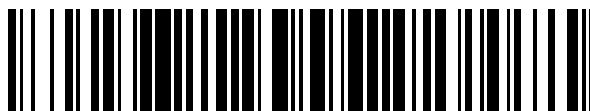


19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 379 845**

51 Int. Cl.:
C07C 205/06 (2006.01)
C07D 207/04 (2006.01)
C07D 401/04 (2006.01)
C07D 401/12 (2006.01)
C07D 403/10 (2006.01)
C07D 401/14 (2006.01)
A01N 43/36 (2006.01)
A01N 43/40 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Número de solicitud europea: **08735310 .8**
96 Fecha de presentación: **14.04.2008**
97 Número de publicación de la solicitud: **2148853**
97 Fecha de publicación de la solicitud: **03.02.2010**

54 Título: **Aril pirrolidinas como insecticidas**

30 Prioridad:
23.04.2007 JP 2007112855

45 Fecha de publicación de la mención BOPI:
04.05.2012

45 Fecha de la publicación del folleto de la patente:
04.05.2012

73 Titular/es:
BAYER CROPSCIENCE AG
ALFRED-NOBEL-STRASSE 50
40789 MONHEIM, DE

72 Inventor/es:
MIHARA, Jun;
MURATA, Tetsuya;
YAMAZAKI, Daiei;
YONETA, Yasushi;
SHIBUYA, Katsuhiko;
SHIMOJO, Eiichi y
GÖRGENS, Ulrich

74 Agente/Representante:
Carpintero López, Mario

ES 2 379 845 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

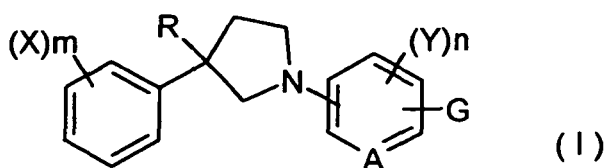
Aril pirrolidinas como insecticidas

La presente invención se refiere a nuevas aril pirrolidinas y el uso de las mismas como insecticidas.

5 El documento WO2005/085216 describe que los compuestos de benzamida sustituida con isoxazolina son útiles como agentes de control de plagas. Pueden encontrarse insecticidas adicionales en los documentos WO2006/101828 y WO03/067986.

10 Los inventores se dedicaron a estudiar el desarrollo de nuevos compuestos que muestren mayores efectos y un espectro amplio contra plagas animales, tales como insectos y ácaros. Como resultado, los inventores descubrieron nuevas aril pirrolidinas que muestran una actividad excelente, es decir alta, que tienen un amplio espectro y son inocuas para insectos beneficiosos, tales como abejas, así como eficaces contra plagas de insectos. Particularmente para los insectos que son resistentes a insecticidas, tales como agentes de organofósforo o carbamato.

Los compuestos de acuerdo con la invención se representan por la fórmula (I)



en la que

15 X que puede ser igual o diferente, representa halógeno, haloalquilo, nitro, alquilo, alcoxi, ciano, haloalcoxi, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, haloalquiltio, haloalquilsulfinilo, haloalquilsulfonilo, hidroxilo, mercapto, amino, alquilcarbonilamino, haloalquilcarbonilamino, benzoilamino, alcocarbonilamino, haloalcoxycarbonilamino, alquilsulfonilamino o haloalquilsulfonilamino;

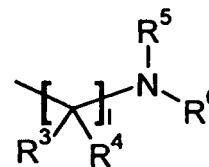
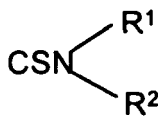
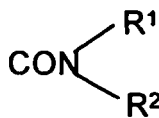
20 Y que puede ser igual o diferente, representa halógeno, haloalquilo, nitro, alquilo, alcoxi, ciano, haloalcoxi, alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, haloalquiltio, haloalquilsulfinilo, haloalquilsulfonilo, hidroxilo, mercapto, amino, alquilcarbonilamino, haloalquilcarbonilamino, benzoilamino, alcocarbonilamino, haloalcoxycarbonilamino, alquilsulfonilamino o haloalquilsulfonilamino;

R representa alquilo o haloalquilo;

m representa 0, 1, 2, 3, 4 ó 5;

25 n representa 1, 2, 3 ó 4;

G se selecciona entre el grupo que consiste en



30 en las que cada R¹ y R² representa independientemente hidrógeno; alquilo opcionalmente sustituido, alquenido, alquinilo, cicloalquilo o alquilsulfonilo; haloalquilsulfonilo o CH₂-R⁷; o cuando se toman juntos representan alquilenos C₂₋₆; cada R³ y R⁴ representa independientemente hidrógeno; ciano; alquilo opcionalmente sustituido, alquenido, alquinilo, cicloalquilo; o cuando se toman juntos representan alquilenos C₂₋₆;

l representa 1, 2 ó 3;

35 R⁵ representa hidrógeno; alquilo; cicloalquilo opcionalmente sustituido; haloalquilo; ciano; alquenido; alquinilo; alquilcarbonilo o CH₂-R⁷;

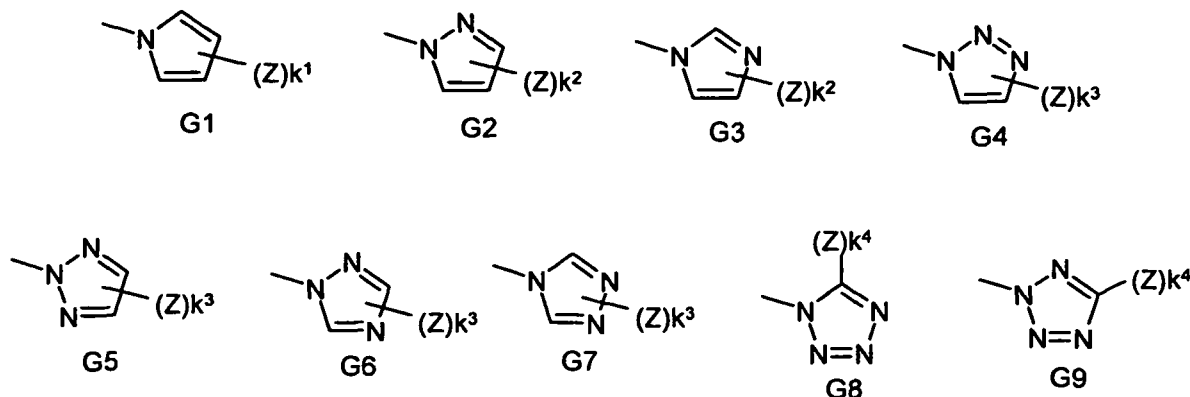
R⁶ representa formilo, ciano, alquilcarbonilo, alquiltiocarbonilo, haloalquilcarbonilo, haloalquiltiocarbonilo, alquilaminocarbonilo, alquilaminotiocarbonilo, dialquilaminocarbonilo, dialquilaminotiocarbonilo, alcoxiaminocarbonilo, alcoxiaminotiocarbonilo, alcocarbonilo, alcoxitiocarbonilo, tioalcoxycarbonilo, tioalcoxitiocarbonilo, CO-R⁷,

40 CS-R⁷, alquilsulfonilo o haloalquilsulfonilo; o como alternativa

R⁵ y R⁶, cuando se toman junto con el nitrógeno al que están unidos, forman un anillo de 3-6 miembros que

contiene al menos un átomo de N y, opcionalmente, al menos otro heteroátomo seleccionado entre S y O, en el que el anillo está opcionalmente sustituido con ceto o tioceto;

o el grupo que consiste en los heterociclos G1 a G9:



5 Z que puede ser igual o diferente, representa halógeno, haloalquilo, nitro, alquilo, alcoxi, ciano, haloalcoxi, alquilsulfonilo, haloalquilsulfonilo, hidroxilo o mercapto;

k^1 representa 0, 1, 2, 3 ó 4;

k^2 representa 0, 1, 2 ó 3;

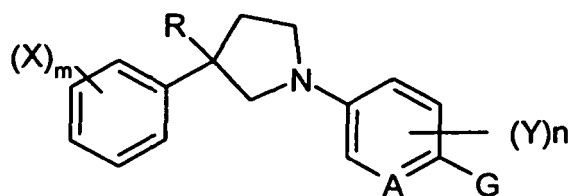
k^3 representa 0, 1 ó 2;

10 k^4 representa 0 ó 1;

k^7 representa fenilo o anillo heterocíclico, que están opcionalmente sustituidos con al menos un sustituyente seleccionado entre halógeno y alquilo C₁₋₆; y

A representa C o N.

Entre los compuestos de fórmula (I) de la invención, son compuestos preferidos, compuestos de fórmula (1a)



15

(1a)

en la que X, Y, R, A, G, Y, n y m son como se han definido anteriormente.

Entre los compuestos de la fórmula (I) o la fórmula (1a) de la invención, son compuestos preferidos adicionalmente aquellos en los que

20 X que puede ser igual o diferente, representa halógeno, haloalquilo C₁₋₆, nitro, alquilo C₁₋₆, alcoxi C₁₋₆, ciano, haloalcoxi C₁₋₆, alquiltio C₁₋₆, alquilsulfonilo C₁₋₆, alquilsulfonilo C₁₋₆, haloalquiltio C₁₋₆, haloalquilsulfonilo C₁₋₆, haloalquilsulfonilo C₁₋₆, hidroxilo, mercapto, amino, alquilcarbonilamino C₁₋₆, C₁₋₆ haloalquilcarbonilamino, benzoilamino, alcocarbonilamino C₁₋₆, haloalcoxi C₁₋₆-carbonilamino, alquilsulfonilamino C₁₋₆ o haloalquilsulfonilamino C₁₋₆;

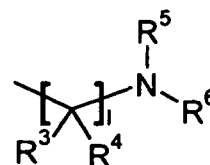
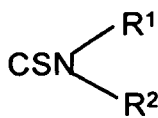
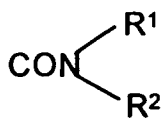
25 Y que puede ser igual o diferente, representa halógeno, haloalquilo C₁₋₆, nitro, alquilo C₁₋₆, alcoxi C₁₋₆, ciano, haloalcoxi C₁₋₆, alquiltio C₁₋₆, alquilsulfonilo C₁₋₆, alquilsulfonilo C₁₋₆, haloalquiltio C₁₋₆, haloalquilsulfonilo C₁₋₆, haloalquilsulfonilo C₁₋₆, hidroxilo, mercapto, amino, alquilcarbonilamino C₁₋₆, haloalquilcarbonilamino C₁₋₆, benzoilamino, alcocarbonilamino C₁₋₆, haloalcoxi C₁₋₆-carbonilamino, alquilsulfonilamino C₁₋₆ o haloalquilsulfonilamino C₁₋₆;

R representa alquilo C₁₋₆ o haloalquilo C₁₋₆;

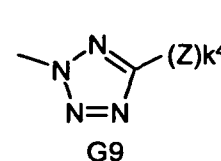
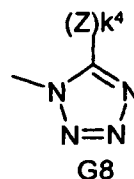
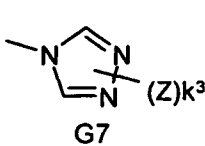
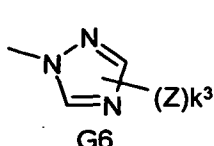
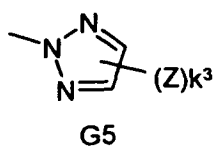
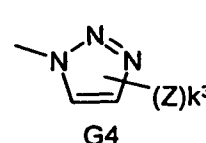
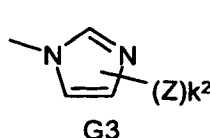
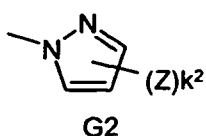
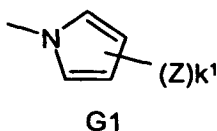
30 m representa 0, 1, 2, 3, 4 ó 5;

n representa 0, 1, 2 ó 4;

G se selecciona entre el grupo que consiste en



o grupo que consiste en los G1 a G9:



5

en los que

cada R^1 y R^2 representa independientemente hidrógeno; alquilo C_{1-6} opcionalmente sustituido, alqueno C_{2-6} , alquino C_{2-6} , cicloalquilo C_{3-7} ; alquilsulfonilo C_{1-6} , haloalquilsulfonilo C_{1-6} o CH_2-R^7 ; o cuando se toman juntos representan alqueno C_{2-6} ;

10 cada R^3 y R^4 representa independientemente hidrógeno, ciano; alquilo C_{1-6} opcionalmente sustituido, alqueno C_{2-6} , alquino C_{2-6} , cicloalquilo C_{3-7} ; o alcocarbonilo C_{1-6} ; o cuando se toman juntos representan alqueno C_{2-6} ;

l representa 1, 2 ó 3;

R^5 representa hidrógeno; alquilo C_{1-6} ; cicloalquilo C_{3-7} opcionalmente sustituido; haloalquilo C_{1-6} ; ciano; alqueno C_{2-6} ; alquino C_{2-6} ; alquilcarbonilo C_{1-6} ; o CH_2-R^7 ;

15 R^6 representa formilo, ciano, alquilcarbonilo C_{1-6} , alquiltiocarbonilo C_{1-6} , haloalquilcarbonilo C_{1-6} , haloalquiltiocarbonilo C_{1-6} , alquilaminocarbonilo C_{1-6} , alquilaminotiocarbonilo C_{1-6} , dialquilamino-carbonilo que tiene de 2 a 8 átomos de carbono, dialquilaminotiocarbonilo que tiene de 2 a 8 átomos de carbono, alcóxiaminocarbonilo C_{1-6} , alcóxiaminotiocarbonilo C_{1-6} , alcocarbonilo C_{1-6} , alcóxtiocarbonilo C_{1-6} , tioalcóxycarbonilo C_{1-6} , tioalcóxtiocarbonilo C_{1-6} , $CO-R^7$, $CS-R^7$, alquilsulfonilo C_{1-6} o haloalquilsulfonilo C_{1-6} ; o

20 R^5 y R^6 , cuando se toman junto con el nitrógeno al que están unidos, forman un anillo de 3-6 miembros que contiene al menos un átomo de N y, opcionalmente, al menos otro heteroátomo seleccionado entre S y O, en el que el anillo está opcionalmente sustituido con ceto o tioceto;

Z que puede ser igual o diferente, representa halógeno, haloalquilo C_{1-6} , nitro, alquilo C_{1-6} , alcoxi C_{1-6} , ciano, haloalcoxi C_{1-6} , alquilsulfonilo C_{1-6} , haloalquilsulfonilo C_{1-6} , hidroxilo o mercapto;

25 k^1 representa 0, 1, 2, 3 ó 4;

k^2 representa 0, 1, 2 ó 3;

k^3 representa 0 ó 1;

k^4 representa 0 ó 1;

30 R^7 representa fenilo o un anillo heterocíclico, que están opcionalmente sustituidos con al menos un sustituyente seleccionado entre flúor, cloro, bromo, yodo y alquilo C_{1-6} ; y

A representa C o N.

Son compuestos adicionalmente preferidos de la fórmula (I) o de fórmula (Ia) de la invención, compuestos que los que

5 X que puede ser igual o diferente, representa halógeno, haloalquilo C₁₋₆, nitro, alquilo C₁₋₆, alcoxi C₁₋₆, ciano, haloalcoxi C₁₋₆, alquiltio C₁₋₆, alquilsulfinilo C₁₋₆, alquilsulfonilo C₁₋₆, haloalquiltio C₁₋₆, haloalquilsulfinilo C₁₋₆, haloalquilsulfonilo C₁₋₆, hidroxilo, mercapto, amino, alquilcarbonilamino C₁₋₆, haloalquilcarbonilamino C₁₋₆, benzoilamino, alcoxycarbonilamino C₁₋₆, haloalcoxi C₁₋₆-carbonilamino, alquilsulfonilamino C₁₋₆ o haloalquilsulfonilamino C₁₋₆;

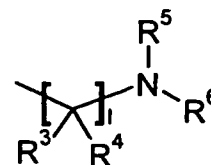
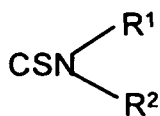
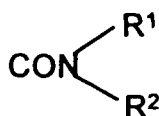
10 Y que puede ser igual o diferente, representa halógeno, haloalquilo C₁₋₆, nitro, alquilo C₁₋₆, alcoxi C₁₋₆, ciano, haloalcoxi C₁₋₆, alquiltio C₁₋₆, alquilsulfinilo C₁₋₆, alquilsulfonilo C₁₋₆, haloalquiltio C₁₋₆, haloalquilsulfinilo C₁₋₆, haloalquilsulfonilo C₁₋₆, hidroxilo, mercapto, amino, alquilcarbonilamino C₁₋₆, haloalquilcarbonilamino C₁₋₆, benzoilamino, alcoxycarbonilamino C₁₋₆, haloalcoxi C₁₋₆-carbonilamino, alquilsulfonilamino C₁₋₆ o haloalquilsulfonilamino C₁₋₆;

R representa alquilo C₁₋₆ o haloalquilo C₁₋₆;

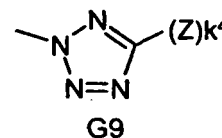
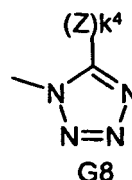
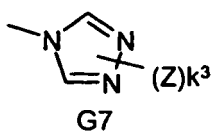
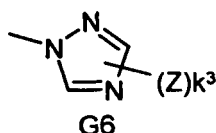
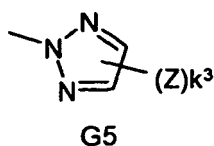
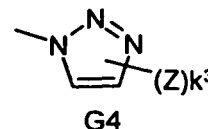
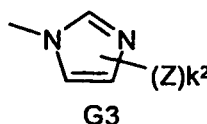
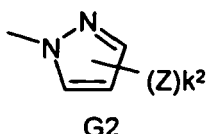
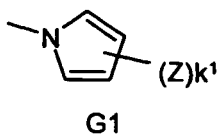
m representa 0, 1, 2 ó 3;

15 n representa 0, 1, 2 ó 3;

G se selecciona entre el grupo que consiste en



o el grupo que consiste en los heterociclos G1 a G9:



20 cada R¹ y R² representa independientemente hidrógeno, alquilo C₁₋₆ que puede estar sustituido, alqueno C₂₋₆ que puede estar sustituido, alquino C₂₋₆ que puede estar sustituido, cicloalquilo C₃₋₇ que puede estar sustituido, alquilsulfonilo C₁₋₆, haloalquilsulfonilo C₁₋₆ o CH₂-R⁷; o cuando se toman juntos representan alqueno C₃₋₅;

25 cada R³ y R⁴ representa independientemente hidrógeno, ciano, alquilo C₁₋₆ que puede estar sustituido, alqueno C₂₋₆ que puede estar sustituido, alquino C₂₋₆ que puede estar sustituido, cicloalquilo C₃₋₇ que puede estar sustituido o alcoxi C₁₋₆-carbonilo; o cuando se toman juntos representan alqueno C₃₋₅;

I representa 1 ó 2;

R⁵ representa hidrógeno, alquilo C₁₋₆, cicloalquilo C₃₋₇ que puede estar sustituido, haloalquilo C₁₋₆, ciano, alqueno C₂₋₆, alquino C₂₋₆, alquil C₁₋₆-carbonilo o CH₂-R⁷;

30 R⁶ representa formilo, ciano, alquil C₁₋₆-carbonilo, alquiltio C₁₋₆-carbonilo, haloalquilcarbonilo C₁₋₆, haloalquiltio C₁₋₆-carbonilo, alquilamino C₁₋₆-carbonilo, alquilaminotiocarbonilo C₁₋₆, dialquilamino-carbonilo que tiene de 2 a 8 átomos de carbono, dialquilaminotiocarbonilo que tiene de 2 a 8 átomos de carbono, alcoxiamino C₁₋₆-carbonilo, alcoxiaminotio C₁₋₆-carbonilo, alcoxi C₁₋₆-carbonilo, alcoxitio C₁₋₆-carbonilo, tioalcoxycarbonilo C₁₋₆, tioalcoxitiocarbonilo C₁₋₆, CO-R⁷, CS-R⁷, alquilsulfonilo C₁₋₆ o haloalquilsulfonilo C₁₋₆; o como alternativa

R⁵ y R⁶, cuando se toman junto con el nitrógeno al que están unidos, forman un anillo de 3-6 miembros que contiene al menos un átomo de N y, opcionalmente, al menos otro heteroátomo seleccionado entre S y O, en el que el anillo está opcionalmente sustituido con ceto o tioceto;

5 Z que puede ser igual o diferente, representa halógeno, haloalquilo C₁₋₆, nitro, alquilo C₁₋₆, alcoxi C₁₋₆, ciano, haloalcoxi C₁₋₆, alquilsulfonilo C₁₋₆, haloalquilsulfonilo C₁₋₆, hidroxilo o mercapto;

k¹ representa 0, 1, 2 ó 3;

k² representa 0, 1 ó 2;

k³ representa 0 ó 1;

k⁴ representa 0 ó 1;

10 R⁷ representa fenilo o un anillo heterocíclico, que están opcionalmente sustituidos con al menos un sustituyente seleccionado entre flúor, cloro, bromo, y alquilo C₁₋₆; y

A representa C o N.

Entre aquellos compuestos de la fórmula (I) o la fórmula (Ia), se prefieren particularmente compuestos en los que

15 X que puede ser igual o diferente, representa halógeno, haloalquilo C₁₋₄, nitro, alquilo C₁₋₄, alcoxi C₁₋₄, ciano, haloalcoxi C₁₋₄, alquiltio C₁₋₄, alquilsulfino C₁₋₄, alquilsulfonilo C₁₋₄, haloalquiltio C₁₋₄, haloalquilsulfino C₁₋₄, haloalquilsulfonilo C₁₋₄, hidroxilo, mercapto, amino, alquil C₁₋₄-carbonilamino, haloalquilcarbonilamino C₁₋₄, benzoilamino, alcóxicarbonilamino C₁₋₄, haloalcoxi C₁₋₄-carbonilamino, alquilsulfonilamino C₁₋₄ o haloalquilsulfonilamino C₁₋₄;

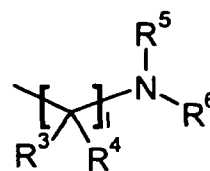
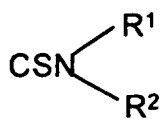
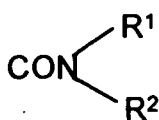
20 Y que puede ser igual o diferente, representa halógeno, haloalquilo C₁₋₄, nitro, alquilo C₁₋₄, alcoxi C₁₋₄, ciano, haloalcoxi C₁₋₄, alquiltio C₁₋₄, alquilsulfino C₁₋₄, alquilsulfonilo C₁₋₄, haloalquiltio C₁₋₄, haloalquilsulfino C₁₋₄, haloalquilsulfonilo C₁₋₄, hidroxilo, mercapto, amino, alquil C₁₋₄-carbonilamino, haloalquilcarbonilamino C₁₋₄, benzoilamino, alcóxicarbonilamino C₁₋₄, haloalcoxi C₁₋₄-carbonilamino, alquilsulfonilamino C₁₋₄ o haloalquilsulfonilamino C₁₋₄;

R representa alquilo C₁₋₄ o haloalquilo C₁₋₄;

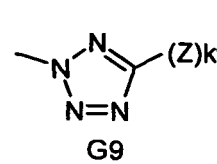
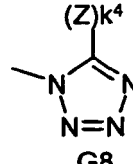
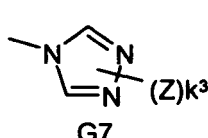
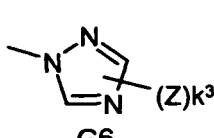
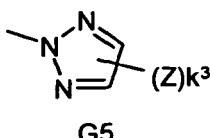
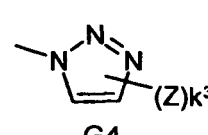
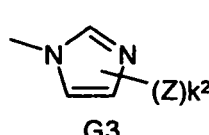
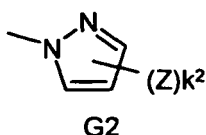
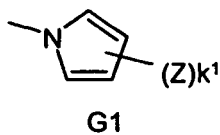
25 m representa 0, 1, 2 ó 3;

n representa 0, 1, 2 ó 3;

G se selecciona entre el grupo que consiste en



o el grupo que consiste en los heterociclos G1 a G9:



cada R^1 y R^2 representa independientemente hidrógeno, alquilo C_{1-4} que puede estar sustituido, alqueno C_{2-4} que puede estar sustituido, alquino C_{2-4} que puede estar sustituido, cicloalquilo C_{3-6} que puede estar sustituido, alquilsulfonilo C_{1-4} , haloalquilsulfonilo C_{1-4} o CH_2-R^7 ; o cuando se toman juntos representan alquieno C_{3-5} ;

5 cada R^3 y R^4 representa independientemente hidrógeno, ciano, alquilo C_{1-4} que puede estar sustituido, alqueno C_{2-4} que puede estar sustituido, alquino C_{2-4} que puede estar sustituido, cicloalquilo C_{3-6} que puede estar sustituido o alcoxil C_{1-4} -carbonilo; o cuando se toman juntos representan alquieno C_{3-5} ;

I representa 1 ó 2;

R^5 representa hidrógeno, alquilo C_{1-4} , cicloalquilo C_{3-6} que puede estar sustituido, haloalquilo C_{1-4} , ciano, alqueno C_{2-4} , alquino C_{2-4} , alquil C_{1-4} -carbonilo o CH_2-R^7 ;

10 R^6 representa formilo, ciano, alquil C_{1-4} -carbonilo, alquiltio C_{1-4} -carbonilo, haloalquilcarbonilo C_{1-4} , haloalquiltiocarbonilo C_{1-4} , alquilamino C_{1-4} -carbonilo, alquilaminotiocarbonilo C_{1-4} , dialquilamino-carbonilo que tiene de 2 a 8 átomos de carbono, dialquilaminotiocarbonilo que tiene de 2 a 8 átomos de carbono, alcoxiamino C_{1-4} -carbonilo, alcoxiaminotio C_{1-4} -carbonilo, alcoxil C_{1-4} -carbonilo, alcoxilitio C_{1-4} -carbonilo, tioalcoxilcarbonilo C_{1-4} , tioalcoxilitio C_{1-4} -carbonilo, $CO-R^7$, $CS-R^7$, alquilsulfonilo C_{1-4} o haloalquilsulfonilo C_{1-4} ; o como alternativa

15 R^5 y R^6 , cuando se toman junto con el nitrógeno al que están unidos, forman un anillo de 3-6 miembros que contiene al menos un átomo de N y, opcionalmente, al menos otro heteroátomo seleccionado entre S y O, en el que el anillo está opcionalmente sustituido con ceto o tioceto;

Z que puede ser igual o diferente, representa halógeno, haloalquilo C_{1-4} , nitro, alquilo C_{1-4} , alcoxil C_{1-4} , ciano, haloalcoxil C_{1-4} , alquilsulfonilo C_{1-4} , haloalquilsulfonilo C_{1-4} , hidroxilo o mercapto;

20 k^1 representa 0, 1, 2 ó 3;

k^2 representa 0, 1 ó 2;

k^3 representa 0 ó 1;

k^4 representa 0 ó 1;

25 R^7 representa fenilo o un anillo heterocíclico, que están opcionalmente sustituidos con al menos un sustituyente seleccionado entre flúor, cloro, bromo y alquilo C_{1-4} ; y

En una realización de la invención, los compuestos de la fórmula (I) o la fórmula (Ia) con compuestos en los que

