)(X)

R^{10} -CO- L¹ (XI)

donde R^7 y R^{10} son tal como se definen en la reivindicación 1 y L1 es un grupo saliente, y una base, o

- 5 d) cuando R^6 es alquilo-(C₂-C₈), alqueno-(C₄-C₈), cicloalquilo-(C₃-C₇)- alquilo-(C₁-C₆) o -(C₁-C₆)-arilo- alquilo, estando los 4 últimos grupos mencionados no sustituidos o sustituidos (en las partes alquilo o alqueno) por dos grupos adyacentes OH; o un radical saturado heterocíclico- alquilo-(C₁-C₆), que está no sustituido o sustituido (en el anillo heterocíclico) por dos grupos adyacentes OH que hidrolizan un derivado correspondiente acetal con un ácido fuerte, o
- 10 e) donde n es 1 ó 2, y R^1 , R^2 , R^{2a} , R^3 , R^4 , R^5 , R^6 y n son tales como se han definido en la reivindicación 1, oxidar el correspondiente compuesto en el que n es 0 o 1, y
- f) si se desea, convertir un compuesto resultante de fórmula (I) en una sal de los mismos aceptable como pesticida.
7. Compuesto pesticida que comprende un compuesto de fórmula (I) o una de sus sales aceptable como pesticida tal como se definen en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5, en asociación con un diluyente o un soporte y/o un agente tensoactivo aceptable para pesticidas.
- 15 8. Utilización de un compuesto de fórmula (I) o de una de sus sales según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5 o de una composición según la reivindicación 7, para la preparación de un medicamento veterinario.
9. Utilización de un compuesto de fórmula (I) o de una de sus sales según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5 o de una composición según la reivindicación 7, en la preparación de un medicamento para el control de plagas.
- 20 10. Procedimiento de control de plagas en un lugar que comprende la aplicación en el lugar de una cantidad eficaz de un compuesto de fórmula (I) o de una de sus sales tal como se ha reivindicado en cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5 o de una composición según la reivindicación 7, donde el lugar es la propia plaga, el suelo, un producto almacenado, un producto doméstico, una planta cultivada, una semilla de una planta cultivada, una propiedad o zona del entorno general.
- 25 11. Compuesto de fórmula (I) o de una de sus sales según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 5 o una composición según la reivindicación 7, para su utilización en el control de plagas.