30 X que puede ser igual o diferente, representa cloro, flúor, bromo, trifluorometilo, difluorometilo, fluorometilo, nitro, metilo, etilo, propilo, i-propilo, butilo, t-butilo, 2-metil-propilo, metoxi, etoxi, propoxi, i-propoxi, n-butoxi, t-butoxi, 2-metil-propoxi, ciano, trifluorometoxi, difluorometoxi, fluorometoxi, tiometilo, tioetilo, tiopropilo, tio-i-propilo, tiobutilo, tio-t-butilo, 2-metil-tiopropilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, propilsulfonilo, i-propilsulfonilo, butilsulfonilo, t-butilsulfonilo, 2-metil-propilsulfonilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, propilsulfonilo, i-propilsulfonilo, butilsulfonilo, t-butilsulfonilo, 2-metil-propilsulfonilo, trifluorometiltio, trifluorometilsulfonilo, trifluorometilsulfonilo, hidroxilo, mercapto, amino, metilcarbonilamino, etilcarbonilamino, propilcarbonilamino, i-propilcarbonilamino, butilcarbonilamino, t-butilcarbonilamino, 2-metil-propilcarbonilamino, benzoilamino, metoxi-carbonilamino, etoxi-carbonilamino, propoxi-carbonilamino, i-propoxi-carbonilamino, butiloxi-carbonilamino, t-butiloxi-carbonilamino, 2-metil-propoxi-carbonilamino, trifluorometoxicarbonilamino, alquilsulfonilamino C_{1-4} o haloalquilsulfonilamino C_{1-4} ;

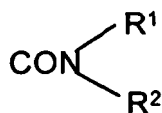
35 Y que puede ser igual o diferente, representa cloro, flúor, bromo, yodo, trifluorometilo, difluorometilo, fluorometilo, nitro, metilo, etilo, propilo, i-propilo, butilo, t-butilo, 2-metil-propilo, metoxi, etoxi, propoxi, i-propoxi, n-butoxi, t-butoxi, 2-metil-propoxi, ciano, trifluorometoxi, difluorometoxi, fluorometoxi, tiometilo, tioetilo, tiopropilo, tio-i-propilo, tiobutilo, tio-t-butilo, 2-metil-tiopropilo, metilsulfonilo, etilsulfonilo, propilsulfonilo, i-propilsulfonilo, butilsulfonilo, t-butilsulfonilo, 2-metil-propilsulfonilo, trifluorometiltio, trifluorometilsulfonilo, trifluorometilsulfonilo, hidroxilo, mercapto, amino, trifluorometil-carbonilamino, metilcarbonilamino, etilcarbonilamino, propilcarbonilamino, i-propilcarbonilamino, butilcarbonilamino, t-butilcarbonilamino, 2-metil-propilcarbonilamino, 2,2,2-tricloretilcarbonilamino, benzoilamino, metoxi-carbonilamino, etoxi-carbonilamino, propoxi-carbonilamino, i-propoxi-carbonilamino, butiloxi-carbonilamino, t-butiloxi-carbonilamino, 2-metil-propoxi-carbonilamino, tri-fluorometoxicarbonilamino, alquilsulfonilamino C_{1-4} o haloalquilsulfonilamino C_{1-4} ;

R representa metilo, etilo, propilo, i-propilo, butilo, t-butilo, 2-metil-propilo o trifluorometilo, difluorometilo, fluorometilo;

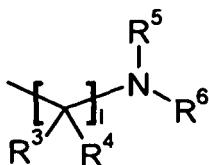
m representa 0, 1, 2 ó 3;

50 n representa 0, 1, 2 ó 3;

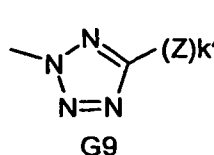
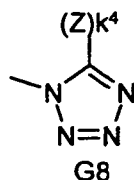
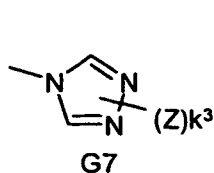
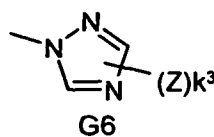
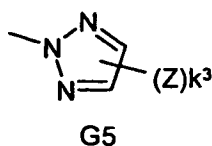
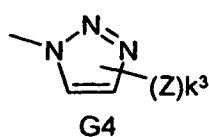
G representa:



o



o como alternativa representa los siguientes heterociclos de G1-G9:



5

cada R¹ y R² representa independientemente hidrógeno, alquilo C₁₋₄ que puede estar sustituido, alqueno C₂₋₄ que puede estar sustituido, alquino C₂₋₄ que puede estar sustituido, cicloalquilo C₃₋₆ que puede estar sustituido, alquilsulfonilo C₁₋₄, haloalquilsulfonilo C₁₋₄ o CH₂-R⁷; o cuando se toman juntos representan alqueno C₃₋₅;

10

cada R³ y R⁴ representa independientemente hidrógeno, ciano, alquilo C₁₋₄ que puede estar sustituido, alqueno C₂₋₄ que puede estar sustituido, alquino C₂₋₄ que puede estar sustituido, cicloalquilo C₃₋₆ que puede estar sustituido o alcoxi C₁₋₄-carbonilo; o cuando se toman juntos representan alqueno C₃₋₅;

l representa 1 ó 2;

R⁵ representa hidrógeno, alquilo C₁₋₄, cicloalquilo C₃₋₆ que puede estar sustituido, haloalquilo C₁₋₄, ciano, alqueno C₂₋₄, alquino C₂₋₄, alquil C₁₋₄-carbonilo o CH₂-R⁷;

15

R⁶ representa formilo, ciano, alquil C₁₋₄-carbonilo, alquiltio C₁₋₄-carbonilo, haloalquil C₁₋₄-carbonilo, haloalquiltio C₁₋₄-carbonilo, alquilamino C₁₋₄-carbonilo, alquilaminotio C₁₋₄-carbonilo, dialquilamino-carbonil que tiene de 2 a 6 átomos de carbono, dialquilaminotio-carbonilo que tiene de 2 a 6 átomos de carbono, alcoxiamino C₁₋₄-carbonilo, alcoxiaminotio C₁₋₄-carbonilo, alcoxi C₁₋₄-carbonilo, alcoxitio C₁₋₄-carbonilo, tialcoxi C₁₋₄-carbonilo, tialcoxitio C₁₋₄-carbonilo, CO-R⁷, CS-R⁷, alquilsulfonilo C₁₋₄ o haloalquilsulfonilo C₁₋₄; o como alternativa

20

Z que puede ser igual o diferente, representa cloro, bromo o yodo, trifluorometilo, nitro, metilo, etilo, propilo, i-propilo, butilo, t-butilo, 2-metil-propilo, ciano;

k³ representa 0 ó 1;

k⁴ representa 0 ó 1;

25

R⁷ representa fenilo que puede estar sustituido o un anillo heterocíclico seleccionado entre el grupo que consiste en piridilo, pirolidinilo, imidazolilo, triazolilo, oxadiazolilo, tetrazolilo, pirimidinilo y triazinilo que puede estar sustituido, en el que el sustituyente es al menos uno seleccionado entre cloro, bromo, yodo y metilo, etilo, i-propilo, n-propilo, 2-metil propilo, n-butilo y t-butilo; y

A representa C.

Los compuestos de la fórmula (I) de la fórmula (Ia) de la presente invención tienen carbonos asimétricos y por tanto incluyen isómeros ópticos.

Como se usa en la presente memoria, "alquilo" se refiere un alquilo C₁₋₁₂ lineal o ramificado, tal como metilo, etilo, n- o isopropilo, n-, iso-, sec- o terc-butilo, n-pentilo, n-hexilo, n-heptilo, n-octilo, n-nonilo, n-decilo, n-undecilo, n-dodecilo y similares, preferentemente se refiere a alquilo C₁₋₆.

Como se usa en la presente memoria, "haloalquilo" se refiere a grupos alquilo que tienen de 1 a 12 átomos de carbono, preferentemente de 1 a 6 o de 1 a 4 átomos de carbono en los que al menos un átomo de hidrógeno está sustituido por un halógeno. Son haloalquilos adecuados, por ejemplo CH₂F, CHF₂, CF₃, CF₂Cl, CFCI₂, CF₂Br, CF₂CF₃, CFHCF₃, CH₂CF₃, CFCICF₃, CCI₂CF₃, CF₂CH₃, CF₂CH₂F, CF₂CHF₂, CF₂CF₂Cl, CF₂CF₂Br, CFHCH₃, CFHCH₂F, CFHCHF₂, CHF₂CF₃, CHF₂CF₂Cl, CHF₂CF₂Br, CH₂CF₃, CFCICF₃, CCI₂CF₃, CF₂CF₂CF₃, CH₂CF₂CF₃, CF₂CH₂CF₃, CF₂CF₂CH₃, CHF₂CF₂CF₃, CF₂CHF₂CF₃, CF₂CF₂CHF₂, CF₂CF₂CH₂F, CF₂CF₂CF₂Cl, CF₂CF₂CF₂Br. El resto haloalquilo puede estar sustituido con al menos un sustituyente.

Como se usa en la presente memoria, "alcoxi" se refiere a grupos alcoxi que tienen de 1 a 12 átomos de carbono, preferentemente de 1 a 6 o de 1 a 4 átomos de carbono. Son grupos alcoxi adecuados, por ejemplo, metoxi, etoxi, n-propoxi, i-propoxi, n-, iso-, sec- o terc-butoxi, pentiloxi o hexiloxi. El resto alcoxi puede estar sustituido con al menos un sustituyente adecuado.

Cada resto alquilo en cada grupo que tiene alquilo como parte de su configuración puede ilustrarse adicionalmente por aquellos que se han descrito anteriormente para "alquilo".

"Acilamino" representa, por ejemplo, alquilcarbonilamino, ciclopropilcarbonilamino y benzoilamino, en los que el resto alquilo puede ilustrarse por aquellos que se han descrito anteriormente para "alquilo".

"Halógeno" y cada resto halógeno en cada grupo sustituido con halógeno se refiere a flúor, cloro, bromo y yodo, preferentemente se refiere a flúor, cloro o bromo.

"Cicloalquilo" se refiere un cicloalquilo C₃₋₈, tal como ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, cicloheptilo, ciclooctilo, preferentemente se refiere a cicloalquilo C₃₋₇.

"Alquenilo" se refiere a alquenilo C₂₋₅, tal como vinilo, alilo, 1-propenilo, 1- (ó 2- ó 3-) butenilo, 1-pentenilo, preferentemente se refiere a alquenilo C₂₋₄.

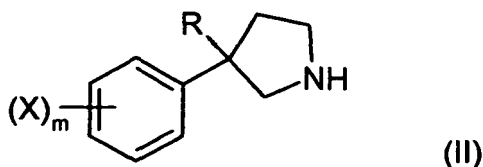
"Alquinilo" se refiere a alquinilo C₂₋₅, tal como etinilo, propargilo, 1-propinilo, butano-3-inilo, pentano-4-inilo y similares, preferentemente se refiere a alquinilo C₂₋₄.

Un "grupo heterocíclico" se refiere a un grupo heterocíclico de 5 ó 6 miembros que contiene al menos un heteroátomo seleccionado entre N, O o S, en el que dicho anillo también se refiere a un grupo heterocíclico condensado que puede estar benzo-condensado.

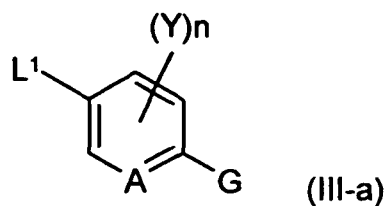
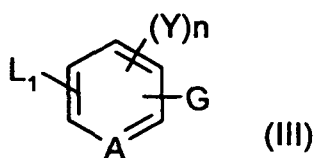
Son grupo heterocíclicos, por ejemplo furilo, tienilo, pirrolilo, isoxazolilo, pirazolilo, oxazolilo, oxatiazolilo, imidazolilo, triazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, tetrazolilo, piridilo, piroldinilo, pirimidinilo, piridazinilo, pirazinilo, triazinilo, indolilo, benzoxazolilo, quinolilo y similares.

Los compuestos de la fórmula (I) o de la fórmula (Ia) de la invención pueden obtenerse, por ejemplo, mediante los procedimientos de preparación (a) a (j) que se describen a continuación.

El procedimiento de preparación (a) comprende hacer reaccionar un compuesto de la fórmula (II)



en la que X, R y m tienen los mismos significados que se han definido en el presente documento, con un compuesto de fórmula (III) o de fórmula (III-a)



en las que

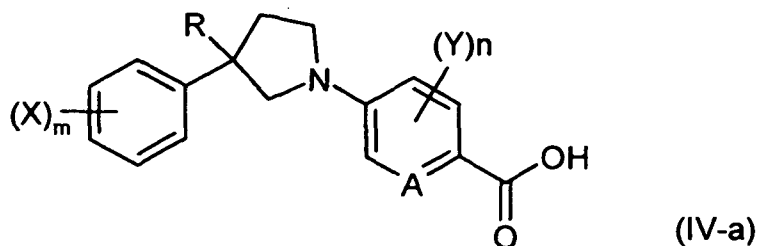
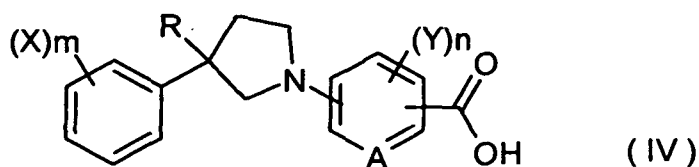
Y, A, G y n tienen los mismos significados que se han definido en el presente documento,

L¹ representa halógeno o un grupo haloalquilsulfoniloxi C₁-C₄.

- 5 En una realización del procedimiento de preparación (a), los compuestos de fórmula (II) y fórmula (III) o fórmula (III-a) se hacen reaccionar en presencia de una base o en presencia de al menos un catalizador metálico.

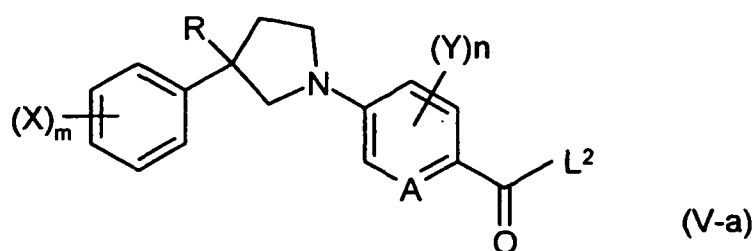
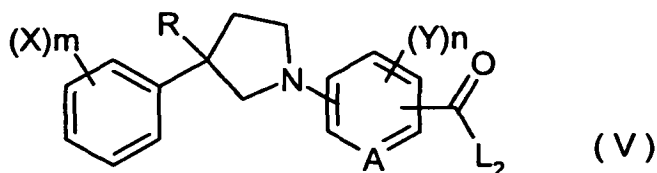
Procedimientos de preparación (b) y (c) para la preparación de compuestos de acuerdo con la fórmula (I) o fórmula (Ia), en las que G representa un grupo -CONR¹R²:

El procedimiento (b) comprende hacer reaccionar un compuesto representado por la fórmula (IV) o la fórmula (IV-a)



10

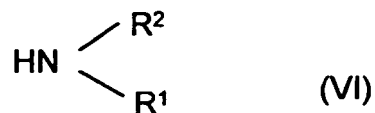
en las que X, Y, R, A, m y n tienen los mismos significados que se han definido en el presente documento, o un compuesto representado por la fórmula (V) o la fórmula (V-a)



15

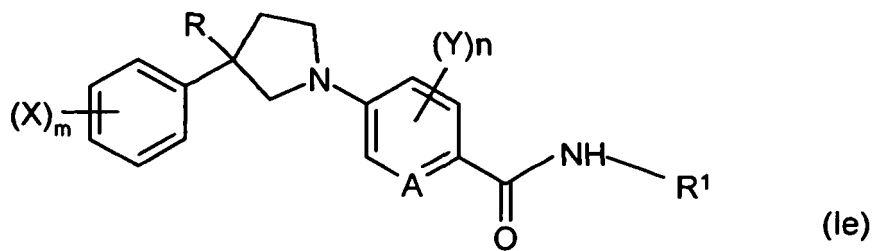
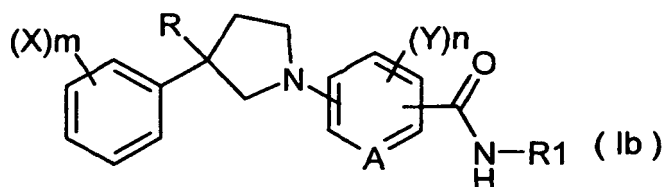
en las que X, Y, R, A, m y n tienen los mismos significados que se han definido en el presente documento y L² representa cloro, bromo, alquilcarboniloxi C₁₋₄, alcoxicarboniloxi C₁₋₄ o azolilo, con un compuesto representado por la

fórmula (VI):



en la que R^1 y R^2 tienen los mismos significados que se han definido en el presente documento, usando un agente de condensación, si se desea, en presencia de base.

- 5 El procedimiento (c) comprende hacer reaccionar un compuesto representado por la fórmula (Ib) o la fórmula (Ie):



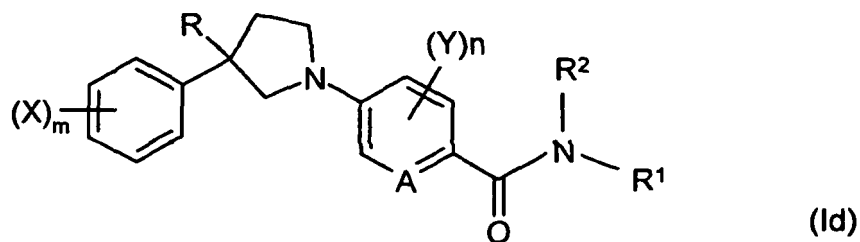
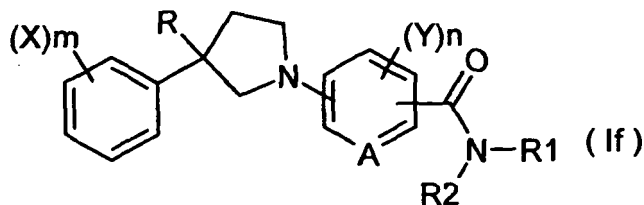
en las que X, Y, R, R^1 , A, m y n tienen los mismos significados que se han definido en el presente documento, con un compuesto representado por la fórmula



- 10 en la que R^2 tiene el mismo significado que se ha definido en el presente documento y L^3 representa cloro, bromo, yodo, alquilsulfoniloxi C_{1-4} , haloalquilsulfoniloxi C_{1-4} , arilsulfoniloxi o azolilo, si se desea, en presencia de base.

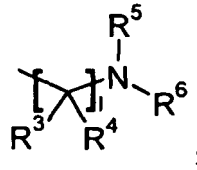
Procedimiento de preparación (d) para la preparación de compuestos de acuerdo con la fórmula (I) o la fórmula (Ia), en la que G representa un grupo $-\text{CSNR}^1\text{R}^2$:

El procedimiento (d) comprende hacer reaccionar un compuesto representado por la fórmula (If) o la fórmula (Id):



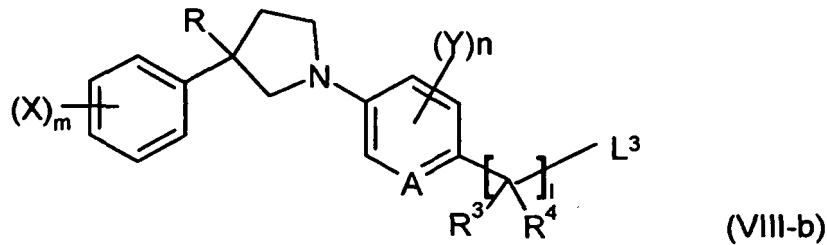
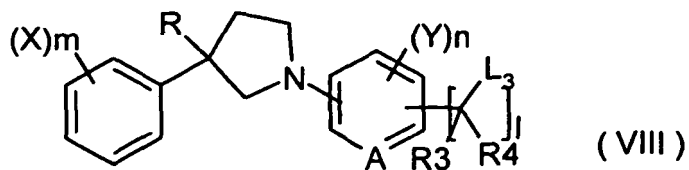
en las que X, Y, R, R¹, R², A, m y n tienen los mismos significados que se han definido en el presente documento, con agentes de sulfatación.

Procedimientos (e), (f) y (g) para la preparación de compuestos de acuerdo con fórmula (I) o la fórmula (Ia), en la que G representa



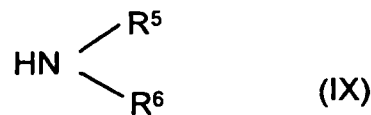
5

El procedimiento (e) comprende hacer reaccionar un compuesto representado por la fórmula (VIII) o la fórmula (VIII-b):



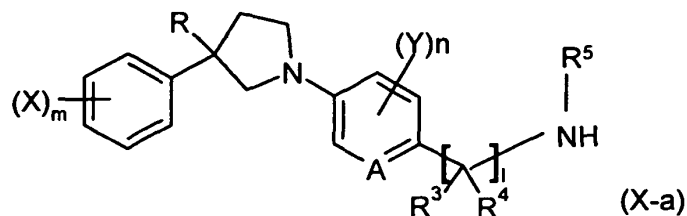
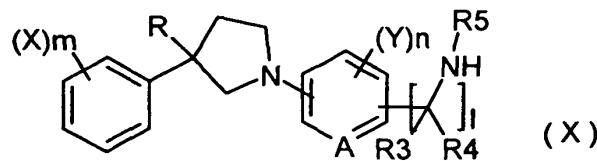
10

en las que X, Y, R, R³, R⁴, A, l, m, n y L³ tienen los mismos significados que se han definido en el presente documento, con un compuesto representado por la fórmula (IX):



en la que R⁵ y R⁶ tienen los mismos significados que se han definido en el presente documento, si se desea, en presencia de base.

El procedimiento (f) comprende hacer reaccionar un compuesto representado por la fórmula (X) o la fórmula (X-a):



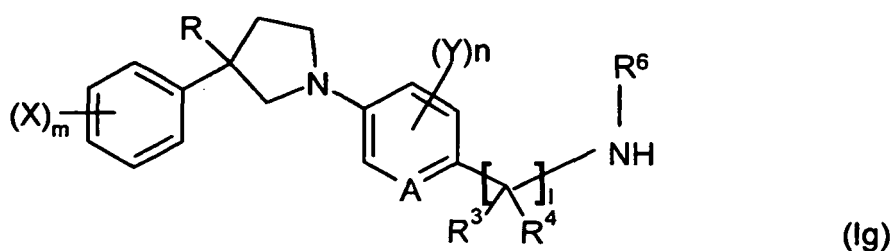
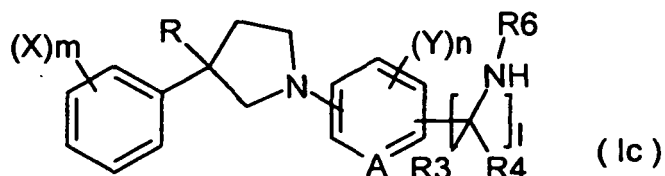
15

en las que X, Y, R, R³, R⁴, R⁵, A, l, m y n tiene los mismos significados que se han definido en el presente documento, con un compuesto representado por la fórmula :



- 5 en la que R⁶ tiene el mismo significado que se ha definido en el presente documento y L⁴ representa flúor, cloro, bromo, alquil C₁₋₄-carboniloxi, alcoxi C₁₋₄-carboniloxi, azolilo, alquilsulfoniloxi C₁₋₄, haloalquilsulfoniloxi C₁₋₄, arilsulfoniloxi, si se desea, en presencia de base.

El procedimiento (g) comprende hacer reaccionar un compuesto representado por la fórmula (Ic) o la fórmula (Ilg):



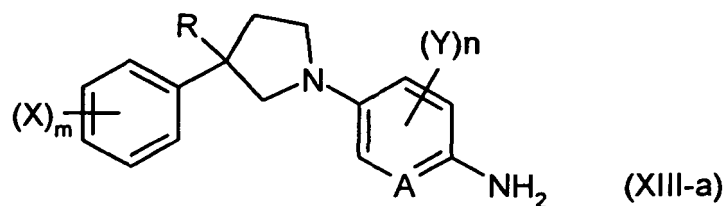
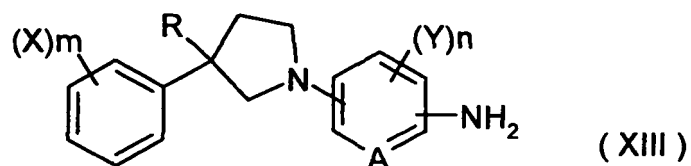
- 10 en las que X, Y, R, R³, R⁴, R⁶, A, l, m y n tienen los mismos significados que se han definido en el presente documento, con un compuesto representado por la fórmula



en la que R⁵ y L⁴ tienen los mismos significados que se han definido en el presente documento, si se desea, en presencia de base.

- 15 Procedimiento de preparación (h) para la preparación de compuestos de acuerdo con fórmula (I) o la fórmula (Ia), en la que G representa G1, G6 o G8:

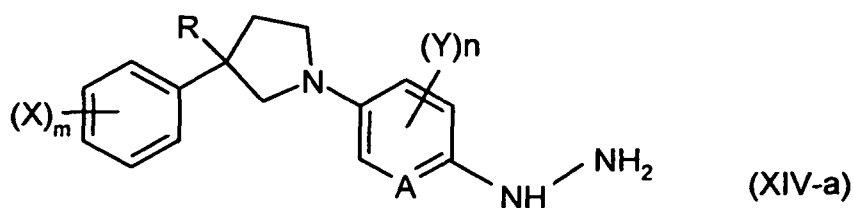
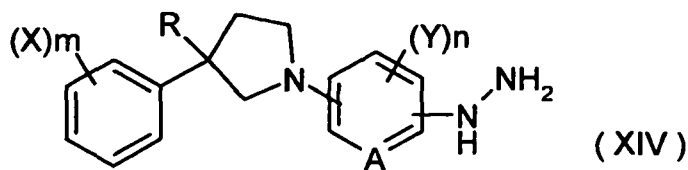
El procedimiento (h) comprende hacer reaccionar un compuesto representado por la fórmula (XIII) o la fórmula (XIII-a):



- 20 en las que X, Y, A, m y n tienen los mismos significados que se han definido en el presente documento, con dialcoxitetrahydrofurano, 1,2-diformil-hidrazina o azida sódica y ortoformiato de trialquilo.

Procedimiento de preparación (i) para la preparación de compuestos de acuerdo con fórmula (I) o la fórmula (Ia), en la que G representa G2:

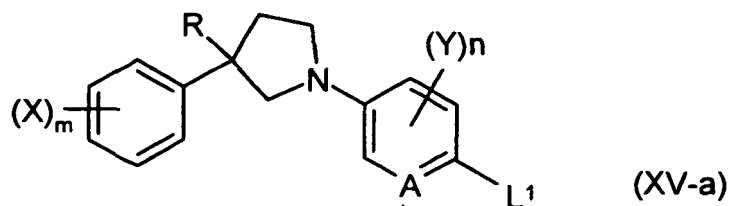
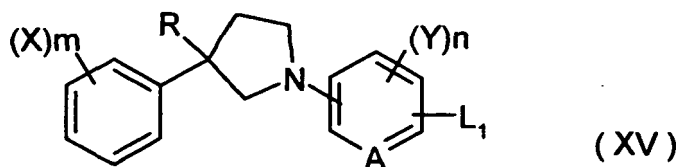
El procedimiento (i) comprende hacer reaccionar un compuesto representado por la fórmula (XIV) o la fórmula (XIV-a):



5 en las que X, Y, A, m y n tienen los mismos significados que se han definido en el presente documento, con 1,1,3,3-tetra-alcoxipropano.

Procedimiento de preparación (j) para la preparación de compuestos de acuerdo con fórmula (I) o la fórmula (Ia), en las que G representa G2, G3, G4, G5, G6, G8 o G9:

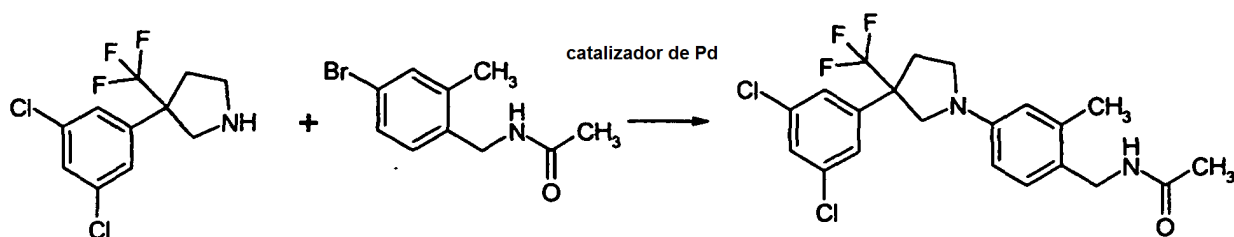
10 El procedimiento (j) comprende hacer reaccionar un compuesto representado por la fórmula (XV) o la fórmula (XV-a):



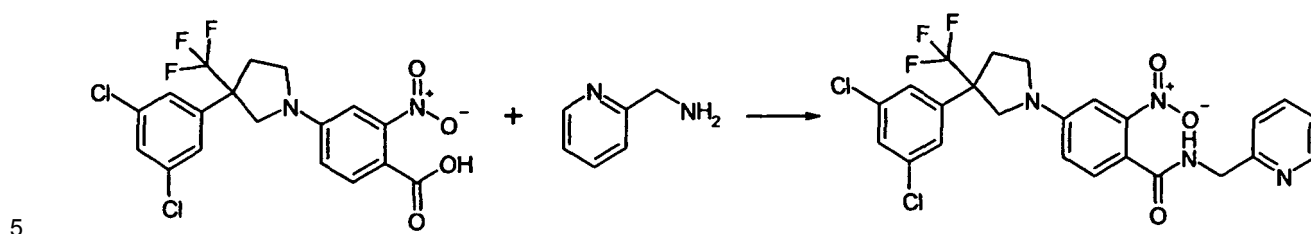
en las que X, Y, R, A, m, n y L¹ tienen los mismos significados que se han definido en el presente documento, con los grupos protonados denominados G2, G3, G4, G5, G6, G8 o G9, particularmente G2-H, G3-H, G4-H, G5-H, G6-H o G8-H.

15 De acuerdo con la presente invención, las aril pirrolidinas de la fórmula (I) o la fórmula (Ia) anteriores de la invención muestran una acción insecticida potente.

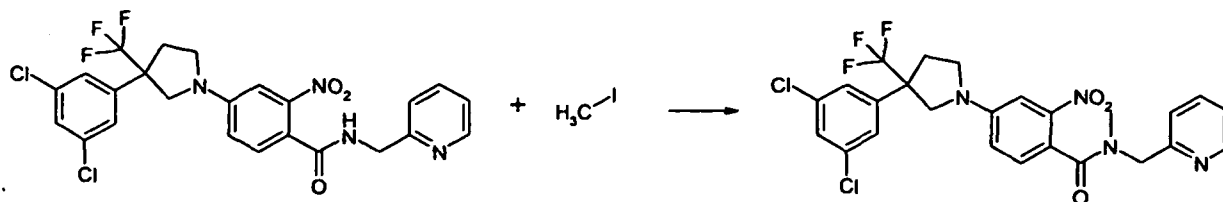
El procedimiento de preparación (a) mencionado anteriormente, cuando se usan, por ejemplo, 3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidina y N-(4-bromo-2-metilbencil)acetamida como materiales de partida, puede representarse mediante la fórmula de reacción siguiente.



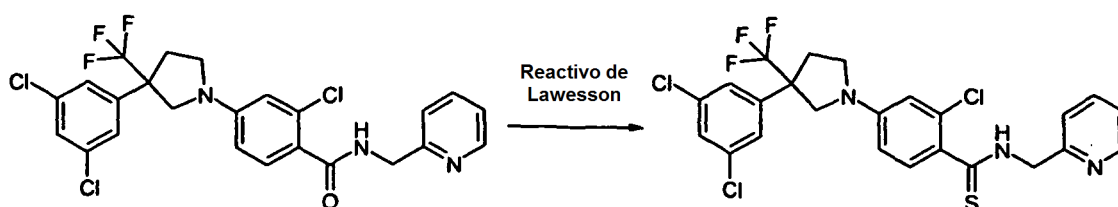
El procedimiento de preparación (b), cuando se usan, por ejemplo, ácido 4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidin-1-il]-2-nitrobenzoico y 2-picolilamina como materiales de partida, puede representarse mediante la fórmula de reacción siguiente.



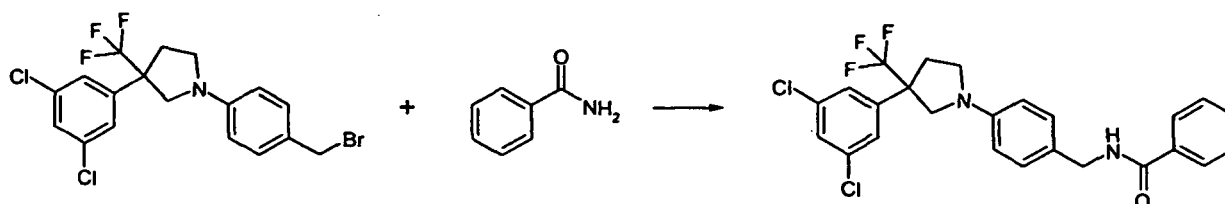
El procedimiento de preparación (c), cuando se usan, por ejemplo, 4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidin-1-il]-2-nitro-N-(piridina-2-il-metil)benzamida y yodometano como materiales de partida, puede representarse mediante la fórmula de reacción siguiente.



10 El procedimiento de preparación (d), cuando se usan, por ejemplo, 2-cloro-4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidin-1-il]-N-(piridina-2-il-metil)benzamida y reactivo de Lawesson como materiales de partida, puede representarse mediante la fórmula de reacción siguiente.

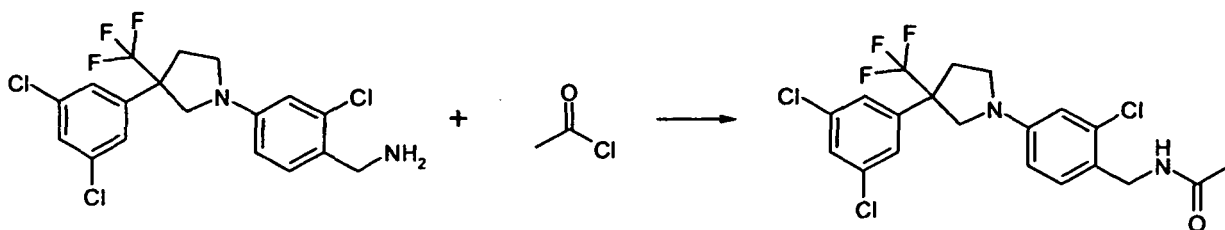


15 El procedimiento de preparación (e), cuando se usan, por ejemplo, 1-[4-(bromometil)fenil]-3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidina y benzamida como materiales de partida, puede representarse mediante la fórmula de reacción siguiente.

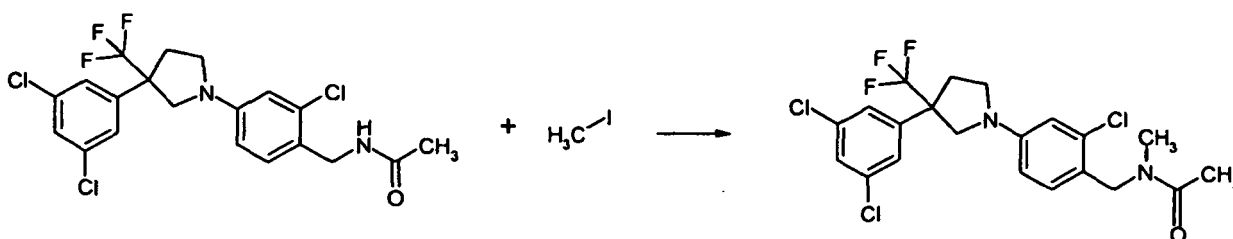


El procedimiento de preparación (f), cuando se usan, por ejemplo, 1-[2-cloro-4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidin-1-il]fenil]metanamina y cloruro de acetilo como materiales de partida, puede representarse

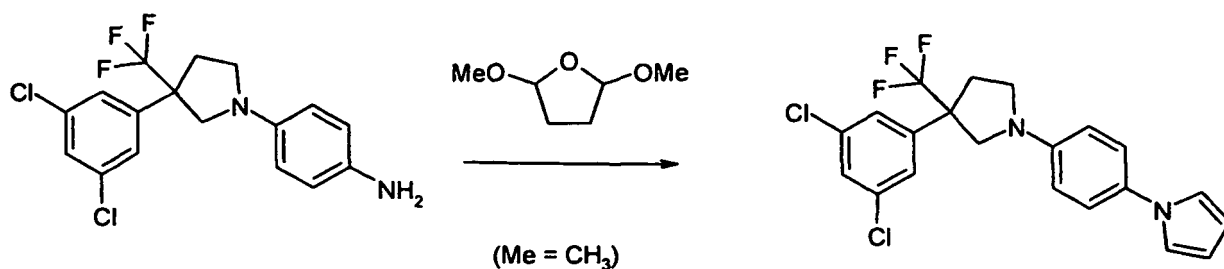
mediante la fórmula de reacción siguiente.



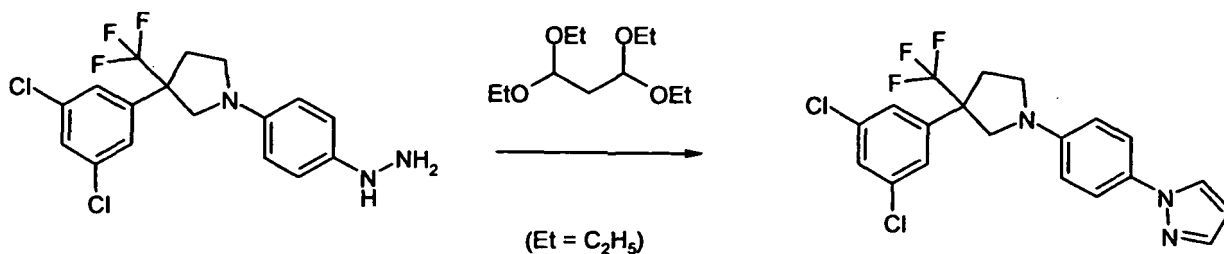
5 El procedimiento de preparación (g), cuando se usan, por ejemplo, N-{2-cloro-4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidin-1-il]bencil}acetamida y yodometano como materiales de partida, puede representarse mediante la fórmula de reacción siguiente.



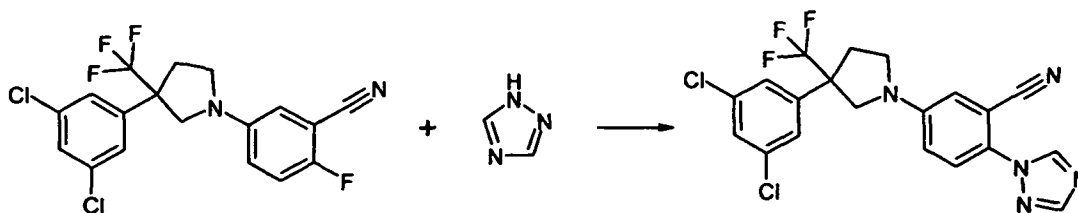
El procedimiento de preparación (h), cuando se usan, por ejemplo, 4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidin-1-il]anilina y 2,5-dimetoxitetrahidrofurano como materiales de partida, puede representarse mediante la fórmula de reacción siguiente.



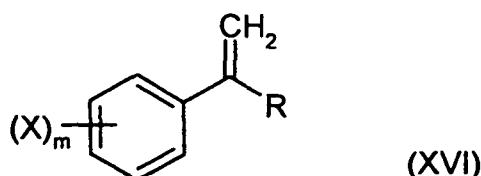
10 El procedimiento de preparación (i), cuando se usan, por ejemplo, 3-(3,5-diclorofenil)-1-(4-hidrazinofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidina y 1,1,3,3-tetraetoxipropano como materiales de partida, puede representarse mediante la fórmula de reacción siguiente.



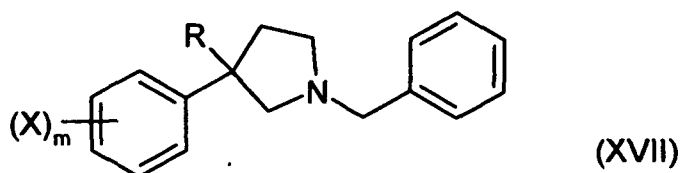
15 El procedimiento de preparación (j), cuando se usan, por ejemplo, 5-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidin-1-il]-2-fluorobenzonitrilo y 1H-1,2,4-triazol como materiales de partida, puede representarse mediante la fórmula de reacción siguiente.



Muchos de los compuestos de la fórmula (II), que son materiales de partida en el procedimiento de preparación (a), son compuestos nuevos y pueden sintetizarse mediante el procedimiento que se describe a continuación. El compuesto representado por la fórmula (XVI):



5 en la que X, m y R tienen los mismos significados que se han definido en el presente documento se hace reaccionar con, por ejemplo, N-bencil-1-metoxi-N-[(trimetilsilil)metil]metanamina en presencia de catalizadores para obtener el compuesto representado por la fórmula (XVII) siguiente:



10 en la que X, m y R tienen los mismos significados que se han definido en el presente documento, que después se desbencila para obtener el compuesto de la fórmula (II).

Se describen compuestos conocidos que tienen la fórmula (XVI), por ejemplo, en "The Journal of Organic Chemistry, 1991, vol.56, pp.7336-7340"; "The Journal of Organic Chemistry, 1994, vol.59, pp.2898-2901"; "Journal of Fluorine Chemistry, 1999, vol.95, pp.167-170"; "WO2005/05085216A". Dichos compuestos también pueden sintetizarse mediante los procedimientos descritos en estas publicaciones.

15 Los ejemplos representativos de los compuestos de la fórmula (XVI) incluyen [1-(trifluorometil)vinil]benceno; 1-cloro-3-[1-(trifluorometil)vinil]benceno; 1-bromo-3-[1-(trifluorometil)vinil]benceno; 1-nitro-3-[1-(trifluorometil)vinil]benceno; 1-trifluorometil-3-[1-(trifluorometil)vinil]benceno; 1,3-difluoro-5-[1-(trifluorometil)vinil]benceno; 1,3-dicloro-5-[1-(trifluorometil)vinil]benceno; 1,3-difluoro-5-[1-(trifluorometil)vinil]benceno; 1-fluoro-2-(trifluorometil)-4-[1-(trifluorometil)vinil]benceno; 1,2,3-tricloro-5-[1-(trifluorometil)vinil]benceno; o 1,3-dimetil-2-nitro-5-[1-(trifluorometil)vinil]benceno.

20 En lugar de N-bencil-1-metoxi-N-[(trimetilsilil)metil] metanamina en la reacción interior, puede usarse N-bencil-1-butoxi-N-[(trimetilsilil)metil]metanamina o N-(butoximetil)-N-[(trimetilsilil)metil]ciclohexilamina. Estos son compuestos bien conocidos.

25 Los catalizadores usados en la reacción anterior pueden incluir ácido trifluoroacético, trifluorometansulfonato de trimetilsililo, yodotrimetilsilano, fluoruro de cesio y similares.

La reacción anterior puede realizarse de acuerdo con los procedimientos descritos en "Chemistry Letters, 1984, 1117-1120" y "Tetrahedron Letters, 1993,34,3279-3282", y puede realizarse la reacción de desprotección, tal como desbencilación de acuerdo con los procedimientos descritos en "Journal of the Organic Chemistry, 1984,49,2081" y "PROTECTIVE GRUPS in ORGANIC CHEMISTRY, TERCERA EDICIÓN, JOHN WILEY & SONS, INC".

30 Los ejemplos representativos de los compuestos de la fórmula (II) en el procedimiento de preparación (a) incluyen: 3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidina; 3-[3,5-bis(trifluorometil)fenil]-3-(trifluorometil)pirrolidina; 3-(3,4,5-triclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidina; 3-(3,5-dimetil-4-nitrofenil)-3-(trifluorometil) pirrolidina.

Muchos de los compuestos de la fórmula (III) o la fórmula (III-a), que son materiales de partida en el procedimiento de preparación (a), son compuestos conocidos, que pueden sintetizarse mediante los procedimientos bien conocidos en química orgánica.

5 Los ejemplos representativos de los compuestos de la fórmula (III) y fórmula (III-a), respectivamente, incluyen: N-(4-bromobencil)acetamida, N-(4-yodobencil)acetamida.

10 La reacción de los procedimientos de preparación (a), (b), (c), (d), (e), (f), (g), (h), (i) y (j) puede realizarse en un diluyente adecuado, tal como hidrocarburos alifáticos (por ejemplo, hexano, ciclohexano, heptano, etc.), hidrocarburos halogenados alifáticos (por ejemplo, diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, dicloroetano), hidrocarburos aromáticos (por ejemplo, benceno, tolueno, xileno, clorobenceno, etc.), éteres (por ejemplo, éter dietílico, éter dibutílico, dimetoxietano (DME), tetrahidrofurano, dioxano etc.), ésteres (por ejemplo, acetato de etilo, propionato de etilo, etc.), amidas (por ejemplo, dimetilformamida (DMF), dimetilacetamida (DMA), N-metilpirrolidona etc.), nitrilos (por ejemplo, acetonitrilo, propionitrilo, etc.), dimetilsulfóxido (DMSO), agua o disolventes mixtos de los mismos.

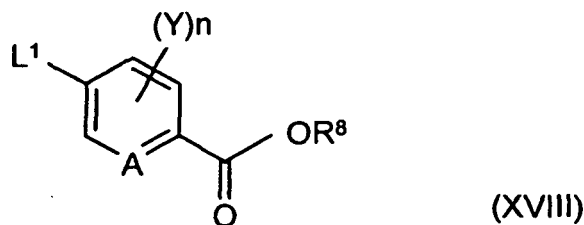
15 La reacción de los procedimientos de preparación(a), (b), (c), (d), (e), (f), (g), (h), (i) y (j) puede realizarse usando las siguientes bases, tales como bases de metal alcalino (por ejemplo, hidruro de litio, hidruro sódico, hidruro potásico, butillitio, terc-butillitio, trimetilsilillitio, hexametildisilazida de litio, carbonato sódico, carbonato potásico, carbonato de cesio, fosfato tripotásico, acetato sódico, acetato potásico, metóxido sódico, etóxido sódico, terc-butóxido sódico y terc-butóxido potásico, etc.), bases orgánicas (por ejemplo, trietilamina, diisopropiltilamina, tributilamina, N-metilmorfolina, N,N-dimetilanilina, N,N-dietilanilina, 4-terc-butil-N,N-dimetilanilina, piridina, picolina, lutidina, diazabicicoundeceno, diazabiciclooctano, imidazol, etc.).

20 los procedimientos de preparación (a), (b), (c), (d), (e), (f), (g), (h), (i) y (j) pueden realizarse dentro de un amplio intervalo de temperaturas. Generalmente, puede realizarse a una temperatura en el intervalo de aproximadamente -78 °C a aproximadamente 200 °C, preferentemente de aproximadamente -10 °C a aproximadamente 150 °C. Dicha reacción se realiza preferentemente a presión normal, aunque puede realizarse a presión elevada o a presión reducida. El tiempo de reacción es de 0,1 a 72 horas, preferentemente de 0,1 a 24 horas.

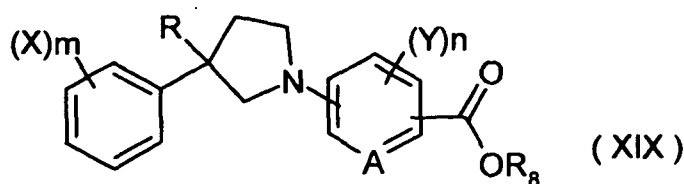
30 La reacción del procedimiento de preparación (a) también puede realizarse usando un catalizador metálico adecuado, tal como un catalizador de metal de transición, por ejemplo Pd₂(dba)₃, Pd₂(dba)₃CHCl₃ (dba=dibencilideno acetona), Pd(OAc)₂, CuI o Cu₂O. Si se desea, puede realizarse usando ligandos de fosfina, tales como 2,2'-bis(difenilfosfino)-1,1'-binaftaleno (BINAP), 4,5-bis(difenilfosfino)-9,9-dimetilxanteno (Xantphos), tributilfosfina y similares, o ligandos de amina, tales como 8-quinolinol, prolina, N,N-dimetilglicina y similares.

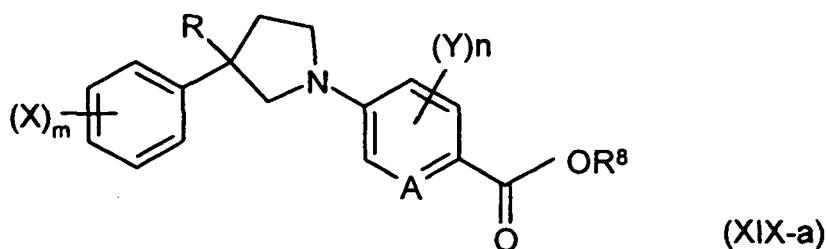
En la realización del procedimiento de preparación (a), por ejemplo, 1 mol del compuesto de la fórmula (II) se hace reaccionar con 1 a 3 moles del compuesto de la fórmula (III) o la fórmula (III-a) en presencia de 1 a 3 moles de base y una cantidad catalítica de Pd₂(dba)₃CHCl₃ y Xantphos en un diluyente, tal como tolueno para obtener el compuesto respectivo de la fórmula (I) o de la fórmula (Ia) de la invención.

35 Los compuestos de la fórmula (IV) o la fórmula (IV-a), que se usan en el procedimiento de preparación (b), con compuestos nuevos. Pueden sintetizarse por los procedimientos que se describen a continuación. El compuesto de fórmula (II) puede hacerse reaccionar con un compuesto representado por la fórmula (XVIII):



40 en la que Y, A, n y L¹ tienen los mismos significados que se han definido en el presente documento, R⁸ representa hidrógeno o alquilo C₁₋₄, para obtener un compuesto representado por la fórmula (XIX) o la fórmula (XIX-a):





en las que X, Y, R, A, m, n y R⁸ tienen los mismos significados que se han descrito en el presente documento. Cuando R⁸ representa alquilo C₁₋₄, el compuesto de la fórmula anterior (XIX) o la fórmula (XIX-a) puede hidrolizarse para dar el compuesto de la fórmula (IV) o la fórmula (IV-a).

- 5 Los compuestos de la fórmula (XVIII) son conocidos e incluyen, por ejemplo, los siguientes compuestos: 4-yodobenzoato de metilo; 4-bromo-2-metilbenzoato de metilo; 2-fluoro-4-yodobenzoato de etilo; 2-cloro-4-yodobenzoato de metilo; 2-bromo-4-yodobenzoato de metilo; 4-fluoro-2-nitrobenzoato de metilo; y 4-fluoro-2-(trifluorometil)benzoato de etilo.

- 10 Los compuestos de la fórmula (V) o de la fórmula (V-a), que son materiales de partida en el procedimiento de preparación (b), con compuestos bien conocidos.

Por ejemplo, el compuesto de fórmula (IV) o de fórmula (IV-a) puede obtenerse fácilmente mediante el procedimiento que comprende una reacción con un agente de cloración, tal como cloruro de tionilo, cloruro de oxalilo o pentacloruro de fósforo, o el procedimiento que comprende una reacción con un haluro orgánico, tal como cloruro de pivaloilo, el procedimiento que comprende una reacción con carbonil diimidazol o sulfonil imidazol, etc.

- 15 Los compuestos representativos de la fórmula (IV) y fórmula (IV-a), respectivamente, en el procedimiento de preparación (b) incluyen:

ácido 4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidin-1-il]benzoico; ácido 4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidin-1-il]-2-nitrobenzoico; ácido 4-[3-[3,5-bis(trifluorometil)fenil]-3-(trifluorometil)pirrolidin-1-il]-2-nitrobenzoico; ácido 4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidin-1-il]-2-(trifluorometil)benzoico y similares.

- 20 Los compuestos representativos de la fórmula (V) y fórmula (V-a), respectivamente, incluyen: cloruro de 4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidin-1-il]benzoilo; cloruro de 4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidin-1-il]-2-nitrobenzoilo; cloruro de 4-[3-[3,5-bis(trifluorometil)fenil]-3-(trifluorometil)pirrolidin-1-il]-2-nitrobenzoilo y similares.

- 25 Los compuestos de la fórmula (VI), que son materiales de partida en el procedimiento de preparación (b), son compuestos bien conocidos.

Los ejemplos representativos incluyen: metilamina; etilamina, ciclopropilamina, propargilamina, 2,2,2-trifluoroetilamina, 2-picolilamina, 3-aminometil-6-cloropiridina y similares.

- 30 La reacción del procedimiento de preparación (b) puede realizarse usando lo siguiente agentes de condensación: 1,3-diciclohexil carbodiimida (DCC), clorhidrato de 1-etil-3-(3'-dimetilaminopropil)-carbodiimida (WSCl), carbonildiimidazol (CDI), cianofosfato de dietilo (DEPC), yoduro de 2-cloro-1-metilpiridinium (Reactivo de Mukoyama) y similares.

- 35 En la realización del procedimiento de preparación (b), por ejemplo, 1 mol del compuesto de la fórmula (IV) o de la fórmula (IV-a) puede hacerse reaccionar con 1 a 3 moles del compuesto de la fórmula (VI) usando de 1 mol a 3 moles de un agente de condensación y, si se desea, con una cantidad catalítica de un aditivo, al como 1-hidroxibenzotriazol en un diluyente (por ejemplo, DMF) para obtener el compuesto correspondiente de la fórmula (I) de la fórmula (Ia).

Los compuestos de la fórmula (Ib) o la fórmula (Ie), que son los materiales de partida en el procedimiento de preparación (c), se incluyen en la fórmula (I) o la fórmula (Ia) de la presente invención obtenidas por el procedimiento de preparación (b).

- 40 Los compuestos de la fórmula (VII), que son los materiales de partida, son compuestos bien conocidos y los ejemplos específicos incluyen yodometano, yodoetano y similares.

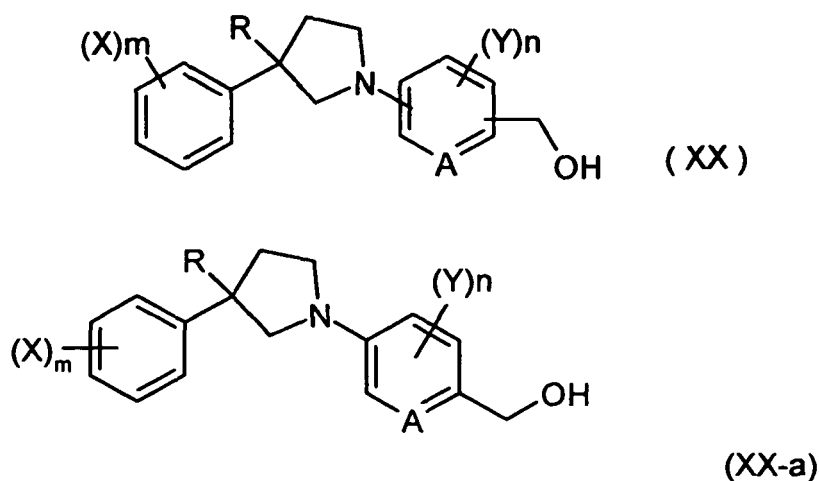
En la realización del procedimiento de preparación (c), por ejemplo, 1 mol del compuesto de la fórmula (Ib) o la fórmula (Ie) puede hacerse reaccionar con 1 a 5 moles del compuesto de la fórmula (VII) en presencia de base en un diluyente (por ejemplo, THF) para obtener el compuesto correspondiente de la fórmula (I) o de la fórmula (Ia).

Los compuestos de la fórmula (If) o la fórmula (Id), que son materiales de partida en el procedimiento de preparación (d), se incluyen en la en la fórmula (I) o la fórmula (Ia) de la presente invención obtenida por el procedimiento de preparación (b) o (c).

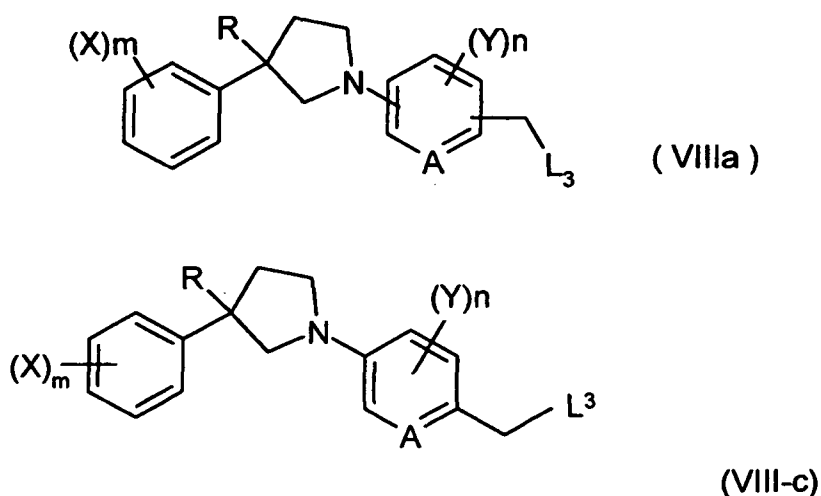
5 Los agentes de sulfurización que se usan en el procedimiento de preparación (d) pueden incluir pentasulfuro de fósforo, reactivo de Lawesson y similares.

En la realización del procedimiento de preparación (d), por ejemplo, 1 mol del compuesto de fórmula general (If) o fórmula (Id) puede hacerse reaccionar con 0,5 a 3 moles de reactivo de Lawesson en un diluyente (por ejemplo, tolueno) para obtener el compuesto correspondiente de la fórmula (I) o de la fórmula (Ia).

10 Los compuestos de la fórmula (VIII) o la fórmula (VIII-b), que son materiales de partida en el procedimiento de preparación (e), son compuestos nuevos y puede sintetizarse por el procedimiento siguiente. El compuesto de la fórmula anterior (XIX) o la fórmula (XIX-a) puede reducirse para obtener el compuesto representado por la fórmula (XX) o la fórmula (XX-a):



15 en las que X, Y, R, A, m y n tienen los mismos significados que se han definido en el presente documento, que después pueden someterse a una reacción, tal como halogenación o alquilsulfonilación de la manera habitual para obtener el compuesto representado por la fórmula (VIII-a) o (VIII-c):



en las que X, Y, R, A, m, n y L³ tienen las mismas definiciones de antes.

20 Los ejemplos representativos de los compuestos de la fórmula (VIII) y fórmula (VIII-b), respectivamente, en el procedimiento de preparación (e) incluyen: 1-[3-cloro-4-(clorometil)fenil]-3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidina; metansulfonato de 4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidin-1-il]bencilo; 1-[3-bromo-4-(clorometil)fenil]-3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidina y similares.

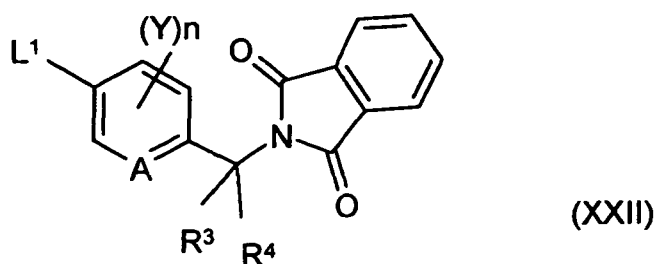
Los compuestos de la fórmula (IX), que son materiales de partida en el procedimiento de preparación (e), son compuestos bien conocidos y los ejemplos representativos incluyen: acetoamida; propionamida; benzamida; 2-

clorobenzamida; 3-clorobenzamida; 4-clorobenzamida y similares.

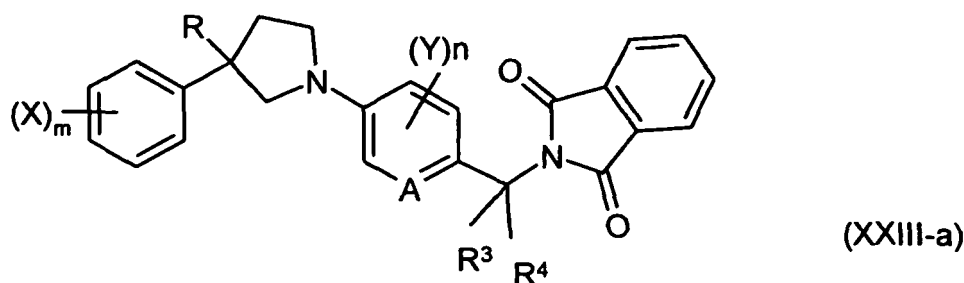
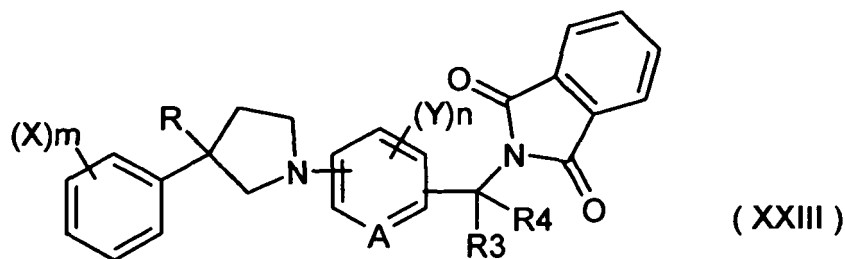
En la realización del procedimiento de preparación (e), por ejemplo, 1 mol del compuesto de la fórmula (VIII) o la fórmula (VIII-b) puede hacerse reaccionar con 1 a 3 moles de la fórmula (IX) en presencia de base, en un diluyente (por ejemplo, THF) para obtener el compuesto correspondiente de la fórmula (I) de la fórmula (Ia).

5 Los compuestos de la fórmula (X), o fórmula (X-a) que son los materiales de partida en el procedimiento de preparación (f), son compuestos nuevos y pueden obtenerse haciendo reaccionar un compuesto de fórmula (VIII) o fórmula (VIII-b) con un compuesto R^5-NH_2 (XXI) en el que R^5 tiene el mismo significado que se ha definido en el presente documento.

10 Los compuestos de la fórmula (X) o la fórmula (X-a), en los que l es 1 también pueden sintetizarse mediante el procedimiento alternativo que comprende hacer reaccionar un compuesto de la fórmula (II) anterior con un compuesto representado por la fórmula (XXII):



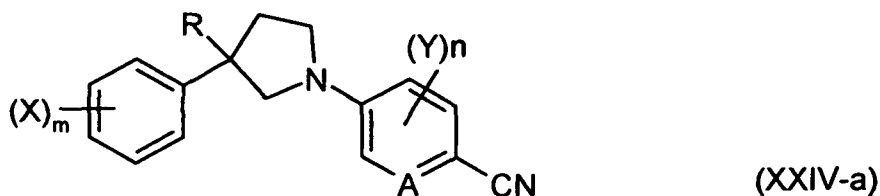
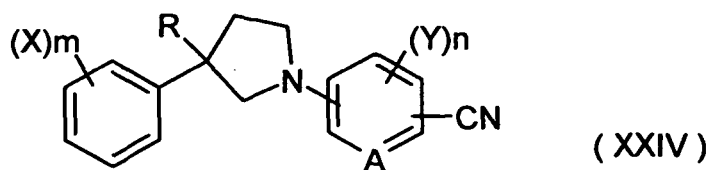
en la que Y, A, R^3 , R^4 , n y L^1 tienen los mismos significados que se han definido en el presente documento, para obtener el compuesto representado por la fórmula (XXIII) o la fórmula (XXIII-a):



15 en las que X, Y, R, A, m, n, R^3 y R^4 tienen los mismos significados que se han definido en el presente documento, que después se hace reaccionar de acuerdo con una reacción de síntesis de Gabriel.

20 Los compuestos de la fórmula (XXII) anterior son compuestos conocidos e incluyen: 2-(4-bromobencil)-1H-isoindolo-1,3(2H)-diona; 2-(4-bromo-2-nitrobencil)-1H-isoindolo-1,3(2H)-diona; 2-(4-yodobencil)-1H-isoindolo-1,3(2H)-diona; 2-(4-yodo-2-nitrobencil)-1H-isoindolo-1,3(2H)-diona; 2-(2-cloro-4-yodobencil)-1H-isoindolo-1,3(2H)-diona.

Los compuestos de la fórmula (X) o la fórmula (X-a), en los que R^3 , R^4 y R^5 representan hidrógeno pueden sintetizarse mediante el procedimiento alternativo que comprende una reacción de reducción habitual del compuesto de nitrilo representado por la fórmula (XXIV) o la fórmula (XXIV-a):



en las que X, Y, R, m y n tienen los mismos significados que se han descrito en el presente documento.

5 Los compuestos de la fórmula anterior (XXIV) o la fórmula (XXIV-a) son compuestos nuevos y pueden obtenerse como se muestra en el ejemplo sintético 8 que se describe más adelante.

Los ejemplos representativos de los compuestos de la fórmula (X) y fórmula (X-a), respectivamente, en el procedimiento de preparación (f) incluyen: 1-{2-cloro-4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidin-1-il]fenil}metanamina; 1-{2-bromo-4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidin-1-il]fenil}metanamina y similares.

10 Los compuestos de la fórmula (XI), que son materiales de partida en el procedimiento de preparación (f), son compuestos bien conocidos, y los ejemplos específicos incluyen: cloruro de acetilo; cloruro de propionilo; cloruro de benzoilo; cloruro de 2-clorobenzoilo; cloruro de 3-clorobenzoilo; cloruro de 4-clorobenzoilo; cloruro de nicotinoilo clorhidrato y similares.

15 En la realización del procedimiento de preparación (f), por ejemplo, 1 mol del compuesto de la fórmula (X) fórmula (X-a) puede hacerse reaccionar con 1 a 3 moles de la fórmula (XI) en presencia de una base en un diluyente (por ejemplo, THF) para obtener el compuesto correspondiente de la fórmula (I) de la fórmula (Ia).

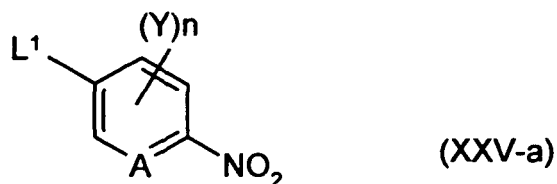
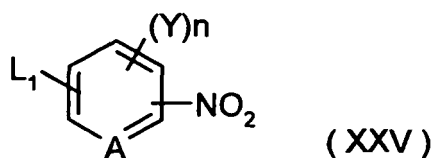
Los compuestos de la fórmula (Ic) o la fórmula (Ig), que son materiales de partida en el procedimiento de preparación (g), se incluyen en la fórmula (I) o la fórmula (Ia) de la presente invención obtenidos por el procedimiento de preparación (e) o (f) anterior.

20 Los compuestos de la fórmula (XII), que son los materiales de partida son bien conocidos y los ejemplos específicos incluyen yodometano, yodoetano, cloruro de acetilo y similares.

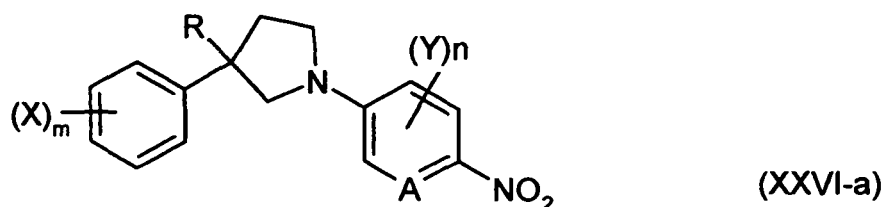
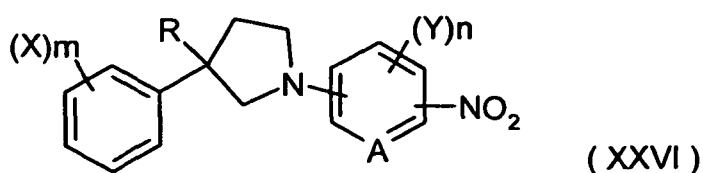
En la realización del procedimiento de preparación (g), por ejemplo, 1 mol del compuesto de la fórmula (Ic) o la fórmula (Ig) puede hacerse reaccionar con 1 a 3 moles de la fórmula (XII) en presencia de una base en un diluyente (por ejemplo, THF) para obtener el compuesto correspondiente de la fórmula (I) de la fórmula (Ia).

25 Los compuestos de la fórmula (XIII) o la fórmula (XIII-a), que son materiales de partida en el procedimiento de preparación (h), son compuestos nuevos y pueden sintetizarse mediante el procedimiento que se describe a continuación.

Más específicamente, el compuesto de la fórmula anterior (II) se hace reaccionar con un compuesto representado por la fórmula (XXV) o la fórmula (XXV-a):



en las que Y, A, n y L¹ tienen los mismos significados que se han definido en el presente documento, para obtener un compuesto representado por la fórmula (XXVI) o la fórmula (XXVI-a):



5

en las que X, Y, R, A, m y n tienen los mismos significados que se han definido en el presente documento, que después se reduce para obtener el compuesto de la fórmula (XIII) o la fórmula (XIII-a).

Los ejemplos específicos de los compuestos de fórmula (XXV) y fórmula (XXV-a) incluyen: 2-fluoro-4-nitrobenzoceno; 2-bromo-4-nitrobenzoceno; 2-yodo-4-nitrobenzoceno; 2-bromo-4-fluoronitrobenzoceno; 4-fluoro-2-metilitrobenzoceno y similares.

Los ejemplos representativos de los compuestos de la fórmula (XIII) y fórmula (XIII-a), respectivamente, en el procedimiento de preparación (h) incluyen: 4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidin-1-il]anilina; 2-bromo-4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidin-1-il]anilina y similares.

Los dialcoxi tetrahidrofuranos, que son materiales de partida en el procedimiento de preparación (h), son compuestos conocidos y los ejemplos específicos incluyen: 2,5-dimetoxitetrahidrofurano; 2,5-dietoxitetrahidrofurano y similares.

En la realización del procedimiento de preparación anterior (h), por ejemplo, 1 mol del compuesto de la fórmula (XIII) o la fórmula (XIII-a) puede hacerse reaccionar con 1 a 5 moles de 2,5-dimetoxitetrahidrofurano en un diluyente (por ejemplo, ácido acético) para obtener el compuesto correspondiente de la fórmula (I) de la fórmula (Ia) de la presente invención.

En el procedimiento de preparación (h), dicha reacción, cuando se usa 1,2-diformilhidrazina, puede realizarse en presencia de una base y trialquilhalosilano.

Los ejemplos de la base pueden incluir bases orgánicas, tales como trietilamina, diisopropilamina, tributilamina, N-metilmorfolina, N,N-dimetilanilina, N,N-dietilanilina, 4-terc-butil-N,N-dimetilanilina, piridina, pi-colina, lutidina, diazabicicloundeceno, diazabiciclooctano, imidazol etc.

Los ejemplos representativos de trialquilhalosilanos incluyen: trimetilclorosilano; trietilclorosilano; trimetilbromosilano

y similares.

5 En la realización del procedimiento de preparación (h), 1 mol del compuesto de la fórmula (XIII) o fórmula (XIII-a) puede hacerse reaccionar con 1 a 5 moles de 1,2-difonylhidrazina, de 1 a 10 moles de base y de 1 a 25 moles de trialquilhalosilano en gran exceso de cantidad de piridina para obtener el compuesto correspondiente deseado de la fórmula (I) de la fórmula (Ia).

En el caso de la reacción de azida sódica con ortoformiato de trialquilo en el procedimiento de preparación (h), los ejemplos de ortoformiatos de trialquilo pueden incluir ortoformiato de trimetilo y ortoformiato de trietilo y similares.

10 En la realización del procedimiento de preparación (h), 1 mol del compuesto de la fórmula (XIII) o fórmula (XIII-a) puede hacerse reaccionar con 1 a 3 moles de azida sódica y de 1 a 10 moles de ortoformiato de trialquilo en un diluyente (por ejemplo, ácido acético) para obtener el compuesto correspondiente de la fórmula (I) de la fórmula (Ia) de la invención.

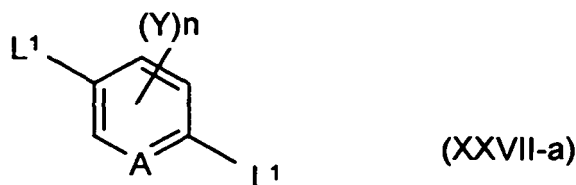
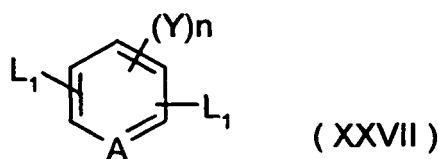
15 Los compuestos de la fórmula (XIV) o la fórmula (XIV-a), que son materiales de partida en el procedimiento de preparación (i), son compuestos nuevos y pueden sintetizarse mediante el procedimiento que se describe a continuación. Más específicamente, el compuesto de la fórmula anterior (XIII) o fórmula (XIII-a) se somete a una reacción de Sandmeyer, que se conoce en el campo de la química orgánica, seguido de reducción para obtener el compuesto de la fórmula (XIV) o la fórmula (XIV-a).

Los ejemplos representativos de los compuestos de la fórmula (XIV) y fórmula (XIV-a), pueden incluir respectivamente: 3-(3,5-diclorofenil)-1-(4-hidrazinofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidina; 3-(3,5-diclorofenil)-1-(4-hidrazino-3-metilfenil)-3-(tri-fluorometil)pirrolidina y similares.

20 Los 2,5-Dialcoxi tetrahidrofuranos, que se usan como material de partida en el procedimiento de preparación (i), son compuestos conocidos y los ejemplos representativos incluyen: 1,1,3,3-tetrametoxipropano; 1,1,3,3-tetraetoxipropano y similares.

25 En la realización del procedimiento de preparación anterior (i), por ejemplo, 1 mol del compuesto de la fórmula (XIV) o la fórmula (XIV-a) puede hacerse reaccionar con 1 a 5 moles de 1,1,3,3-tetraalcoxipropano con, si se desea, adición de una cantidad catalítica de ácido, tal como ácido sulfúrico en un diluyente (por ejemplo, etanol) para obtener el compuesto correspondiente de la fórmula (I) o de la fórmula (Ia) de la invención.

30 Los compuestos de la fórmula (XV) o fórmula (XV-a), que son el material de partida en el procedimiento de preparación (j), son compuestos nuevos y pueden sintetizarse mediante el procedimiento que se describe a continuación. Más específicamente, el compuesto de la fórmula anterior (II) se hace reaccionar con un compuesto representado por la fórmula (XXVII) o la fórmula (XXVII-a)



en las que Y, A, n y L¹ tienen los mismos significados que se han definido en el presente documento, para obtener el compuesto de la fórmula (XV) o la fórmula (XV-a).

35 Los ejemplos específicos de compuestos de la fórmula anterior (XXVII) y fórmula (XXVII-a), respectivamente, incluyen: 2-fluoro-5-yodobenzonitrilo; 5-bromo-2-fluorobenzonitrilo; 1-cloro-4-yodo-2-nitrobenceno; 1,4-dibromobenceno; 1,4-di- yodo benceno y similares.

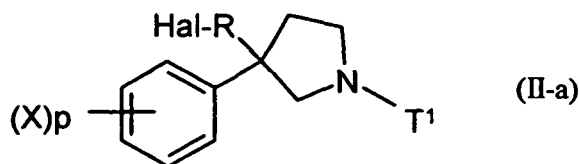
Los ejemplos representativos de los compuestos de la fórmula (XV) y fórmula (XV-a), respectivamente, en el procedimiento de preparación (j) pueden incluir: 5-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidin-1-il]-2-fluorobenzonitrilo; 5-[3-[3,5-bis(trifluorometil)fenil]-3-(trifluorometil)pirrolidin-1-il]-2-fluorobenzonitrilo y similares.

5 Muchos de los compuestos representados por la fórmula G2-H, G3-H, G4-H, G5-G, G6-H, G8-H, G9-H, que son materiales de partida en el procedimiento de preparación (j), son compuestos conocidos y los ejemplos específicos pueden incluir: 1H-imidazol; 1H-pirazol; 4-metil-1H-pirazol; 4-fluoro-1H-pirazol; 4-cloro-1H-pirazol; 4-bromo-1H-pirazol; 4-yodo-1H-pirazol; 4-nitro-1H-pirazol; 4-metil-1H-pirazol; 3-trifluorometil-1H-pirazol; 4-trifluorometil-1H-pirazol; 4-ciano-1H-pirazol; 1H-1,2,3-triazol; 1H-1,2,4-triazol; 1H-tetrazol; 5-metil-1H-tetrazol; 5-(metiltio)-1H-tetrazol y similares.

En la realización del procedimiento de preparación (j), por ejemplo, 1 mol del compuesto de la fórmula (XV) o fórmula (XV-a) puede hacerse reaccionar con 1 a 3 moles de G6-H en presencia de 1 a 3 moles de base en un diluyente (por ejemplo, DMF) para obtener el compuesto correspondiente de la fórmula (I) de la fórmula (Ia) de la invención.

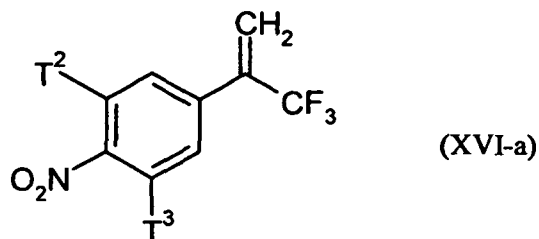
10 En los procedimientos de preparación de los compuestos de la fórmula (I) de la fórmula (Ia) de la presente invención, nuevos materiales entre los compuestos que son los materiales de partida (materiales de partida e intermedios) pueden representarse colectivamente mediante la fórmula que se describe a continuación.

Fórmula (II-a)



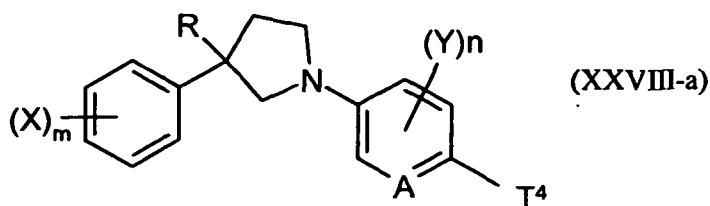
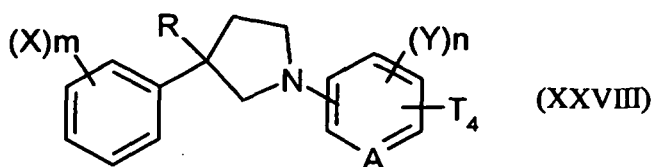
15 en la que X tiene el mismo significado que se ha definido en el presente documento, T¹ representa hidrógeno o bencilo, Hal-R representa haloalquilo y p representa 1, 2, 3, 4 ó 5.

Fórmula (XVI-a)

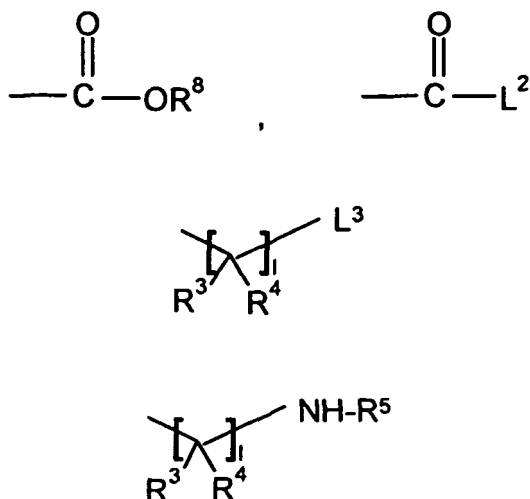


en la que cada T² y T³ represente independientemente alquilo.

Los compuestos de Fórmula (XXVIII) o compuestos de fórmula (XXVIII-a)



en las que X, Y, R, A, m y n tienen la misma definición de antes, T⁴ representa:



ciano, amino o nitro, R⁸, L², L³, R³, R⁴ y R⁵ tienen los mismos significados que se han descrito en el presente documento.

- 5 Los compuestos de acuerdo con la presente invención tienen potente actividad insecticida y acaricida. Por lo tanto, los compuestos representados por la fórmula (I) o fórmula (Ia) de la presente invención pueden usarse como insecticidas y/o acaricidas. Son particularmente útiles en el campo de la agricultura. Los compuestos de acuerdo con la presente invención también ejercen un efecto de control apropiado contra insectos perjudiciales sin fitotoxicidad contra plantas cultivadas. Además, los compuestos de la presente invención pueden usarse para controlar una amplia diversidad de plagas incluyendo, por ejemplo, insectos chupadores perjudiciales, insectos masticadores y otras plagas parasitarias de plantas, plagas de grano almacenado y plagas higiénicas así como plagas en el campo veterinario y pueden aplicarse para su control, en particular erradicación y exterminación. Por lo tanto, la presente invención también abarca un procedimiento para combatir plagas perjudiciales.

Tales insectos de plaga incluyen por ejemplo

- 15 Escarabajos, tales como gorgojo del garbanzo (*Callosobruchus chinensis*), gorgojo del grano (*Sitophilus zeamais*), gorgojo rojo de la harina (*Tribolium castaneum*), tortuguilla del frijol (*Epilachna vigintioctomaculata*), gusano de alambre de la cebada (*Agriotes fuscicollis*), escarabajo de la soja (*Anomala rufocuprea*), escarabajo de la patata (*Leptinotarsa decemlineata*), diabrotica (*Diabrotica* spp.), escarabajo de la madera del pino japonés (*Monochamus alternatus*), picudo acuático (*Lissorhoptus oryophilus*), escarabajo del polvo de los postes (*Lyctus brunus*),
20 escarabajo de las hojas de las cucurbitáceas (*Aulacophora femoralis*).

- Plagas de lepidópteros, tales como limantria (*Lymantria dispar*), oruga de librea (*Malacosoma neustria*), mariposa de la col (*Pieris rapae*), gusano gris del tabaco (*Spodoptera litura*), polilla de la col (*Mamestra brassicae*), Barrenador del Arroz (*Chilo suppressalis*), taladro del maíz (*Pyrausta nubilalis*), polilla del almacén (*Ephestia cautella*), gusano tortrix (*Adoxophyes orana*), polilla del manzano (*Carpocapsa pomonella*), polilla del gusano gris (*Agrotis fucosa*), falsa tina de las abejas (*Galleria mellonella*), palomilla de dorso diamante (*Plutella maculipennis*), Heliothis (*Heliothis virescens*), minador de los cítricos (*Phyllocnistis citrella*).

- Plagas de hemípteros, tales como cicada verde del arroz (*Nephotettix cincticeps*), fulgoromorfo marrón (*Nilaparvata lugens*), cochinilla harinosa comstock (*Pseudococcus comstocki*), *Unaspis yanonensis*, pulgón del melocotonero (*Myzus persicas*), pulgón verde del manzano (*Aphis pomi*), pulgón del algodón (*Aphis gossypii*), pulgón del nabo (*Phopalosiphum pseudobrassicas*), pulgón del peral (*Stephanitis nashi*), Nazara (*Nazara* spp.), mosca blanca de los invernaderos (*Trialeurodes vaporariorum*), Pshylla (*Pshylla* spp.).

- Plagas de tisanópteros, tales como tisanópteros del melón (*Thrips palmi*), tisanóptero de la flor occidental (*Frankliniella occidentalis*).

- Plagas de ortópteros, tales como cucaracha rubia (*Blatella germanica*), cucaracha americana (*Periplaneta americana*), alacrán cebollero (*Gryllotalpa africana*), langosta migratoria (*Locusta migratoria migratoriaodes*).

- Plagas de isópteros, tales como termita subterránea Japonesa (*Reticulitermes speratus*), termita subterránea de formosa (*Coptotermes formosanus*);

Plagas de dípteros, tales como mosca doméstica (*Musca domestica*), mosquito de la fiebre amarilla (*Aedes aegypti*), mosca de las semillas (*Hylemia platura*), mosquito común (*Culex pipiens*), *Anopheles sinensis*, mosquito transmisor de la encefalitis Japonesa (*Culex tritaeniorhynchus*), minador de serpentina americano (*Liriomyza trifolii*).

5 Ácaros, tales como araña roja (*Tetranychus cinnabarinus*), araña amarilla (*Tetranychus urticae*), araña roja de los cítricos (*Panonychus citri*), ácaro de la rolla de los cítricos rosa (*Aculops pelekassi*), Tarsonemus (*Tarsonemus* spp.).

Plagas de nematodos, tales como nematodo de los nudos de la raíz del boniato (*Meloidogyne incognita*), nematodo de la madera de pino (*Bursaphelenchus lignicolus* Mamiya y Kiyohara), nematodo del arroz (*Aphelenchoides besseyi*), nematodo de la soja (*Heterodera glycines*), nematodo de los prados (*Pratylenchus* spp.).

10 Adicionalmente, los compuestos de acuerdo con la invención, en combinación con buena tolerancia vegetal y toxicidad favorable para animales de sangre caliente y que se tolere bien por el ambiente, son adecuados para proteger plantas y órganos vegetales, para aumentar los rendimientos de cosecha, para mejorar la calidad del material cosechado y para controlar plagas animales, en particular insectos, arácnidos, helmintos, nematodos y moluscos, que se encuentran en agricultura, en horticultura, en ganadería, en bosques, en jardines e instalaciones de ocio, en la protección de productos almacenados y de materiales, en el sector de la higiene y de la salud animal.

15 Pueden emplearse preferentemente como agentes de protección de plantas. Son activos contra especies normalmente sensibles y resistentes y contra todas o algunas de las etapas del desarrollo. Las plagas que pueden combatirse usando los compuestos y composiciones de acuerdo con la invención incluyen adicionalmente entre otras:

20 Del orden de los anopluros (*Phthiraptera*), por ejemplo, *Damalinia* spp., *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Trichodectes* spp.

De la clase de los arácnidos, por ejemplo, *Acarus siro*, *Aceria sheldoni*, *Aculops* spp., *Aculus* spp., *Amblyomma* spp., *Argas* spp., *Boophilus* spp., *Brevipalpus* spp., *Bryobia praetiosa*, *Chorioptes* spp., *Dermanyssus gallinae*, *Eotetranychus* spp., *Epitrimerus pyri*, *Eutetranychus* spp., *Eriophyes* spp., *Hemitarsonemus* spp., *Hyalomma* spp., *Ixodes* spp., *Latrodectus mactans*, *Metatetranychus* spp., *Oligonychus* spp., *Ornithodoros* spp., *Panonychus* spp.,

25 *Phyllocoptura oleivora*, *Polyphagotarsonemus latus*, *Psoroptes* spp., *Rhipicephalus* spp., *Rhizoglyphus* spp., *Sarcoptes* spp., *Scorpio maurus*, *Stenotarsonemus* spp., *Tarsonemus* spp., *Tetranychus* spp., *Vasates lycopersici*.

De la clase de los bivalvos, por ejemplo, *Dreissena* spp.

Del orden de los quilópodos, por ejemplo, *Geophilus* spp., *Scutigera* spp.

30 Del orden de los coleópteros, por ejemplo, *Acanthoscelides obtectus*, *Adoretus* spp., *Agelastica alni*, *Agriotes* spp., *Amphimallon solstitialis*, *Anobium punctatum*, *Anoplophora* spp., *Anthonomus* spp., *Anthrenus* spp., *Apogonia* spp., *Atomaria* spp., *Attagenus* spp., *Bruchidius obtectus*, *Bruchus* spp., *Ceuthorhynchus* spp., *Cleonus mendicus*, *Conoderus* spp., *Cosmopolites* spp., *Costelytra zealandica*, *Curculio* spp., *Cryptorhynchus lapathi*, *Dermestes* spp., *Diabrotica* spp., *Epilachna* spp., *Faustinus cubae*, *Gibbium psylloides*, *Heteronychus arator*, *Hylamorphia elegans*, *Hylotrupes bajulus*, *Hypera postica*, *Hypothenemus* spp., *Lachnosterna consanguinea*, *Leptinotarsa decemlineata*,

35 *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Lixus* spp., *Lyctus* spp., *Meligethesaeneus*, *Melolontha melolontha*, *Migdolus* spp., *Monochamus* spp., *Naupactus xanthographus*, *Niptus hololeucus*, *Oryctes rhinoceros*, *Oryzaephilus surinamensis*, *Otiorrhynchus sulcatus*, *Oxycetonia jucunda*, *Phaedon cochleariae*, *Phyllophaga* spp., *Popillia japonica*, *Premnotypes* spp., *Psylliodes chrysocephala*, *Ptinus* spp., *Rhizobius ventralis*, *Rhizopertha dominica*, *Sitophilus* spp., *Sphenophorus* spp., *Sternechus* spp., *Symphyletes* spp., *Tenebrio molitor*, *Tribolium* spp., *Trogoderma* spp.,

40 *Tychius* spp., *Xylotrechus* spp., *Zabrus* spp.; así como *Callosobruchus chinensis*, *Sitophilus zeamais*, *Tribolium Castaneum*, *Epilachna vigintioctomaculata*, *Agriotes fuscicollis*, *Anomala rufocuprea*, *Leptinotarsa decemlineata*, *Diabrotica* spp., *Monochamus alternatus*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Lyctus bruneus*, y *Aulacophora femoralis*.

Del orden de los colémbolos, por ejemplo, *Onychiurus armatus*.

Del orden de los dermápteros, por ejemplo, *Forficula auricularia*.

45 Del orden de los diplópodos, por ejemplo, *Blaniulus guttulatus*.

Del orden de los dípteros, por ejemplo, *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Bibio hortulanus*, *Calliphora erythrocephala*, *Ceratitis capitata*, *Chrysomyia* spp., *Cochliomyia* spp., *Cordylobia anthropophaga*, *Culex* spp., *Cuterebra* spp., *Dacus oleae*, *Dermatobia hominis*, *Drosophila* spp., *Fannia* spp., *Gastrophilus* spp., *Hylemyia* spp., *Hyppobosca* spp., *Hypoderma* spp., *Liriomyza* spp., *Lucilia* spp., *Musca* spp., *Nezara* spp., *Oestrus* spp., *Oscinella frit*, *Pegomyia hyoscyami*, *Phorbia* spp., *Stomoxys* spp., *Tabanus* spp., *Tannia* spp., *Tipula paludosa*, *Wohlfahrtia* spp.; así como *Musca domestica*, *Aedes aegypti*, *Hylemia platura*, *Culex pipiens*, *Anopheles sinensis*, *Culex tritaeniorhynchus* y *Liriomyza trifolii*.

50

De la clase de los gasterópodos, por ejemplo, *Arion* spp., *Biomphalaria* spp., *Bulinus* spp., *Deroceas* spp., *Galba* spp., *Lymnaea* spp., *Oncomelania* spp., *Succinea* spp.

De la clase de los helmintos, por ejemplo, *Ancylostoma duodenale*, *Ancylostoma ceylanicum*, *Ancylostoma braziliensis*, *Ancylostoma* spp., *Ascaris lubricoides*, *Ascaris* spp., *Brugia malayi*, *Brugia timori*, *Bunostomum* spp., *Chabertia* spp., *Clonorchis* spp., *Cooperia* spp., *Dicrocoelium* spp., *Dictyocaulus filaria*, *Diphyllobothrium latum*, *Dracunculus medinensis*, *Echinococcus granulosus*, *Echinococcus multilocularis*, *Enterobius vermicularis*, *Fasciola* spp., *Haemonchus* spp., *Heterakis* spp., *Hymenolepis nana*, *Hyostrongylus* spp., *Loa Loa*, *Nematodirus* spp., *Oesophagostomum* spp., *Opisthorchis* spp., *Onchocerca volvulus*, *Ostertagia* spp., *Paragonimus* spp., *Schistosoma* spp., *Strongyloides fuelleborni*, *Strongyloides stercoralis*, *Strongyloides* spp., *Taenia saginata*, *Taenia solium*, *Trichinella spiralis*, *Trichinella nativa*, *Trichinella britovi*, *Trichinella nelsoni*, *Trichinella pseudopsiralis*, *Trichostrongylus* spp., *Trichuris trichuria*, *Wuchereria bancrofti*.

10 Es posible además controlar protozoos, tales como *Eimeria*.

Del orden de los heterópteros, por ejemplo, *Anasa tristis*, *Antestiopsis* spp., *Blissus* spp., *Calocoris* spp., *Campylomma livida*, *Cavelerius* spp., *Cimex* spp., *Creontiades dilutus*, *Dasynus piperis*, *Dichelops furcatus*, *Diconocoris hewetti*, *Dysdercus* spp., *Euschistus* spp., *Eurygaster* spp., *Heliopeltis* spp., *Horcias nobilellus*, *Leptocoris* spp., *Leptoglossus phyllopus*, *Lygus* spp., *Macropes excavatus*, *Miridae*, *Nezara* spp., *Oebalus* spp., *Pentomidae*, *Piesma quadrata*, *Piezodorus* spp., *Psallus seriatus*, *Pseudacysta persea*, *Rhodnius* spp., *Sahlbergella singularis*, *Scotinophora* spp., *Stephanitis nashi*, *Tibraca* spp., *Triatoma* spp.

Del orden de los homópteros, por ejemplo, *Acyrtosipon* spp., *Aeneolamia* spp., *Agonoscaena* spp., *Aleurodes* spp., *Aleurolobus barodensis*, *Aleurothrixus* spp., *Amrasca* spp., *Anuraphis cardui*, *Aonidiella* spp., *Aphanostigma piri*, *Aphis* spp., *Arboridia apicalis*, *Aspidiella* spp., *Aspidiotus* spp., *Atanus* spp., *Aulacorthum solani*, *Bemisia* spp., *Brachycaudus helichrysi*, *Brachycolus* spp., *Brevicoryne brassicae*, *Calligypona marginata*, *Carneiocephala fulgida*, *Ceratovacuna lanigera*, *Cercopidae*, *Ceroplastes* spp., *Chaetosiphon fragaefolii*, *Chionaspis tegalensis*, *Chlorita onukii*, *Chromaphis juglandicola*, *Chrysomphalus ficus*, *Cicadulina mbila*, *Coccomytilus halli*, *Coccus* spp., *Cryptomyzus ribis*, *Dalbulus* spp., *Dialeurodes* spp., *Diaphorina* spp., *Diaspis* spp., *Doralis* spp., *Drosicha* spp., *Dysaphis* spp., *Dysmicoccus* spp., *Empoasca* spp., *Eriosoma* spp., *Erythroneura* spp., *Euscelis bilobatus*, *Geococcus coffeae*, *Homalodisca coagulata*, *Hyalopterus arundinis*, *Icerya* spp., *Idiocerus* spp., *Idioscopus* spp., *Laodelphax striatellus*, *Lecanium* spp., *Lepidosaphes* spp., *Lipaphis erysimi*, *Macrosiphum* spp., *Mahanarva fimbriolata*, *Melanaphis sacchari*, *Metcalfiella* spp., *Metopolophium dirhodum*, *Monellia costalis*, *Monelliopsis pecanis*, *Myzus* spp., *Nasonovia ribisnigri*, *Nephotettix* spp., *Nilaparvata lugens*, *Oncometopia* spp., *Orthezia praelonga*, *Parabemisia myricae*, *Paratrioza* spp., *Parlatoria* spp., *Pemphigus* spp., *Peregrinus maidis*, *Phenacoccus* spp., *Phlocomyzus passerinii*, *Phorodon humuli*, *Phylloxera* spp., *Pinnaspis aspidistrae*, *Planococcus* spp., *Protospulvinaria pyriformis*, *Pseudaulacaspis pentagona*, *Pseudococcus* spp., *Psylla* spp., *Pteromalus* spp., *Pyrilla* spp., *Quadraspidotus* spp., *Quesada gigas*, *Rastrococcus* spp., *Rhopalosiphum* spp., *Saissetia* spp., *Scaphoides titanus*, *Schizaphis graminum*, *Selenaspis articulatus*, *Sogata* spp., *Sogatella furcifera*, *Sogatodes* spp., *Stictocephala festina*, *Tenalaphara malayensis*, *Tinocallis caryaefoliae*, *Tomaspis* spp., *Toxoptera* spp., *Trialeurodes vaporariorum*, *Trioza* spp., *Typhlocyba* spp., *Unaspis* spp., *Viteus vitifolii*.

Del orden de los himenópteros, por ejemplo, *Diprion* spp., *Hoplocampa* spp., *Lasius* spp., *Monomorium pharaonis*, *Vespa* spp.

Del orden de los isópodos, por ejemplo, *Armadillidium vulgare*, *Oniscus asellus*, *Porcellio scaber*.

Del orden de los isópteros, por ejemplo, *Reticulitermes* spp., *Odontotermes* spp.; así como *Reticulitermes speratus* y *Coptotermes formosanus*.

Del orden de los Lepidópteros, por ejemplo, *Acrionicta major*, *Aedia leucomelas*, *Agrotis* spp., *Alabama argillacea*, *Anticarsia* spp., *Barathra brassicae*, *Bucculatrix thurberiella*, *Bupalus piniarius*, *Cacoecia podana*, *Capua reticulana*, *Carpocapsa pomonella*, *Cheimatobia brumata*, *Chilo* spp., *Choristoneura fumiferana*, *Clysia ambiguella*, *Cnaphalocerus* spp., *Earias insulana*, *Ephestia kuehniella*, *Euproctis chrysoorrhoea*, *Euxoa* spp., *Feltia* spp., *Galleria mellonella*, *Helicoverpa* spp., *Heliothis* spp., *Hofmannophila pseudospretella*, *Homona magnanima*, *Hyponomeutapadella*, *Laphygma* spp., *Lithocolletis blancardella*, *Lithophane antennata*, *Loxagrotis albicosta*, *Lymantria* spp., *Malacosoma neustria*, *Mamestra brassicae*, *Mocis repanda*, *Mythimna separata*, *Oria* spp., *Oulema oryzae*, *Panolis flammea*, *Pectinophora gossypiella*, *Phyllocnistis citrella*, *Pieris* spp., *Plutella xylostella*, *Prodenia* spp., *Pseudaletia* spp., *Pseudoplusia includens*, *Pyrausta nubilalis*, *Spodoptera* spp., *Thermesia gemmatalis*, *Tinea pellionella*, *Tineola bisselliella*, *Tortrix viridana*, *Trichoplusia* spp.; así como *Lymantria dispar*, *Malacosoma neustria*, *Pieris rapae*, *Spodoptera litura*, *Mamestra brassicae*, *Chilo suppressalis*, *Pyrausta nubilalis*, *Ephestia cautella*, *Adoxophyes orana*, *Carpocapsa pomonella*, *Agrotis fucosa*, *Galleria mellonella*, *Plutella maculipennis*, *Heliothis virescens* y *Phyllocnistis citrella*.

Del orden de los ortópteros, por ejemplo, *Acheta domesticus*, *Blatta orientalis*, *Grylotalpa* spp., *Leucophaea maderae*, *Locusta* spp., *Melanoplus* spp., *Schistocerca gregaria*; así como *Blattella germanica*, *Periplaneta americana*, *Grylotalpa africana* y *Locusta migratoria migratoriaodes*.

Del orden de los sifonápteros, por ejemplo, *Ceratophyllus* spp., *Xenopsylla cheopis*.

Del orden de los sínfilos, por ejemplo, *Scutigera immaculata*.

Del orden de los tisanópteros, por ejemplo, *Baliothrips biformis*, *Enneothrips flavens*, *Frankliniella* spp., *Heliethrips* spp., *Hercinothrips femoralis*, *Kakothrips* spp., *Rhipiphorothrips cruentatus*, *Scirtothrips* spp., *Taeniothrips cardamoni*, *Thrips* spp.; así como *Thrips palmi* y *Frankliniella occidentalis*.

5 Del orden de los hemípteros, por ejemplo, *Nephotettix cincticeps*, *Nilaparvata lugens*, *Pseudococcus comstocki*, *Unaspis yanonensis*, *Myzus persicas*, *Aphis pomi*, *Aphis gossypii*, *Rhopalosiphum pseudobrassicac*, *Stephanitis nashi*, *Nazara* spp., *Trialeurodes vaporariorum* y *Pshylla* spp.;

Del orden de los tisanuros, por ejemplo, *Lepisma saccharina*.

10 Los nematodos fitoparasitarios incluyen, por ejemplo, *Anguina* spp., *Aphelenchoides* spp., *Belonoaimus* spp., *Bursaphelenchus* spp., *Ditylenchus dipsaci*, *Globodera* spp., *Heliocotylenchus* spp., *Heterodera* spp., *Longidorus* spp., *Meloidogyne* spp., *Radopholus similis*, *Rotylenchus* spp., *Trichodorus* spp., *Tylenchorhynchus* spp., *Tylenchulus* spp., *Tylenchulus semipenetrans*, *Xiphinema* spp.; así como *Meloidogyne incognita*, *Bursaphelenchus lignicolus* Mamiya y Kiyohara, *Aphelenchoides besseyi*, y *Heterodera glycines* y *Pratylenchus* spp.

Los ácaros incluyen, por ejemplo, *Tetranychus cinnabarinus*, *Tetranychus urticae*, *Panonychus citri*, *Aculops pelekassi* y *Tarsonemus* spp. o ácaros, tales como *Ornithodoros* spp., *Ixodes* spp., *Boophilus* spp. y similares.

15 En la presente invención, las sustancias que tienen efectos insecticidas contra parásitos que abarcan todas las plagas tales se denominan insecticidas.

20 Si es apropiado, los compuestos de acuerdo con la invención pueden, a ciertas concentraciones o tasas de aplicación, usarse también como herbicidas, sanadores, reguladores del crecimiento o agentes para mejorar las propiedades de la planta, o como microbicidas, por ejemplo como fungicidas, antimicóticos, bactericidas, viricidas (incluyendo agentes contra viroides) o como agentes contra MLO (organismos de tipo micoplasma) y RLO (organismos de tipo riquetsia). Si es apropiado, también pueden emplearse como intermedios o precursores para la síntesis de otros compuestos activos.

En el campo veterinario, los nuevos compuestos de la invención pueden usarse de forma eficaz para diversos parásitos animales perjudiciales (endoparásitos y ectoparásitos), incluyendo insectos y gusanos.

25 Los ejemplos de tales parásitos animales pueden incluir los siguientes parásitos: insectos, tales como estro (*Gastrophilus* spp.), mosca de los establos (*Stomoxys* spp.), piojo mordedor (*Trichodectes* spp.), *Rhodnius* (*Rhodnius* spp.), pulga del perro (*Ctenocephalides canis*), chinche (*Cimex lecturarius*), pulga del gato (*Ctenocephalides felis*), mosca azul de la oveja (*Lucilia cuprina*) y similares.

30 Como ya se ha mencionado anteriormente, en los campos veterinarios, es decir en el campo de la medicina veterinaria, los compuestos activos de acuerdo con la presente invención son activos contra parásitos animales, en particular ectoparásitos o endoparásitos. El término endoparásitos incluye en particular helmintos, tales como céstodos, nematodos o trematodos, y protozoos, tales como coccidios. Los ectoparásitos son típicamente y preferentemente artrópodos, en particular insectos tales como moscas (picadoras y chupadoras), larvas de moscas parásitas, piojos, piojos del cabello, piojos de aves, pulgas y similares; o acáridos, tales como garrapatas, garrapatas duras o garrapatas blandas, o ácaros, tales como ácaros de la sarna, ácaros de la cosecha, ácaros de aves y similares.

Estos parásitos incluyen:

40 Del orden de los anopluros, por ejemplo *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Phthirus* spp., *Solenopotes* spp.; son ejemplos particulares: *Linognathus setosus*, *Linognathus vituli*, *Linognathus ovillus*, *Linognathus oviformis*, *Linognathus pedalis*, *Linognathus stenopsis*, *Haematopinus asini macrocephalus*, *Haematopinus euryternus*, *Haematopinus suis*, *Pediculus humanus capitis*, *Pediculus humanus corporis*, *Phylloera vastatrix*, *Phthirus pubis*, *Solenopotes capillatus*.

45 Del orden de los malófagos y los subórdenes amblicerina e ischnocerina, por ejemplo *Trimenopon* spp., *Menopon* spp., *Trinoton* spp., *Bovicola* spp., *Werneckiella* spp., *Lepikentron* spp., *Damalina* spp., *Trichodectes* spp., *Felicola* spp.; son ejemplos particulares: *Bovicola bovis*, *Bovicola ovis*, *Bovicola limbata*, *Damalinabovis*, *Trichodectes canis*, *Felicola subrostratus*, *Bovicola caprae*, *Lepikentron ovis*, *Werneckiella equi*.

50 Del orden de los dípteros y los subórdenes Nematocera y Brachycera, por ejemplo *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Culex* spp., *Simulium* spp., *Eusimulium* spp., *Phlebotomus* spp., *Lutzomyia* spp., *Culicoides* spp., *Chrysops* spp., *Odagmia* spp., *Wilhelmia* spp., *Hybomitra* spp., *Atylotus* spp., *Tabanus* spp., *Haematopota* spp., *Philipomyia* spp., *Braula* spp., *Musca* spp., *Hydrotaea* spp., *Stomoxys* spp., *Haematobia* spp., *Morellia* spp., *Fannia* spp., *Glossina* spp., *Calliphora* spp., *Lucilia* spp., *Chrysomyia* spp., *Wohlfahrtia* spp., *Sarcophaga* spp., *Oestrus* spp., *Hypoderma* spp., *Gasterophilus* spp., *Hippobosca* spp., *Lipoptena* spp., *Melophagus* spp., *Rhinoestrus* spp., *Tipula* spp.; son ejemplos particulares: *Aedes aegypti*, *Aedes albopictus*, *Aedes taeniorhynchus*, *Anopheles gambiae*, *Anopheles maculipennis*, *Calliphora erythrocephala*, *Chrysozona pluvialis*, *Culex quinquefasciatus*, *Culex pipiens*, *Culex tarsalis*, *Fannia canicularis*, *Sarcophaga carnaria*, *Stomoxys calcitrans*, *Tipula paludosa*, *Lucilia cuprina*, *Lucilia sericata*,

55

- 5 *Simulium reptans*, *Phlebotomus papatasi*, *Phlebotomus longipalpis*, *Odagmia omata*, *Wilhelmia equina*, *Boophthora erythrocephala*, *Tabanus bromius*, *Tabanus spodopterus*, *Tabanus atratus*, *Tabanus sudeticus*, *Hybomitraciurea*, *Chrysops caecutiens*, *Chrysops relictus*, *Haematopota pluvialis*, *Haematopota italica*, *Musca autumnalis*, *Musca domestica*, *Haematobia irritans irritans*, *Haematobia irritans exigua*, *Haematobia stimulans*, *Hydrotaea irritans*,
 10 *Hydrotaea albipuncta*, *Chrysomya chloropyga*, *Chrysomya bezziana*, *Oestrus ovis*, *Hypoderma bovis*, *Hypoderma lineatum*, *Przhevalskiana silenus*, *Dermatobia hominis*, *Melophagus ovinus*, *Lipoptena capreoli*, *Lipoptena cervi*, *Hippobosca variegata*, *Hippobosca equina*, *Gasterophilus intestinalis*, *Gasterophilus haemorroidalis*, *Gasterophilus inermis*, *Gasterophilus nasalis*, *Gasterophilus nigricomis*, *Gasterophilus pecorum*, *Braula coeca*.
- Del orden de los sifonaptéridos, por ejemplo *Pulex* spp., *Ctenocephalides* spp., *Tunga* spp., *Xenopsylla* spp., *Ceratophyllus* spp.; son ejemplos particulares: *Ctenocephalides canis*, *Ctenocephalides felis*, *Pulex irritans*, *Tunga penetrans*, *Xenopsylla cheopis*.
- Del orden de los heteroptéridos, por ejemplo *Cimex* spp., *Triatoma* spp., *Rhodnius* spp., *Panstrongylus* spp.
- Del orden de los blatáridos, por ejemplo *Blatta orientalis*, *Periplaneta americana*, *Blattella germanica*, *Supella* spp. (por ejemplo, *Supella longipalpa*).
- 15 De la subclase de los ácaros (Acarina) y los órdenes de los Meta- y Mesostigmata, por ejemplo *Argas* spp., *Ornithodoros* spp., *Otobius* spp., *Ixodes* spp., *Amblyomma* spp., *Rhipicephalus* (*Boophilus*) spp. *Dermacentor* spp., *Haemaphysalis* spp., *Hyalomma* spp., *Dermanyssus* spp., *Rhipicephalus* spp. (el género original de garrapatas de múltiples huéspedes) *Ornithonyssus* spp., *Pneumonyssus* spp., *Raillietia* spp., *Pneumonyssus* spp., *Sternostoma* spp., *Varroa* spp., *Acarapis* spp.; son ejemplos particulares: *Argas persicus*, *Argas reflexus*, *Ornithodoros moubata*,
 20 *Otobius megnini*, *Rhipicephalus* (*Boophilus*) *microplus*, *Rhipicephalus* (*Boophilus*) *decoloratus*, *Rhipicephalus* (*Boophilus*) *annulatus*, *Rhipicephalus* (*Boophilus*) *calceratus*, *Hyalomma anatolicum*, *Hyalomma aegypticum*, *Hyalomma marginatum*, *Hyalomma transiens*, *Rhipicephalus evertsi*, *Ixodes ricinus*, *Ixodes hexagonus*, *Ixodes canisuga*, *Ixodes pilosus*, *Ixodes rubicundus*, *Ixodes scapularis*, *Ixodes holocyclus*, *Haemaphysalis concinna*, *Haemaphysalis punctata*, *Haemaphysalis cinnabarina*, *Haemaphysalisotophila*, *Haemaphysalis leachi*,
 25 *Haemaphysalis longicornis*, *Dermacentor marginatus*, *Dermacentor reticulatus*, *Dermacentor pictus*, *Dermacentor albipictus*, *Dermacentor andersoni*, *Dermacentor variabilis*, *Hyalomma mauritanicum*, *Rhipicephalus sanguineus*, *Rhipicephalus bursa*, *Rhipicephalus appendiculatus*, *Rhipicephalus capensis*, *Rhipicephalus turanicus*, *Rhipicephalus zambeziensis*, *Amblyomma americanum*, *Amblyomma variegatum*, *Amblyomma maculatum*, *Amblyomma hebraeum*, *Amblyomma cajennense*, *Dermanyssus gallinae*, *Ornithonyssus bursa*, *Ornithonyssus sylviarum*, *Varroa jacobsoni*.
- 30 Del orden de los actinédidos (*Prostigmata*) y Acarídidos (*Astigmata*), por ejemplo *Acarapis* spp., *Cheyletiella* spp., *Omitocheyletiella* spp., *Myobia* spp., *Psorergates* spp., *Demodex* spp., *Trombicula* spp., *Listrophorus* spp., *Acarus* spp., *Tyrophagus* spp., *Caloglyphus* spp., *Hypodectes* spp., *Pterolichus* spp., *Psoroptes* spp., *Chorioptes* spp., *Otodectes* spp., *Sarcoptes* spp., *Notoedres* spp., *Knemidocoptes* spp., *Cytodites* spp., *Laminosioptes* spp.; son ejemplos particulares: *Cheyletiella yasguri*, *Cheyletiella blakei*, *Demodex canis*, *Demodex bovis*, *Demodex ovis*,
 35 *Demodex caprae*, *Demodex equi*, *Demodex caballi*, *Demodex suis*, *Neotrombicula autumnalis*, *Neotrombicula desaleri*, *Neoschön-gastia xerothermobia*, *Trombicula akamushi*, *Otodectes cynotis*, *Notoedres cati*, *Sarcoptes canis*, *Sarcoptes bovis*, *Sarcoptes ovis*, *Sarcoptes rupicaprae* (= *S. caprae*), *Sarcoptes equi*, *Sarcoptes suis*, *Psoroptes ovis*, *Psoroptes cuniculi*, *Psoroptes equi*, *Chorioptes bovis*, *Psorergates ovis*, *Pneumonyssoides mange*, *Pneumonyssoides caninum*, *Acarapis woodi*.
- 40 Los compuestos activos de acuerdo con la invención también son adecuados para controlar artrópodos, helmintos y protozoos que atacan a animales. Se prefiere el control de artrópodos. El control de insectos se prefiere particularmente. Igualmente, se prefiere particularmente el control de acáridos.
- Los animales que pueden tratarse para controlar los parásitos incluyen aves, insectos y en particular mamíferos. Los animales incluyen ganado agrícola tal como, por ejemplo, vacas, ovejas, cabras, caballos, cerdos, burros, camellos,
 45 búfalos, conejos, pollos, animales de peletería, pavos, patos, gansos, peces de piscifactoría, abejas melíferas. Además, los animales incluyen animales domésticos, también denominados animales de compañía, tales como, por ejemplo, perros, gatos, hurones, aves de cuarto, peces de acuario, reptiles y lo que se conocen como animales experimentales tales como, por ejemplo, hámsteres, cobayas, ratas y ratones.
- Mediante el control de estos artrópodos, helmintos y/o protozoos, se pretende reducir las muertes y mejorar el rendimiento (en el caso de carne, leche, lana, pieles, huevos, miel y similares) y salud del animal huésped, de modo que sea posible un mantenimiento del animal más económico y más sencillo mediante el uso de los compuestos activos de acuerdo con la invención.
 50
- Por ejemplo, es deseable prevenir o interrumpir la toma de sangre por los parásitos de los huéspedes (cuando sea aplicable). Además, el control de los parásitos puede ayudar a prevenir la transmisión de agentes infecciosos.
- 55 El término "controlar" como se usa en el presente documento con respecto al campo veterinario, significa que los compuestos activos son eficaces en la reducción de la incidencia del parásito respectivo en un animal infectado con tales parásitos a niveles inocuos. Más específicamente, "controlar", como se usa en el presente documento, significa que el compuesto activo es eficaz para matar el parásito respectivo, inhibir su crecimiento o inhibir su proliferación.

- Los compuestos activos de la presente invención, cuando se usan como insecticidas, pueden formarse en formas de formulación convencionales. Tales formas de formulación incluyen, por ejemplo, soluciones, emulsiones, polvos humectables, gránulos dispersables en agua, suspensiones, polvos, espumas, pastas, comprimidos, gránulos, aerosoles, sustancias sintéticas y naturales impregnadas de compuesto activo, microcápsulas, agentes de revestimiento de semillas, formulaciones usadas con dispositivo de quema (los dispositivos de quema incluyen, por ejemplo, cartuchos de fumigación y ahumado, bidones y serpentines) y UVL [bruma fría, bruma cálida].
- Los compuestos activos de la fórmula (I) o fórmula (Ia) de la invención pueden estar presentes en las formulaciones comercialmente útiles y formas de uso preparadas a partir de sus formulaciones, como una forma de formulación mezclada con otros compuestos activos tales como insecticidas, cebos tóxicos, bactericidas, acaricidas, nematocidas, fungicidas, agentes reguladores del crecimiento, herbicidas y similares. Los insecticidas anteriormente mencionados pueden incluir, por ejemplo, agentes organofosfóricos, agentes de carbamato, agentes químicos carboxilados, agentes químicos de tipo clorohidrocarburo, sustancias insecticidas producidas por microorganismos y similares.
- Estas formulaciones pueden prepararse por el procedimiento conocido por sí mismo. Por ejemplo, pueden prepararse mezclando los compuestos activos juntos con agentes de propagación, es decir diluyentes o vehículos líquidos; diluyentes o vehículos de gas licuado; diluyente o vehículos sólidos y, opcionalmente, tensioactivos, es decir emulsionantes y/o dispersantes y/o agentes formadores de espuma.
- Cuando se usa agua como un agente de propagación, por ejemplo pueden usarse disolventes orgánicos como un disolvente auxiliar.
- Los diluyentes o vehículos líquidos pueden incluir, por ejemplo, hidrocarburos aromáticos (por ejemplo xileno, tolueno, alquilnaftaleno, etc.), hidrocarburos alifáticos clorados o aromáticos clorados (por ejemplo clorobencenos, cloruros de etileno, cloruros de metileno, etc.), hidrocarburos alifáticos (por ejemplo ciclohexanos o parafinas (por ejemplo fracciones de aceite mineral)), alcoholes (por ejemplo butanol, glicol y éteres o ésteres de los mismos, etc.), cetonas (por ejemplo acetona, metiletilcetona, metilisobutilcetona, ciclohexanona etc.), disolventes polares fuertes (por ejemplo dimetilformamida, dimetilsulfóxido, etc.), agua y similares.
- Los diluyentes o vehículos de gas licuado pueden incluir sustancias que existen como gas a temperatura ambiente y presión normal, por ejemplo propulsores de aerosol tales como furano, propano, gas nitrógeno, dióxido de carbono, hidrocarburos halogenados.
- Los diluyentes sólidos pueden incluir, por ejemplo, minerales naturales triturados, (por ejemplo caolina, arcilla, talco, tiza, cuarzo, attapulguita, montmorillonita o tierras diatomeas, etc.), minerales sintéticos triturados (por ejemplo, ácido silícico altamente dispersable, alúmina, silicato, etc.) y similares.
- Los vehículos sólidos para gránulos pueden incluir, por ejemplo, rocas trituradas y fraccionadas (por ejemplo calcita, mármol, piedra pómez, sepiolita, dolomita, etc.), gránulos sintéticos de polvos orgánicos o inorgánicos, partículas finas de materiales orgánicos (por ejemplo serrín, cáscaras de coco, mazorca de maíz, tallo de *Siegesbeckia orientalis*, etc.).
- Los emulsionantes y/o espumas pueden incluir, por ejemplo, emulsionantes aniónicos y no iónicos (por ejemplo ésteres de ácido graso de polioxietileno, éteres de alcohol graso de polioxietileno (por ejemplo alquilarilpoliglicol éter), alquil sulfonatos, alquil sulfatos, aril sulfonatos, etc.), productos hidrolizados de albúmina y similares.
- Los ejemplos de dispersantes incluyen, por ejemplo, licor residual de sulfito de lignina, metilcelulosa y similares.
- También pueden usarse agentes adhesivos para las formulaciones (polvos, gránulos, emulsiones), tales como carboximetilcelulosa, polímeros naturales o sintéticos (por ejemplo goma arábiga, alcoholes de polivinilo, acetatos de polivinilo, etc.) y similares.
- Pueden usarse colorantes, tales como pigmentos inorgánicos (por ejemplo óxido férrico, óxido titánico, azul de Prusia, etc.), pigmentos orgánicos (por ejemplo colorantes de alizarina, colorantes de azo o colorantes de metaloftalocianina, etc.) así como elementos traza (por ejemplo sales de hierro, manganeso, boro, cobre, cobalto, molibdeno o zinc, etc.).
- Generalmente tales formulaciones pueden contener los compuestos activos descritos anteriormente en un intervalo de 0,1 a 95 % en peso, preferentemente de 0,5 a 90 % en peso.
- Los compuestos de acuerdo con la presente invención pueden usarse de maneras ordinarias adecuadas para sus formas de aplicación. Se entiende que los compuestos de acuerdo con la invención también pueden estar presentes en composiciones que contienen ingredientes adicionales, tales como coadyuvantes o principios activos. El experto en la materia seleccionará un ingrediente adecuado entre los nombrados en el presente documento y conocidos en la técnica y que se supone que potencian una propiedad que se considera que es favorable a la vista de la aplicación y uso pretendidos.

Todas las plantas y partes de plantas pueden tratarse de acuerdo con la invención. Debe entenderse que plantas significa en el presente contexto todas las plantas y poblaciones de plantas tales como plantas silvestres deseadas y no deseadas o plantas de cultivo (incluyendo plantas de cultivo de origen natural). Las plantas de cultivo pueden ser plantas que pueden obtenerse por cultivo vegetal convencional y procedimientos de optimización o por procedimientos de ingeniería genética y biotecnológica o por combinaciones de esos procedimientos incluyendo las plantas transgénicas e incluyendo los cultivares de plantas protegidos o no protegidos por los derechos de los obtentores de plantas. Debe entenderse que las partes de plantas significan todas las partes y órganos de plantas por encima y por debajo del suelo, tales como brote, hoja, flor y raíz, siendo ejemplos que pueden mencionarse hojas, acículas, troncos, tallos, flores, cuerpos fructíferos, frutas, semillas, raíces, tubérculos y rizomas. Las partes de plantas también incluyen material cosechado y material de propagación vegetativo y generativo, por ejemplo esquejes, tubérculos, rizomas, vástagos y semillas.

El tratamiento de acuerdo con la invención de las plantas y partes de plantas con los compuestos activos se lleva a cabo directamente o permitiendo que los compuestos actúen en su ambiente, hábitat o espacio de almacenamiento por los procedimientos de tratamiento habituales, por ejemplo por inmersión, pulverización, evaporación, nebulización, dispersión, recubrimiento, inyección y, en el caso de material de propagación, en particular en el caso de semillas, también aplicando uno o más revestimientos.

Como ya se ha mencionado anteriormente, es posible tratar todas las plantas y sus partes de acuerdo con la invención, en una realización preferida, se tratan especies vegetales y cultivares de plantas silvestres, o los obtenidos por procedimientos de cultivo biológico convencional, tales como cruzamiento o fusión de protoplastos, y partes de los mismos. En una realización preferida adicional, se tratan plantas transgénicas y cultivares de plantas obtenidos por procedimientos de ingeniería genética, si resulta apropiado en combinación con procedimientos convencionales (Organismos Modificados Genéticamente) y partes de los mismos. Las expresiones "partes", "partes de plantas" y "partes vegetales" se han explicado anteriormente.

De forma particularmente preferente, las plantas de los cultivares de plantas que están en cada caso disponibles en el mercado o en uso se tratan de acuerdo con la invención. Se entiende que cultivares de plantas significa plantas que tienen nuevas propiedades ("rasgos") que se han obtenido por cultivo convencional, por mutagénesis o por técnicas de ADN recombinante. Estos pueden ser cultivares, bio o genotipos.

Dependiendo de la especie de planta o cultivar de planta, su localización y condiciones de cultivo (suelos, clima, periodo de vegetación, dieta), el tratamiento de acuerdo con la invención también puede dar como resultado efectos "sinérgicos" superaditivos. Son posibles, por ejemplo, las tasas de aplicación reducidas y/o una ampliación del espectro de actividad y/o un aumento de la actividad de las sustancias y composiciones que pueden usarse de acuerdo con la invención, mejor crecimiento de la planta, aumento de la tolerancia a temperaturas altas o bajas, aumento de la tolerancia a sequía o a contenido salino del agua o del suelo, aumento del rendimiento de la floración, cosecha más fácil, maduración acelerada, mayores rendimientos de la cosecha, mayor calidad y/o un valor nutricional más alto de los productos cosechados, mejor estabilidad en almacenamiento y/o procesabilidad de los productos cosechados, que exceden los efectos que de hecho se esperarían.

Las plantas o cultivares de plantas transgénicas preferidas (obtenidas por ingeniería genética) que deben tratarse de acuerdo con la invención incluyen todas las plantas que, basándose en la modificación genética, recibieron material genético que transmite rasgos útiles particularmente ventajosos a estas plantas. Los ejemplos de tales rasgos son mejor crecimiento de la planta, aumento de la tolerancia a temperaturas altas o bajas, aumento de la tolerancia a sequía o a contenido salino del agua o suelo, aumento del rendimiento de floración, cosecha más fácil, maduración acelerada, mayores rendimientos de cosecha, mayor calidad y/o mayor valor nutricional de los productos cosechados, mejor estabilidad del almacenamiento y/o procesabilidad de los productos cosechados. Son ejemplos particularmente enfatizados y adicionales de tales rasgos una mejor defensa de las plantas contra plagas animales y microbianas, tales como contra insectos, ácaros, hongos fitopatógenos, bacterias y/o virus, y también aumento de la tolerancia de las plantas a ciertos compuestos herbicidamente activos. Son ejemplos de plantas transgénicas que pueden mencionarse las plantas de cultivo importantes, tales como cereales (trigo, arroz), maíz, soja, patatas, remolacha azucarera, tomates, guisantes y otras variedades de verduras, algodón, tabaco, colza y también plantas con fruto (con los frutos, manzanas, peras, frutas cítricas y uvas), y se pone énfasis particular en maíz, soja, patatas, algodón, tabaco y colza. Los rasgos que se enfatizan en particular son la defensa aumentada de las plantas contra insectos, arácnidos, nematodos y babosas y caracoles basándose en las toxinas formadas en las plantas, en particular las formadas en las plantas por el material genético de *Bacillus thuringiensis* (por ejemplo por los genes CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c, Cry2Ab, Cry3Bb y CryIF y también combinaciones de los mismos) (denominadas posteriormente en el presente documento "plantas Bt"). Son rasgos que también se enfatizan particularmente la defensa aumentada de las plantas contra hongos, bacterias y virus por resistencia adquirida sistémica (SAR), sistemina, fitoalexinas, inductores y genes de resistencia y proteínas y toxinas expresadas de forma correspondiente. Son rasgos que se enfatizan más particularmente el aumento de tolerancia de las plantas a ciertos compuestos herbicidamente activos, por ejemplo imidazolinonas, sulfonilureas, glifosato y fosfinotricina (por ejemplo el gen "PAT"). Los genes que transmiten los rasgos deseados en cuestión también pueden estar presentes en combinación entre sí en las plantas transgénicas. Son ejemplos de "plantas Bt" que pueden mencionarse variedades de maíz, variedades de algodón, variedades de soja y variedades de patata que se venden con los nombres comerciales YIELD GARD® (por ejemplo maíz, algodón, soja), KnockOut® (por ejemplo

- maíz), StarLink® (por ejemplo maíz), Bollgard® (algodón), Nucotr® (algodón) y NewLeaf® (patata). Son ejemplos de plantas tolerantes a herbicida que pueden mencionarse variedades de maíz, variedades de algodón y variedades de soja que se venden con los nombres comerciales Roundup Ready® (tolerancia a glifosato, por ejemplo, maíz, algodón, soja), Liberty Link® (tolerancia a fosfinotricina, por ejemplo colza), IMI® (tolerancia a imidazolinonas) y STS® (tolerancia a sulfonilureas, por ejemplo maíz). Las plantas resistentes a herbicida (plantas cultivadas de una manera convencional para tolerancia a herbicida) que pueden mencionarse incluyen las variedades vendidas con el nombre Clearfield® (por ejemplo maíz). Por supuesto, estas declaraciones también se aplican a cultivares de plantas que tienen estos rasgos genéticos o rasgos genéticos aún por desarrollar, cultivares de plantas que se desarrollarán y/o comercializarán en el futuro.
- 10 Las plantas enumeradas pueden tratarse de acuerdo con la invención de una manera particularmente ventajosa con los compuestos o composiciones de acuerdo con la invención. Los intervalos preferidos indicados anteriormente para los compuestos o composiciones activas también se aplican al tratamiento de estas plantas. Se pone énfasis particular en el tratamiento de plantas con los compuestos o composiciones específicamente mencionados en el presente texto.
- 15 Se ha descubierto además que los compuestos de acuerdo con la invención tienen una fuerte acción insecticida contra insectos que destruyen materiales industriales.
- Pueden mencionarse los siguientes insectos como ejemplos y como preferidos, pero sin ninguna limitación:
- 20 Escarabajos, tales como *Hylotrupes bajulus*, *Chlorophorus pilosis*, *Anobium punctatum*, *Xestobium rufovillosum*, *Ptilinus pecticornis*, *Dendrobium pertinex*, *Ernobius mollis*, *Priobium carpini*, *Lyctus brunneus*, *Lyctus africanus*, *Lyctus planicollis*, *Lyctus linearis*, *Lyctus pubescens*, *Trogoxylon aequale*, *Minthes rugicollis*, *Xyleborus spec.* *Tryptodendron spec.* *Apate monachus*, *Bostrychus capucins*, *Heterobostrychus brunneus*, *Sinoxylon spec.* *Dinoderus minutus*;
- Himenópteros, tales como *Sirex juvencus*, *Urocerus gigas*, *Urocerus gigas taignus*, *Urocerus augur*;
- 25 Termitas, tales como *Kaloterme flavicollis*, *Cryptoterme brevis*, *Heteroterme indicola*, *Reticuliterme flavipes*, *Reticuliterme santonensis*, *Reticuliterme lucifugus*, *Mastoterme darwiniensis*, *Zootermopsis nevadensis*, *Coptoterme formosanus*;
- Pececillos de plata, tales como *Lepisma saccharina*.
- Debe entenderse que los materiales industriales en relación con la presente significan materiales no vivos, tales como, preferentemente, plásticos, adhesivos, colas, papeles y cartones, cuero, madera y productos de madera procesada y composiciones de revestimiento.
- 30 Las composiciones listas para su uso pueden, si resulta apropiado, comprender insecticidas adicionales y, si resulta apropiado, uno o más fungicidas.
- Con respecto a posibles aditivos adicionales, puede hacerse referencia a los insecticidas y fungicidas mencionados anteriormente.
- 35 Los compuestos de acuerdo con la invención pueden emplearse de forma similar para proteger objetos que entran en contacto con agua salada o agua salobre, en particular cascos, cribas, redes, edificios, equipos de amarre y sistemas de señalización, contra su obstrucción.
- Además, los compuestos de acuerdo con la invención, solos o en combinaciones con otros compuestos activos, pueden emplearse como agentes antiobstrucción.
- 40 En protección doméstica, de higiene y de productos almacenados, los compuestos activos también son adecuados para combatir plagas animales, en particular insectos, arácnidos y ácaros, que se encuentran en espacios cerrados tales como, por ejemplo, residencias, naves industriales, oficinas, cabinas de vehículos y similares. Pueden emplearse solos o en combinación con otros compuestos activos y coadyuvantes en productos insecticidas domésticos para controlar estas plagas. Son activos contra especies sensibles y resistentes y contra todas las etapas de desarrollo. Estas plagas incluyen:
- 45 Del orden de los escorpiónidos, por ejemplo, *Buthus occitanus*.
- Del orden de los ácaros, por ejemplo, *Argas persicus*, *Argas reflexus*, *Bryobia ssp.*, *Dermanyssus gallinae*, *Glyciphagus domesticus*, *Ornithodoros moubat*, *Rhipicephalus sanguineus*, *Trombicula alfreddugesi*, *Neutrombicula autumnalis*, *Dermatophagoides pteronissimus*, *Dermatophagoides forinae*.
- 50 Del orden de las arañas, por ejemplo, *Aviculariidae*, *Araneidae*.
- Del orden de los opiliones, por ejemplo, *Pseudoscorpiones chelifera*, *Pseudoscorpiones cheiridium*, *Opiliones phalangium*.

Del orden de los isópodos, por ejemplo, *Oniscus asellus*, *Porcellio scaber*.

Del orden de los diplópodos, por ejemplo, *Blaniulus guttulatus*, *Polydesmus* spp.

Del orden de los quilópodos, por ejemplo, *Geophilus* spp.

Del orden de los tisanuros, por ejemplo, *Ctenolepisma* spp., *Lepisma saccharina*, *Lepismodes inquilinus*.

- 5 Del orden de los blatodeos, por ejemplo, *Blatta orientalis*, *Blattella germanica*, *Blattella asahinai*, *Leucophaea maderae*, *Panchlora* spp., *Parcoblatta* spp., *Periplaneta australasiae*, *Periplaneta americana*, *Periplaneta brunnea*, *Periplaneta fuliginosa*, *Supella longipalpa*.

Del orden de los ortópteros, por ejemplo, *Acheta domesticus*.

Del orden de los dermápteros, por ejemplo, *Forficula auricularia*.

- 10 Del orden de los isópteros, por ejemplo, *Kaloterms* spp., *Reticuliterms* spp.

Del orden de los psocópteros, por ejemplo, *Lepinatus* spp., *Liposcelis* spp.

Del orden de los coleópteros, por ejemplo, *Anthrenus* spp., *Attagenus* spp., *Dermestes* spp., *Latheticus oryzae*, *Necrobia* spp., *Ptinus* spp., *Rhizopertha dominica*, *Sitophilus granarius*, *Sitophilus oryzae*, *Sitophilus zeamais*, *Stegobium paniceum*.

- 15 Del orden de los dípteros, por ejemplo, *Aedes aegypti*, *Aedes albopictus*, *Aedes taeniorhynchus*, *Anopheles* spp., *Calliphora erythrocephala*, *Chrysozona pluvialis*, *Culex quinquefasciatus*, *Culex pipiens*, *Culex tarsalis*, *Drosophila* spp., *Fannia canicularis*, *Musca domestica*, *Phlebotomus* spp., *Sarcophaga carnaria*, *Simulium* spp., *Stomoxys calcitrans*, *Tipula paludosa*.

- 20 Del orden de los lepidópteros, por ejemplo, *Achroia grisella*, *Galleria mellonella*, *Plodia interpunctella*, *Tinea cloacella*, *Tinea pellionella*, *Tineola bisselliella*.

Del orden de los sifonópteros, por ejemplo, *Ctenocephalides canis*, *Ctenocephalides felis*, *Pulex irritans*, *Tunga penetrans*, *Xenopsylla cheopis*.

Del orden de los himenópteros, por ejemplo, *Camponotus herculeanus*, *Lasius fuliginosus*, *Lasius niger*, *Lasius umbratus*, *Monomorium pharaonis*, *Paravespula* spp., *Tetramorium caespitum*.

- 25 Del orden de los anopluros, por ejemplo, *Pediculus humanus capitis*, *Pediculus humanus corporis*, *Pemphigus* spp., *Phylloera vastatrix*, *Phthirus pubis*.

Del orden de los heterópteros, por ejemplo, *Cimex hemipterus*, *Cimex lectularius*, *Rhodinus prolixus*, *Triatoma infestans*.

- 30 En el campo de insecticidas domésticos, puede usarse una combinación con otros compuestos activos adecuados, tales como ésteres fosfóricos, carbamatos, piretroides, neonicotinoides, reguladores del crecimiento o compuestos activos de otras clases conocidas de insecticidas y son especialmente preferibles.

- 35 Los compuestos o composiciones de acuerdo con la invención, preferentemente en su forma de aplicación adecuada, pueden usarse en aerosoles, productos de pulverización sin presión, por ejemplo pulverizadores atomizadores y de bomba, sistemas de nebulización automáticos, nebulizadores, espumas, geles, productos evaporadores con comprimidos evaporadores compuestos de celulosa o polímero, evaporadores líquidos, evaporadores de gel y membrana, evaporadores impulsados por propulsor, sistemas de evaporación sin energía o pasivos, papeles adhesivos, bolsas para polillas y geles para polillas, como gránulos o polvos, en cebos para dispersión o en estaciones de cebo.

- 40 Los compuestos o composiciones de acuerdo con la invención son particularmente adecuados para tratar semillas. Una gran parte del daño a plantas de cultivo que se provoca por las plagas se produce en cuanto la semilla es atacada durante el almacenamiento y después de que la semilla se introduzca en el suelo, durante e inmediatamente después de la germinación de las plantas. Esta fase es particularmente crítica puesto que las raíces y brotes de la planta en crecimiento son particularmente sensibles e incluso un daño menor puede conducir a la muerte de la planta completa. Proteger la semilla y la planta en germinación mediante el uso de composiciones adecuadas es por lo tanto particularmente de gran interés.

- 45 El control de plagas mediante el tratamiento de las semillas de plantas se ha conocido durante mucho tiempo y es la materia objeto de mejoras continuas. Sin embargo, el tratamiento de las semillas implica una serie de problemas que no siempre pueden resolverse de una manera satisfactoria. Por lo tanto, es deseable desarrollar procedimientos para proteger la semilla y la planta en germinación que prescindan de la aplicación adicional de agentes de
50 protección de cultivos después de la siembra o después de la aparición de las plantas. Es deseable además

optimizar la cantidad de compuesto activo empleado de una manera tal que proporcione la máxima protección para la semilla y la planta de germinación del ataque de plagas, pero sin dañar a la planta en sí misma por el compuesto activo empleado. En particular, los procedimientos para el tratamiento de semillas también deberían tomar en consideración las propiedades insecticidas intrínsecas de plantas transgénicas para conseguir la protección óptima de la semilla y también la planta en germinación empleando un mínimo de agentes de protección de cultivos.

Por lo tanto la presente invención también se refiere en particular a un procedimiento para la protección de semillas y plantas de germinación del ataque de plagas, tratando la semilla con una composición de acuerdo con la invención. La invención se refiere de forma similar al uso de las composiciones de acuerdo con la invención para el tratamiento de semillas para proteger la semilla y la planta resultante de plagas. Además, la invención se refiere a semillas que se han tratado con una composición de acuerdo con la invención para proporcionar protección de plagas.

Una de las ventajas de la presente invención es que las propiedades sistémicas particulares de las composiciones de acuerdo con la invención significan que el tratamiento de las semillas con estas composiciones no solamente protege la semilla en sí misma, sino también las plantas resultantes después de su aparición, de plagas. De esta manera, puede prescindirse del tratamiento inmediato del cultivo en el momento de la siembra o poco después de la misma.

Además, debe considerarse ventajoso que los compuestos o composiciones de acuerdo con la invención también puedan emplearse en particular en semillas transgénicas, siendo capaces las plantas que surgen de estas semillas de expresar una proteína dirigida contra plagas. Mediante el tratamiento de tales semillas con las composiciones de acuerdo con la invención, ciertas plagas pueden controlarse únicamente mediante la expresión de, por ejemplo, la proteína insecticida, y adicionalmente protegerse por las composiciones de acuerdo con la invención contra el daño.

Los compuestos o composiciones de acuerdo con la invención son adecuados para proteger semillas de cualquier variedad vegetal como ya se ha mencionado anteriormente que se emplee en agricultura, en el invernadero, en bosques o en horticultura. En particular, esta toma la forma de semilla de maíz, cacahuete, canola, colza, amapola, soja, algodón, remolacha (por ejemplo remolacha azucarera y remolacha forrajera), arroz, sorgo y mijo, trigo, cebada, avena, centeno, girasol, tabaco, patatas o verduras (por ejemplo tomates, coles). Las composiciones de acuerdo con la invención son adecuadas de forma similar para tratar la semilla de plantas con fruto y verduras como ya se ha mencionado anteriormente. El tratamiento de la semilla de maíz, soja, algodón, trigo y canola o colza es de particular importancia.

Como ya se ha mencionado anteriormente, el tratamiento de semilla transgénica con una composición de acuerdo con la invención también es de particular importancia. Esta toma la forma de semilla de plantas que, como norma, comprenden al menos un gen heterólogo que controla la expresión de un polipéptido en particular con propiedades insecticidas. En este contexto, los genes heterólogos en semillas transgénicas pueden derivar de microorganismos tales como *Bacillus*, *Rhizobium*, *Pseudomonas*, *Serratia*, *Trichoderma*, *Clavibacter*, *Glomus* o *Gliocladium*. La presente invención es particularmente adecuada para el tratamiento de semillas transgénicas que comprenden al menos un gen heterólogo que se origina en *Bacillus* sp. y cuyo producto génico muestra actividad contra el taladro del maíz Europeo y/o el gusano de la raíz del maíz. Es de forma particularmente preferente un gen heterólogo derivado de *Bacillus thuringiensis*.

En el contexto de la presente invención, la composición de acuerdo con la invención se aplica a la semilla sola o en una formulación adecuada. Preferentemente, la semilla se trata en un estado que es suficientemente estable para evitar el daño durante el tratamiento. En general, la semilla puede tratarse en cualquier punto temporal entre la cosecha y la siembra. La semilla usada habitualmente se ha separado de la planta y liberado de mazorcas, cáscaras, troncos, revestimientos, pelos o la carne de los frutos.

Cuando se trata la semilla, se debe tener cuidado en general de que la cantidad de la composición de acuerdo con la invención aplicada a la semilla y/o la cantidad de aditivos adicionales se seleccione de tal modo que la germinación de la semilla no se vea afectada de forma adversa o que la planta resultante no se dañe. Esto debe tenerse en cuenta en particular en el caso de compuestos activos que pueden tener efectos fitotóxicos a ciertas tasas de aplicación.

Los compuestos activos de la presente invención, cuando se usan contra plagas higiénicas y plagas de grano almacenado, tienen una buena estabilidad frente a álcali en sustancias calcáreas y también muestran una excelente actividad residual en madera y suelo.

Además, los compuestos activos de la fórmula (I) o fórmula (Ia) de la invención pueden estar presentes como una formulación mezclada con compuestos sinérgicos y tales formulaciones y formas de uso pueden incluir formulaciones y formas comercialmente útiles. Tales compuestos sinérgicos, que no son necesariamente activos por sí mismos, son compuestos que potencian la acción de los compuestos activos.

Generalmente, cuando se usan para el tratamiento de animales los compuestos activos de acuerdo con la invención pueden aplicarse directamente. Preferentemente se aplican como composiciones farmacéuticas que pueden contener excipientes y/o coadyuvantes farmacéuticamente aceptables que se conocen en la técnica.

En el campo veterinario y en la cría de animales, los compuestos activos se aplican (= administran) de la manera conocida por administración entérica en forma de, por ejemplo, comprimidos, cápsulas, bebidas, pociones, gránulos, pastas, emboladas, el procedimiento de alimentación, supositorios; por administración parenteral, tal como, por ejemplo, por inyecciones (intramuscular, subcutánea, intravenosa, intraperitoneal y similares), implantes, por aplicación nasal, por aplicación dérmica en forma de, por ejemplo, baño o inmersión, pulverización, vertido y aplicación puntual, lavado, espolvoreo y con la ayuda de artículos moldeados que comprenden compuesto activo tales como collares, marcas de la oreja, marcas de la cola, bandas de las extremidades, bridas, dispositivos de marcado y similares. Los compuestos activos pueden formularse como champú o como formulaciones adecuadas que pueden utilizarse en aerosoles, pulverizadores no presurizados, por ejemplo pulverizadores de bomba y pulverizadores atomizados.

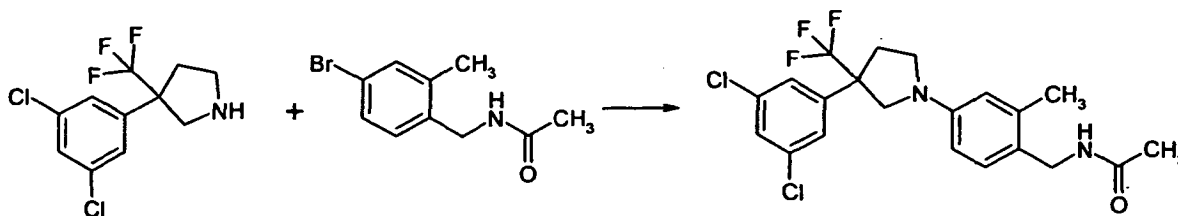
Cuando se usan para ganado, aves de corral, animales domésticos y similares, los compuestos activos de acuerdo con la presente invención pueden aplicarse como formulaciones (por ejemplo polvos, polvos humectables ["WP"], emulsiones, concentrados emulsionables ["EC"], suspensiones, soluciones homogéneas y concentrados en suspensión ["SC"]) que comprenden los compuestos activos en una cantidad de 1 a 80 % en peso, directamente o después de dilución (por ejemplo dilución de 100 a 10.000 veces) o en su lugar como un baño químico.

Cuando se usan en el campo veterinario los compuestos activos de acuerdo con la invención pueden usarse en combinación con compuestos sinérgicos adecuados u otros compuestos activos, tales como por ejemplo, acaricidas, insecticidas, antihelmínticos, fármacos antiprotozoarios.

La presente invención se ilustra más específicamente por medio de los siguientes ejemplos. Sin embargo la presente invención no debería limitarse solamente a estos ejemplos.

Ejemplo sintético 1

Síntesis de N-{4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidin-1-il]-2-metilbencil}acetamida (N° 3-11)



Se añadieron terc-butóxido sódico (0,3 g), Tris(dibencilideno acetona)dipaladio (0) (aducto de cloroformo) (0,04 g) y Xantphos (0,07 g) a la solución de 3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidina (0,59 g) y N-(4-bromo-2-metilbencil)acetamida (0,5 g) en tolueno en una atmósfera de argón, y la mezcla se calentó con agitación a 80 °C durante 5 horas. La solución de reacción se diluyó con t-butilmetiléter y después se lavó con agua y salmuera. La fase orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. El disolvente se eliminó por destilación a presión reducida y después el residuo se purificó por cromatografía sobre gel de sílice para producir N-{4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidin-1-il]-2-metilbencil}acetamida (0,6 g).

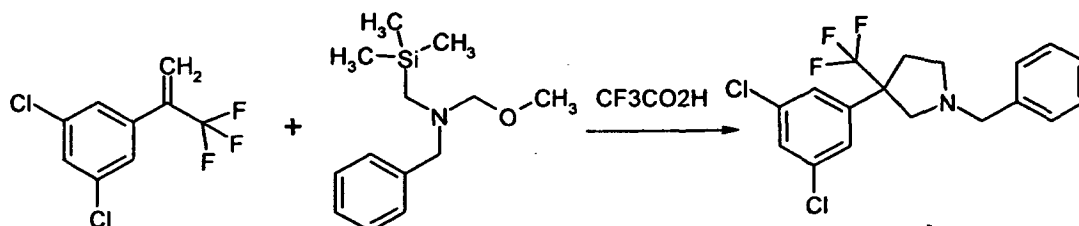
RMN ¹H (CDCl₃) δ: 2,13-2,18 (6H, m), 2,51-2,53 (1H, m), 2,81-2,83 (1H, m), 3,45-3,56 (2H, m), 3,75-3,78 (1H, m), 4,01-4,04 (1H, m), 4,25 (1H, s), 4,57 (1H, s), 6,40-6,44 (2H, m), 6,93-6,96 (1H, m), 7,30-7,38 (3H, m)

Ejemplo sintético 2

Síntesis de 4-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidin-1-il]-2-nitro-N-(piridin-2-ilmetil)benzamida (N° 1-16)

Ejemplo sintético 2-1

Síntesis de 1-bencil-3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidina (N° 5-11)

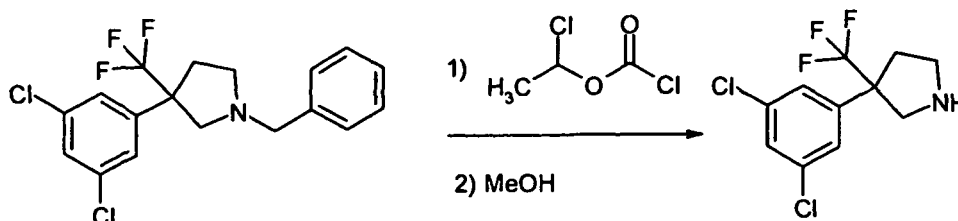


A la solución de 1,3-dicloro-5-[1-(trifluorometil)vinil]benceno (6,1 g) y N-bencil-1-metoxi-N-[(trimetilsilil)metil]metanamina (5,0 g) en diclorometano se le añadió gota a gota la solución de ácido trifluoroacético (0,24 g) en diclorometano mientras se refrigeraba con hielo. Cuando se completó la adición gota a gota, la mezcla se calentó a temperatura ambiente y se agitó durante 3 horas. La solución se concentró a presión reducida, y después el residuo se diluyó con t-butilmetiléter. La solución se lavó con bicarbonato sódico saturado, agua y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. Después de eliminar el agente de secado por filtración, el disolvente se eliminó por destilación a presión reducida, y después el residuo se purificó por cromatografía sobre gel de sílice para producir 1-bencil-3-(3,5-diclorofenil)-3-(tri-fluorometil)pirrolidina (5,7 g).

RMN ^1H (CDCl_3) δ : 2,27-2,36(1H, m), 2,53-2,62(1H, m), 2,69-2,83 (2H, m), 3,08 (2H, dd), 3,67 (2H, s), 7,25-7,36 (8H, m)

Ejemplo sintético 2-2

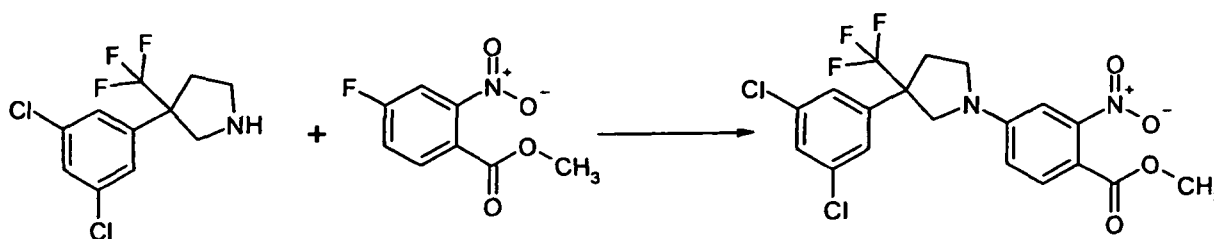
Síntesis de 3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidina (N° 5-12)



La solución de 1-bencil-3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidina (5,7 g) y cloroformiato de 1-cloroetilo (4,4 g) en dicloroetano se calentó a reflujo durante 3 horas. La mezcla se enfrió a temperatura ambiente y después se concentró a presión reducida. Se añadió metanol al residuo resultante, que después se calentó con agitación a 60 °C durante dos horas. La mezcla se enfrió a temperatura ambiente, a lo que después se le añadió agua. La solución se lavó dos veces con el disolvente mixto de hexano y acetato de etilo (9:1). La solución se alcalizó con carbonato ácido de sodio y después se extrajo con acetato de etilo tres veces. La fase orgánica se combinó, lo que después se lavó con salmuera y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. Después de eliminar el agente de secado por filtración, el disolvente se eliminó por destilación a presión reducida para producir 3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidina (4,2 g). RMN ^1H (CDCl_3) δ : 2,24-2,33 (1H, m), 2,51-2,56 (1H, m), 2,97-3,07 (1H, m), 3,19-3,26 (2H, m), 3,74 (1H, d), 7,25 (2H, d), 7,35 (1H, t)

Ejemplo sintético 2-3

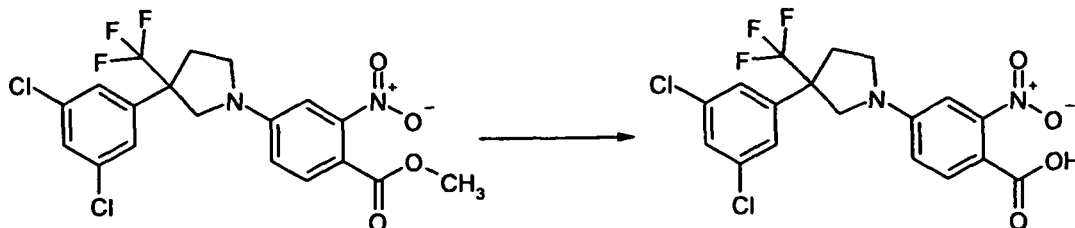
Síntesis de 4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidin-1-il]-2-nitrobenzoato de metilo (N° 4-6)



A la solución de 4-fluoro-2-nitrobenzoato de metilo (1,1 g) y 3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidina (1,5 g) en 1-metil-2-pirrolidinona se le añadió carbonato potásico (1,5 g) y la mezcla se calentó con agitación a 100 °C durante dos horas. La mezcla se enfrió a temperatura ambiente y después se vertió en agua, que después se extrajo dos veces con acetato de etilo. La fase orgánica se combinó, lo que después se lavó con agua y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. Después de eliminar el agente de secado por filtración, el disolvente se eliminó por destilación a presión reducida y después el residuo se purificó por cromatografía sobre gel de sílice para producir 4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidin-1-il]-2-nitrobenzoato de metilo (1,24 g). RMN ^1H (CDCl_3) δ : 2,53-2,67 (1H, m), 2,89-2,97 (1H, m), 3,50-3,71 (2H, m), 3,83 (1H, d), 3,85 (3H, s), 4,15 (1H, d), 6,69 (1H, dd), 6,75 (1H, d), 7,26 (2H, d), 7,42 (1H, t), 7,81 (1H, d)

Ejemplo sintético 2-4

Síntesis de ácido 4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidin-1-il]-2-nitrobenzoico (N° 4-7)

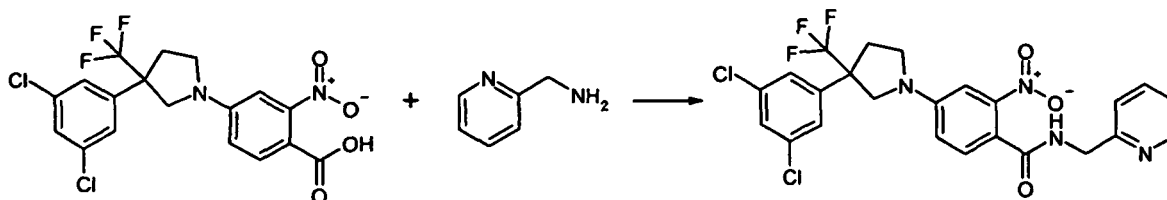


5 A la solución de 4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidin-1-il]-2-nitrobenzoato de metilo (1,24 g) en 1,4-dioxano se le añadió hidróxido sódico acuoso 2 N (5,4 ml) y la mezcla se calentó con agitación a 80 °C. La mezcla se enfrió a temperatura ambiente y después se acidificó con ácido clorhídrico 2 N antes de extraer la mezcla dos veces con acetato de etilo. La fase orgánica se combinó, lo que después se lavó con agua y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. Después de eliminar el agente de secado por filtración, el disolvente se eliminó por destilación a presión reducida para producir ácido 4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidin-1-il]-2-nitrobenzoico (0,85 g). RMN ¹H (DMSO-d₆) δ: 2,58-2,72 (1H, m), 2,91-3,04 (1H, m), 3,47-3,57 (2H, m), 3,87 (1H, d), 4,32 (1H, d), 6,86 (1H, dd), 7,04 (1H, d), 7,65 (2H, d), 7,71 (1H, t), 7,78 (1H, d)

10

Ejemplo sintético 2-5

Síntesis de 4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidin-1-il]-2-nitro-N-(piridin-2-ilmetil)benzamida (N° 1-16)

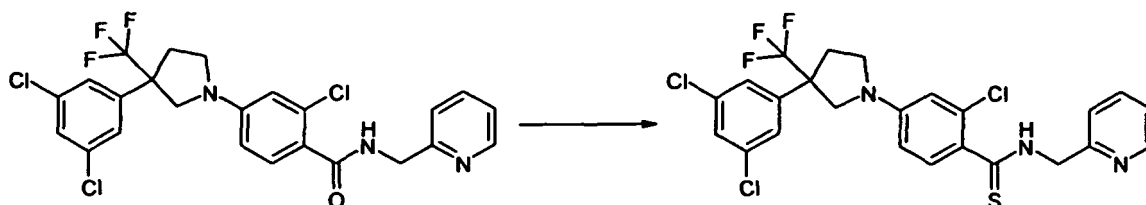


15 A la solución de ácido 4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidin-1-il]-2-nitrobenzoico (0,3 g) y 2-picolilamina (0,07 g) en DMF se le añadió clorhidrato de 1-etil-3-(3'-dimetilaminopropil)carbodiimida (0,13 g) y monohidrato de 1-hidroxibenzotriazol (0,01 g), y la mezcla se agitó durante 6 horas a temperatura ambiente. La solución de reacción se vertió en agua, que después se extrajo dos veces con acetato de etilo. La fase orgánica se combinó, lo que después se lavó con agua y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. Después de eliminar el agente de secado por filtración, el disolvente se eliminó por destilación a presión reducida, y después el residuo se purificó por cromatografía sobre gel de sílice para producir 4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidin-1-il]-2-nitro-N-(piridina-2-ilmetil)benzamida (0,19 g). RMN ¹H (CDCl₃) δ: 2,54-2,65 (1H, m), 2,89-2,97 (1H, m), 3,51-3,67 (2H, m), 3,83 (1H, d), 4,13 (1H, d), 4,74 (2H, d), 6,75 (1H, dd), 7,08 (1H, d), 7,15-7,23 (2H, m), 7,28 (2H, s a), 7,37 (1H, d), 7,41 (1H, t), 7,49 (1H, d), 7,70 (1H, td), 8,52 (1H, d).

20

Ejemplo sintético 3

2-cloro-4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidin-1-il]-N-(piridin-2-ilmetil)benzenocarbotoamida (N° 1-81)



30 A la solución de 2-cloro-4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidin-1-il]-N-(piridin-2-ilmetil)benzamida (0,35 g) en tolueno se le añadió reactivo de Lawesson (0,28 g) y la mezcla se calentó a reflujo durante 3 horas. Después de enfriar la mezcla a temperatura ambiente, el disolvente se eliminó por destilación a presión reducida y el residuo se purificó por cromatografía sobre gel de sílice para producir 2-cloro-4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidin-1-il]-N-(piridin-2-ilmetil)benzenocarbotoamida (0,10 g). RMN ¹H (CDCl₃) δ: 2,51-2,61 (1H, m), 2,84-2,92 (1H, m), 3,45-

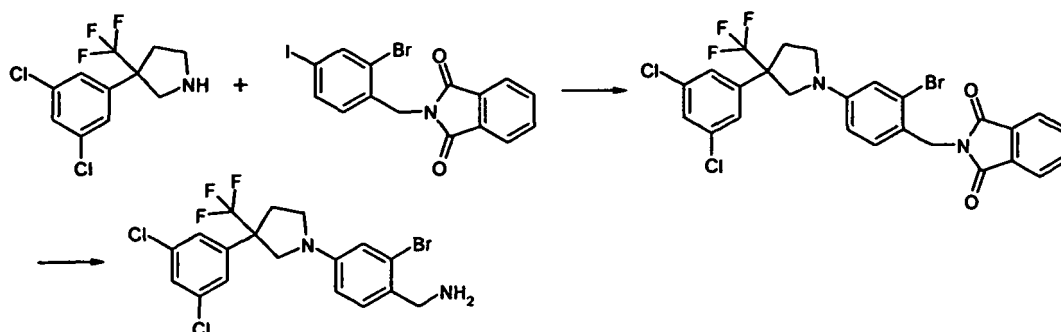
3,61 (2H, m), 3,79 (1H, d), 4,08 (1H, d), 5,08 (2H, d), 6,49-6,54 (2H, m), 7,22-7,28 (3H, m), 7,36 (1H, d), 7,40 (1H, t), 7,72 (1H, td), 7,79 (1H, d), 8,54 (1H, d), 9,27 (1H, s a).

Ejemplo sintético 4

Síntesis de N-{2-cloro-4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidin-1-il]bencil}acetamida (N° 3-3)

5 Ejemplo sintético 4-1

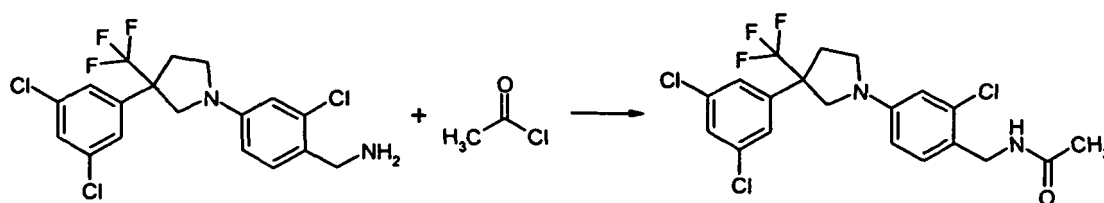
Síntesis de 1-{2-cloro-4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidin-1-il]fenil}metanamina (N° 4-49)



Se añadió terc-butóxido sódico (0,2 g), Tris(dibencilideno acetona)dipaladio (0) (aducto de cloroformo) (0,03 g) y Xantphos (0,05 g) a la solución de 3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidina (0,4 g) y 2-(2-cloro-4-yodobencil)-1H-isoindolo-1,3-(2H)-diona (0,69 g) en tolueno en una atmósfera de argón y la mezcla se calentó con agitación a 80 °C durante 3 horas. La solución de reacción se diluyó con t-butilmetiléter y después se lavó con agua y salmuera. La fase orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. El disolvente se eliminó por destilación a presión reducida para producir el producto en bruto. El producto se disolvió en metanol, a lo que después se le añadió hidrazina acuosa (0,03 g), seguido del calentamiento de la mezcla a reflujo durante 12 horas. La solución de reacción se diluyó con t-butilmetiléter y después se lavó con solución salina saturada. La fase orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. El disolvente se eliminó por destilación a presión reducida y después el residuo se purificó por cromatografía sobre gel de sílice para producir 1-{2-cloro-4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidin-1-il]fenil}metanamina (0,12 g). RMN ¹H (CDCl₃) δ: 2,47-2,54 (1H, m), 2,78-2,85 (1H, m), 3,46-3,49 (2H, m), 3,69-4,01 (4H, m), 6,47-6,50 (1H, m), 6,73-6,76 (1H, m), 7,25-7,35 (4H, m).

20 Ejemplo sintético 4-2

Síntesis de N-{2-cloro-4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidin-1-il]bencil}acetamida (N° 3-3)



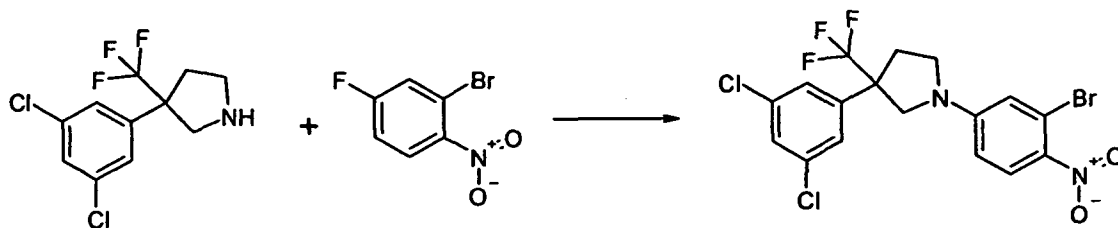
A la solución de 1-{2-cloro-4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidin-1-il]fenil}metanamina (0,12 g) y trietilamina (0,04 g) en tetrahidrofurano se le añadió gota a gota cloruro de acetilo (0,02 g) y la mezcla se agitó durante una hora a temperatura ambiente. La solución de reacción se diluyó con t-butilmetiléter y después se lavó con agua y salmuera. La fase orgánica se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. El disolvente se eliminó por destilación a presión reducida y después el residuo se purificó por cromatografía sobre gel de sílice para producir N-{2-cloro-4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidin-1-il]bencil}acetamida (0,1 g). RMN ¹H (CDCl₃) δ: 1,98-2,01 (3H, m), 2,50-2,58 (1H, m), 2,82-2,87 (1H, m), 3,45-3,51 (2H, m), 3,74 (1H, d), 4,02 (1H, d), 4,41 (2H), 6,43-6,46 (1H, m), 6,58-6,59 (1H, m), 7,26-7,38 (4H, m).

Ejemplo sintético 5

Síntesis de 1-{2-bromo-4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidin-1-il]fenil}-1H-tetrazol (N° 2-23)

Ejemplo sintético 5-1

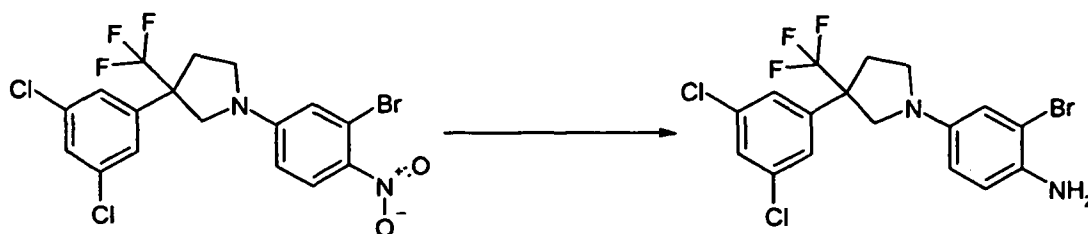
Síntesis de 1-(3-bromo-4-nitrofenil)-3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidina (N° 4-20)



5 A la solución de 3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidina (1,3 g) y 2-bromo-4-fluoro-1-nitrobenzene (1,0 g) en 1-metil-2-pirrolidinona se le añadió carbonato potásico (1,3 g) y la mezcla se calentó con agitación a 100 °C durante 3 horas. La mezcla se enfrió a temperatura ambiente y después se vertió en agua, que se extrajo dos veces con acetato de etilo. La fase orgánica se combinó, lo que después se lavó con agua y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. Después de eliminar el agente de secado por filtración, el disolvente se eliminó por destilación a presión reducida y después el residuo se purificó por cromatografía sobre gel de sílice para producir 1-(3-bromo-4-nitrofenil)-3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidina (1,56 g). RMN ¹H (CDCl₃) δ: 2,53-2,66 (1H, m), 2,89-2,97 (1H, m), 3,51-3,71 (2H, m), 3,83 (1H, d), 4,16 (1H, d), 6,53 (1H, dd), 6,84 (1H, d), 7,27 (2H, s a), 7,42 (1H, t), 8,07 (1H, d).

Ejemplo sintético 5-2

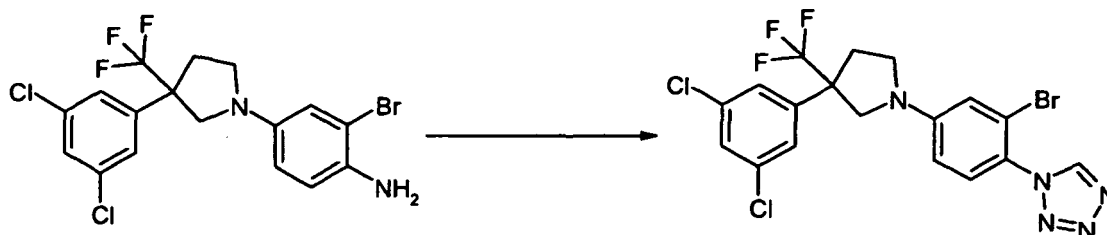
Síntesis de 2-bromo-4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)-pirrolidin-1-il]anilina (N° 4-21)



15 A la solución de 1-(3-bromo-4-nitrofenil)-3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidina (1,10 g) en el disolvente mixto de 1,4-dioxano y etanol se le añadió cloruro estanoso dihidrato (2,05 g) y una pequeña cantidad de ácido clorhídrico concentrado, y después la mezcla se agitó 4 horas a 90 °C. La mezcla se enfrió a temperatura ambiente y después se vertió en la solución mixta de acetato de etilo y agua, que después se neutralizó con carbonato ácido de sodio con agitación vigorosa. Después de la filtración del precipitado a través de Celite, la fase orgánica se separó y la fase acuosa se extrajo con acetato de etilo. La fase orgánica se combinó, lo que después se lavó con salmuera y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. Después de eliminar el agente de secado por filtración, el disolvente se eliminó por destilación a presión reducida y después el residuo se purificó por cromatografía sobre gel de sílice para producir 2-bromo-4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)-pirrolidin-1-il]anilina (0,73 g). RMN ¹H (CDCl₃) δ: 2,44-2,54 (1H, m), 2,75-2,83 (1H, m), 3,32-3,50 (2H, m), 3,56-3,76 (3H, m), 3,92 (1H, d), 6,46 (1H, dd), 6,70-6,78 (2H, m), 7,29 (2H, s a), 7,37 (1H, t).

Ejemplo sintético 5-3

Síntesis de 1-{2-bromo-4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidin-1-il]fenil}-1H-tetrazol (N° 2-23)



30 A la mezcla de 2-bromo-4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)-pirrolidin-1-il]anilina (0,60 g), ortoformiato de trietilo (0,98 g) y azida sódica (0,38 g) se le añadió ácido acético (1,1 g) y después la mezcla se calentó con agitación a 100 °C durante 4 horas. La mezcla se enfrió a temperatura ambiente y después se vertió en agua, que después se extrajo dos veces con acetato de etilo. La fase orgánica se combinó, lo que después se lavó con agua y se secó

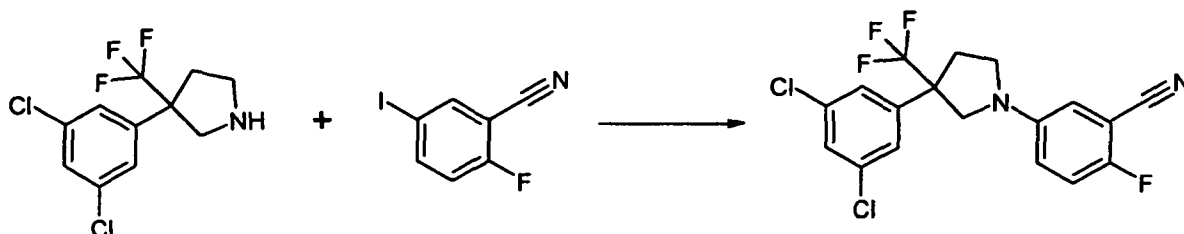
sobre sulfato de magnesio anhidro. Después de eliminar el agente de secado por filtración, el disolvente se eliminó por destilación a presión reducida, y después el residuo se purificó por cromatografía sobre gel de sílice para producir 1-{2-bromo-4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)-pirrolidin-1-il]fenil}-1H-tetrazol (0,52 g). P.f. 193-194 °C.

Ejemplo sintético 6

- 5 Síntesis de 5-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidin-1-il]-2-(1H-1,2,4-triazol-1-il)benzonitrilo (N° 2-39)

Ejemplo sintético 6-1

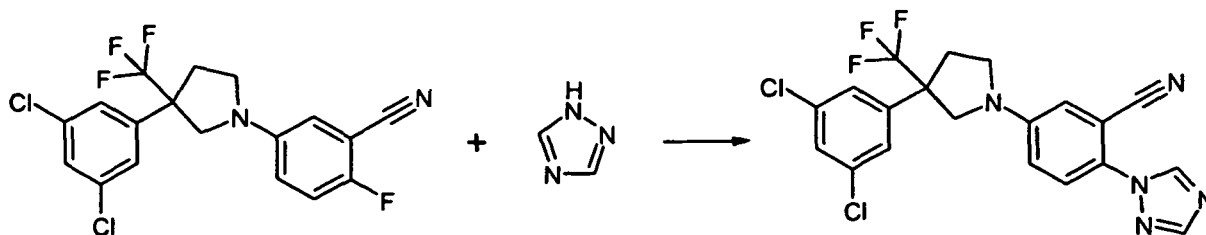
Síntesis de 5-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidin-1-il]-2-fluorobenzonitrilo (N° 4-17)



- 10 Se disolvieron 3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidina (0,6 g) y 2-fluoro-5-yodobenzonitrilo (0,57 g) en tolueno, que después se desgasificó 3 veces. A la solución en tolueno se le añadieron terc-butóxido sódico (0,20 g), complejo tris(dibencilideno acetona)dipaladio cloroformo (0,04 g) y Xantphos (0,07 g) en una atmósfera de argón, y la mezcla se agitó a 80 °C durante dos horas. La mezcla se enfrió a temperatura ambiente y después se diluyó con acetato de etilo, lo que después se lavó con agua y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. Después de eliminar el agente de secado por filtración, el disolvente se eliminó por destilación a presión reducida, y después el residuo se purificó por cromatografía sobre gel de sílice para producir 5-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidin-1-il]-2-fluorobenzonitrilo(0,54 g). P.f. 184-186 °C.
- 15

Ejemplo sintético 6-2

Síntesis de 5-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidin-1-il]-2-(1H-1,2,4-triazol-1-il)benzonitrilo (N° 2-39)

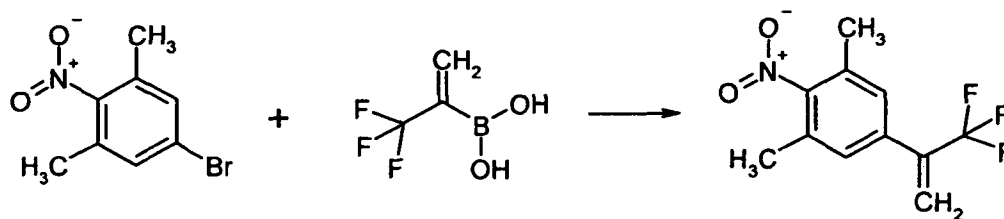


- 20 A la solución de 1H-1,2,4-triazol (0,06 g) en DMF se le añadió hidruro sódico (0,04 g) mientras se refrigeraba con hielo, la mezcla se calentó a temperatura ambiente y después se agitó durante 0,5 h. A esta solución se le añadió la solución de 5-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidin-1-il]-2-fluorobenzonitrilo (0,30 g) en DMF, y la mezcla se calentó a reflujo durante 6 horas. La mezcla se enfrió a temperatura ambiente y después se vertió en agua, que después se extrajo dos veces con acetato de etilo. La fase orgánica se combinó, lo que después se lavó con agua y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. Después de eliminar el agente de secado por filtración, el disolvente se eliminó por destilación a presión reducida, y después el residuo se purificó por cromatografía sobre gel de sílice para producir 5-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidin-1-il]-2-(1H-1,2,4-triazol-1-il)benzonitrilo (0,18 g). RMN ¹H (DMSO-d₆) δ: 2,62-2,73 (1H, m), 2,95-3,03 (1H, m), 3,49-3,55 (2H, m), 3,90 (1H, d), 4,31 (1H, d), 7,09 (1H, dd), 7,29 (1H, d), 7,61 (1H, d), 7,68 (2H, d), 7,71 (1H, t), 8,26 (1H, s), 8,98 (1H, s)
- 25

30

Ejemplo sintético 7

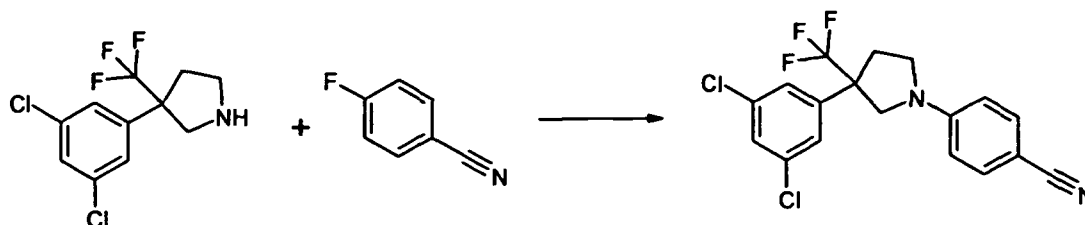
Síntesis de 1,3-dimetil-2-nitro-S-[1-(trifluorometil)vinil]benceno (N° 6-1)



5 Se disolvieron 5-bromo-1,3-dimetil-2-nitrobenceno (10,0 g), ácido [1-(trifluorometil)vinil]borónico (pureza: 60%, 13,4 g) y carbonato potásico (14,4 g) en el disolvente mixto de THF y agua, lo que después se desgasificó tres veces. A la solución se le añadió dicloro bis(trifenilfosfina)paladio (II) (1,5 g) y la mezcla se calentó a reflujo durante 3 horas en una atmósfera de argón. La mezcla se enfrió a temperatura ambiente y después se vertió en agua, que después se extrajo dos veces con acetato de etilo. La fase orgánica se combinó, lo que después se lavó con agua y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. Después de eliminar el agente de secado por filtración, el disolvente se eliminó por destilación a presión reducida y después el residuo se purificó por cromatografía sobre gel de sílice para producir 1,3-dimetil-2-nitro-5-[1-(trifluorometil)vinil]benceno (11,2 g). RMN ¹H (CDCl₃) δ: 2,34 (6H, s), 5,78-5,80 (1H, m), 6,03-6,04 (1H, m), 7,20 (2H, s).

Ejemplo sintético 8

Síntesis de 4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidin-1-il]benzonitrilo (N° 4-2)



15 A la solución de 3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidina (0,30 g) y 4-fluorobenzonitrilo (0,12 g) en DMSO (dimetilsulfóxido) se le añadió carbonato potásico (0,27 g) y la mezcla se calentó con agitación a 120 °C durante 6 horas. La mezcla se enfrió a temperatura ambiente y después se vertió en agua, que después se extrajo dos veces con acetato de etilo. La fase orgánica se combinó, lo que después se lavó con agua y se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. Después de eliminar el agente de secado por filtración, el disolvente se eliminó por destilación a presión reducida y después el residuo se purificó por cromatografía sobre gel de sílice para producir 4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)pirrolidin-1-il]benzonitrilo (0,05 g). RMN ¹H (CDCl₃) δ: 2,51-2,62 (1H, m), 2,86-2,94 (1H, m), 3,56-3,61 (2H, m), 3,80 (1H, d), 4,12 (1H, d), 6,59 (2H, d), 7,26 (2H, s a), 7,41 (1H, t), 7,52 (2H, d).

25 Los compuestos e intermedios de la fórmula (I) o de la fórmula (Ia) de la invención obtenidos por procedimientos iguales a los de los ejemplos sintéticos anteriores y de acuerdo con los procedimientos descritos anteriormente en detalle, así como sus valores físicos se muestran en las tablas 1-13. Cada compuesto obtenido en los ejemplos sintéticos anteriores también se muestra en cada tabla correspondiente.

En estas tablas, se usan las siguientes abreviaturas.

Me: metilo, Et: etilo, Pr: propilo, Bu: butilo, Ph: fenilo, Pen: pentilo.

30

Tabla 1

								
	(X)m	R	Y	R1	R2	A	W	p.f. (°C)
1-1	3,5-diCl	CF3	H	CF3CH2	H	CH	O	
1-2	3,5-diCl	CF3	H	2-PiridilCH2	H	CH	O	
1-3	3,5-diCl	CF3	CH3	CF3CH2	H	CH	O	
1-4	3,5-diCl	CF3	CH3	2-PiridilCH2	H	CH	O	
1-5	3,5-diCl	CF3	F	CF3CH2	H	CH	O	
1-6	3,5-diCl	CF3	F	2-PiridilCH2	H	CH	O	
1-7	3,5-diCl	CF3	Cl	CF3CH2	H	CH	O	
1-8	3,5-diCl	CF3	Cl	2-PiridilCH2	H	CH	O	
1-9	3,5-diCl	CF3	Br	CF3CH2	H	CH	O	
1-10	3,5-diCl	CF3	Br	2-PiridilCH2	H	CH	O	
1-11	3,5-diCl	CF3	Br	ciclo-Pr	H	CH	O	
1-12	3,5-diCl	CF3	Br	NCCH2CH2	H	CH	O	
1-13	3,5-diCl	CF3	I	CF3CH2	H	CH	O	
1-14	3,5-diCl	CF3	I	2-PiridilCH2	H	CH	O	
1-15	3,5-diCl	CF3	NO2	CF3CH2	H	CH	O	
1-16	3,5-diCl	CF3	NO2	2-PiridilCH2	H	CH	O	
1-17	3-Cl	CF3	NO2	2-PiridilCH2	H	CH	O	
1-18	3-Cl	CF3	NO2	CF3CH2	H	CH	O	
1-19	3-Br	CF3	NO2	2-PiridilCH2	H	CH	O	
1-20	3-CF3	CF3	NO2	2-PiridilCH2	H	CH	O	169-170
1-21	3-CF3	CF3	NO2	CF3CH2	H	CH	O	
1-22	3,5-diCF3	CF3	NO2	2-PiridilCH2	H	CH	O	
1-23	3,5-diCF3	CF3	NO2	CF3CH2	H	CH	O	
1-24	3-NO2	CF3	NO2	2-PiridilCH2	H	CH	O	176-179
1-25	3,5-diCl	CF3	CF3	2-PiridilCH2	H	CH	O	
1-26	3,5-diCl	CF3	CH30	2-PiridilCH2	H	CH	O	
1-27	3,5-diCl	CF3	CN	2-PiridilCH2	H	CH	O	
1-28	3,5-diCl	CF3	CF30	2-PiridilCH2	H	CH	O	
1-29	3,5-diCl	CF3	CH3S	2-PiridilCH2	H	CH	O	

ES 2 379 845 T3

(Continuación)

	(X)m	R	Y	R1	R2	A	W	p.f. (°C)
1-30	3,5-diCl	CF3	CH3S(O)	2-PiridilCH2	H	CH	O	
1-31	3,5-diCl	CF3	CH3S(O)2	2-PiridilCH2	H	CH	O	
1-32	3,5-diCl	CF3	CF3S	2-PiridilCH2	H	CH	O	
1-33	3,5-diCl	CF3	CF3S(O)	2-PiridilCH2	H	CH	O	
1-34	3,5-diCl	CF3	CF3S(O)2	2-PiridilCH2	H	CH	O	
1-35	3,5-diCl	CF3	OH	2-PiridilCH2	H	CH	O	
1-36	3,5-diCl	CF3	SH	2-PiridilCH2	H	CH	O	
1-37	3,5-diCl	CF3	NH2	2-PiridilCH2	H	CH	O	
1-38	3,5-diCl	CF3	NHCOCH3	2-PiridilCH2	H	CH	O	
1-39	3,5-diCl	CF3	NHCOCF3	2-PiridilCH2	H	CH	O	
1-40	3,5-diCl	CF3	NHCO2CH3	2-PiridilCH2	H	CH	O	
1-41	3,5-diCl	CF3	NHCO2CH2CCI3	2-PiridilCH2	H	CH	O	
1-42	3-CH3	CF3	H	2-PiridilCH2	H	CH	O	
1-43	3-CH3O	CF3	H	2-PiridilCH2	H	CH	O	
1-44	3-CN	CF3	H	2-PiridilCH2	H	CH	O	
1-45	3-CF3O	CF3	H	2-PiridilCH2	H	CH	O	
1-46	3-CH3S	CF3	H	2-PiridilCH2	H	CH	O	
1-47	3-CH3S(O)	CF3	H	2-PiridilCH2	H	CH	O	
1-48	3-CH3S(O)2	CF3	H	2-PiridilCH2	H	CH	O	
1-49	3-CF3S	CF3	H	2-PiridilCH2	H	CH	O	
1-50	3-CF3S(O)	CF3	H	2-PiridilCH2	H	CH	O	
1-51	3-CF3S(O)2	CF3	H	2-PiridilCH2	H	CH	O	
1-52	3-OH	CF3	H	2-PiridilCH2	H	CH	O	
1-53	3-SH	CF3	H	2-PiridilCH2	H	CH	O	
1-54	3,4-diCl	CF3	H	2-PiridilCH2	H	CH	O	
1-55	3,4-diCl	CF3	H	CF3CH2	H	CH	O	77-80
1-56	3,4,5-triCl	CF3	H	2-PiridilCH2	H	CH	O	
1-57	3,4,5-triCl	CF3	H	CF3CH2	H	CH	O	
1-58	3,5-diBr	CF3	H	2-PiridilCH2	H	CH	O	
1-59	3,5-diBr	CF3	H	CF3CH2	H	CH	O	
1-60	3,5-diMe-4-NO2	CF3	H	2-PiridilCH2	H	CH	O	
1-61	3,5-diMe-4-NO2	CF3	H	CF3CH2	H	CH	O	

ES 2 379 845 T3

(Continuación)

	(X)m	R	Y	R1	R2	A	W	p.f. (°C)
1-62	3,5-diCl	CF3	H	2-PiridilCH2	H	CH	S	
1-63	3,5-diCl	CF3	NO2	H	H	CH	O	
1-64	3,5-diCl	CF3	NO2	Me	H	CH	O	
1-65	3,5-diCl	CF3	NO2	iso-Pr	H	CH	O	
1-66	3,5-diCl	CF3	NO2	PhCH2	H	CH	O	
1-67	3,5-diCl	CF3	NO2	CH2CO2CH3	H	CH	O	
1-68	3,5-diCl	CF3	NO2	CH2CONMe	H	CH	O	
1-69	3,5-diCl	CF3	NO2	CH2(ciclo)Pr	H	CH	O	
1-70	3,5-diCl	CF3	NO2	S02Me	H	CH	O	
1-71	3,5-diCl	CF3	NO2	S02CF3	H	CH	O	
1-72	3,5-diCl	CF3	NO2	CH2=CHCH2	H	CH	O	
1-73	3,5-diCl	CF3	NO2	HCCCH2	H	CH	O	
1-74	3,5-diCl	CF3	NO2	CH2CN	H	CH	O	
1-75	3,5-diCl	CF3	NO2	C(Me)2CH2SCH3	H	CH	O	
1-76	3,5-diCl	CF3	NO2	2-F-Ph	H	CH	O	
1-77	3,5-diCl	CH3	H	2-PiridilCH2	H	CH	O	
1-78	3,5-diCl	CF3	H	2-PiridilCH2	H	N	O	
1-79	3,5-diCl	CF3	H	2-PiridilCH2	CH3	CH	O	
1-80	3-NO2	CF3	NO2	CF3CH2	H	CH	O	
1-81	3,5-diCl	CF3	Cl	2-PiridilCH2	H	CH	S	
1-82	2-diCl	CF3	NO2	2-PiridilCH2	H	CH	O	
1-83	2,3-diCl	CF3	NO2	2-PiridilCH2	H	CH	O	
1-84	3,5-diCl	CF3	NO2	3-PiridilCH2	H	CH	O	
1-85	3,5-diCl	CF3	NO2	4-PiridilCH2	H	CH	O	
1-86	3,5-diCl	CF3	NO2	2-(6-Cl-piridil)CH2	H	CH	O	
1-87	3,5-diCl	CF3	NO2	3-(6-Cl-piridil)CH2	H	CH	O	
1-88	3,5-diCl	CF3	NO2	2-PiridinilCH2	H	CH	O	
1-89	3,5-diCl	CF3	NO2	1-(1-etilpirrolidin-2-il)CH2	H	CH	O	
1-90	3,5-diCl	CF3	CF3	CF3CH2	H	CH	O	
1-91	3,5-diCl	CF3	CF3	2-(6-Cl-piridil)CH2	H	CH	O	
1-92	3,5-diCl	CF3	NO2	Me2NCH=		CH	O	
1-93	3,5-diCl	CF3	NO2	EtON=CH	H	CH	O	
1-94	3,5-diCl	CF3	C=NOCH3	2-PiridilCH2	H	CH	O	

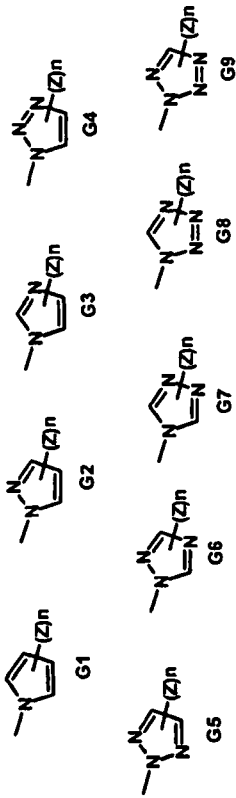
ES 2 379 845 T3

(Continuación)

	(X)m	R	Y	R1	R2	A	W	p.f. (°C)
1-95	4-Cl	CF3	NO2	2-PiridilCH2	H	CH	O	
1-96	4-Cl	CF3	NO2	CF3CH2	H	CH	O	
1-97	3,5-diCl	CF3	CN	CF3CH2	H	CH	O	
1-98	3,5-diCl	CF3	CF3	H	H	CH	O	
1-99	3,5-diCF3	CF3	CF3	2-PiridilCH2	H	CH	O	
1-100	3,5-diCF3	CF3	CF3	CF3CH2	H	CH	O	
1-101	3,5-diCl	CF3	H	CF3CH2	H	N	O	
1-102	3,4,5-triCl	CF3	CF3	[2-PiridilCH2	H	CH	O	

Tabla 2

		R	Y	G	Z	A	p.f. (°C)
2-1	(X)m	CF3	H	G1	H	H	
2-2	3,5-diCl	CF3	H	G2	H	CH	
2-3	3,5-diCl	CF3	H	G3	H	CH	
2-4	3,5-diCl	CF3	H	G4	H	CH	
2-5	3,5-diCl	CF3	H	G5	H	CH	
2-6	3,5-diCl	CF3	H	G6	H	CH	
2-7	3,5-diCl	CF3	H	G7	H	CH	
2-8	3,5-diCl	CF3	H	G8	H	CH	
2-9	3,5-diCl	CF3	H	G9	H	CH	
2-10	3,5-diCl	CF3	F	G6	H	CH	
2-11	3,5-diCl	CF3	F	G8	H	CH	
2-12	3,5-diCl	CF3	F	G9	H	CH	
2-13	3,5-diCl	CF3	Cl	G6	H	CH	
2-14	3,5-diCl	CF3	Cl	G8	H	CH	
2-15	3,5-diCl	CF3	Cl	G9	H	CH	
2-16	3,5-diCl	CF3	Br	G1	H	CH	
2-17	3,5-diCl	CF3	Br	G2	H	CH	



(Continuación)

	(X)m	R	Y	G	Z	A	p.f. (°C)
2-18	3,5-diCl	CF3	Br	G3	H	CH	
2-19	3,5-diCl	CF3	Br	G4	H	CH	
2-20	3,5-diCl	CF3	Br	G5	H	CH	
2-21	3,5-diCl	CF3	Br	G6	H	CH	
2-22	3,5-diCl	CF3	Br	G7	H	CH	
2-23	3,5-diCl	CF3	Br	G8	H	CH	193-194
2-24	3,5-diCl	CF3	Br	G9	H	CH	
2-25	3,5-diCl	CF3	I	G6	H	CH	
2-26	3,5-diCl	CF3	I	G8	H	CH	
2-27	3,5-diCl	CF3	I	G9	H	CH	
2-28	3,5-diCl	CF3	Me	G6	H	CH	
2-29	3,5-diCl	CF3	Me	G8	H	CH	
2-30	3,5-diCl	CF3	CF3	G6	H	CH	
2-31	3,5-diCl	CF3	CF3	G8	H	CH	
2-32	3,5-diCl	CF3	NO2	G6	H	CH	
2-33	3,5-diCl	CF3	NO2	G8	H	CH	
2-34	3,5-diCl	CF3	CN	G1	H	CH	
2-35	3,5-diCl	CF3	CN	G2	H	CH	
2-36	3,5-diCl	CF3	CN	G3	H	CH	
2-37	3,5-diCl	CF3	CN	G4	H	CH	
2-38	3,5-diCl	CF3	CN	G5	H	CH	

(Continuación)

	(X)m	R	Y	G	Z	A	p.f. (°C)
2-39	3,5-diCl	CF3	CN	G6	H	CH	
2-40	3,5-diCl	CF3	CN	G7	H	CH	
2-41	3,5-diCl	CF3	CN	G8	H	CH	192-193
2-42	3,5-diCl	CF3	CN	G9	H	CH	
2-43	3,5-diCl	CF3	NO2	G6	H	CH	
2-44	3,5-diCl	CF3	NO2	G8	H	CH	
2-45	3,5-diCl	CF3	CH3	G6	H	CH	
2-46	3,5-diCl	CF3	MeS	G6	H	CH	
2-47	3,5-diCl	CF3	MeSO	G6	H	CH	
2-48	3,5-diCl	CF3	MeSO2	G6	H	CH	
2-49	3,5-diCl	CF3	CF3S	G6	H	CH	
2-50	3,5-diCl	CF3	CF3S(O)	G6	H	CH	
2-51	3,5-diCl	CF3	CF3S(O)2	G6	H	CH	
2-52	3,5-diCl	CF3	OCH3	G6	H	CH	
2-53	3,5-diCl	CF3	OCF3	G6	H	CH	
2-54	3,5-diCl	CF3	OH	G6	H	CH	
2-55	3,5-diCl	CF3	SH	G6	H	CH	
2-56	3,5-diCl	CF3	NH2	G6	H	CH	
2-57	3,5-diCl	CF3	NHCOCH3	G6	H	CH	
2-58	3,5-diCl	CF3	NHCO2CH3	G6	H	CH	
2-59	3,5-diCl	CF3	NHCO2CH2CCl3	G6	H	CH	
2-60	3,5-diCl	CF3	CN	G2	3-NO2	CH	

(Continuación)

	(X)m	R	Y	G	Z	A	p.f. (°C)
2-61	3,5-diCl	CF3	CN	G2	3-CN	CH	
2-62	3,5-diCl	CF3	CN	G6	3-NO2	CH	
2-63	3,5-diCl	CF3	CN	G6	3-CN	CH	
2-64	3,5-diCl	CF3	CN	G2	Cl	CH	
2-65	3,5-diCl	CF3	CN	G2	Br	CH	
2-66	3,5-diCl	CF3	CN	G2	CH3	CH	
2-67	3,5-diCl	CF3	CN	G2	CF3	CH	
2-68	3-Cl	CF3	CN	G6	H	CH	
2-69	3-Cl	CF3	CN	G8	H	CH	
2-70	3-CF3	CF3	CN	G6	H	CH	
2-71	3-CF3	CF3	CN	G8	H	CH	
2-72	3,5-diCF3	CF3	CN	G6	H	CH	
2-73	3,5-diCF3	CF3	CN	G8	H	CH	
2-74	3-NO2	CF3	CN	G6	H	CH	
2-75	3-NO2	CF3	CN	G8	H	CH	
2-76	3,4-diCl	CF3	CN	G6	H	CH	
2-77	3,4-diCl	CF3	CN	G6	H	CH	
2-78	3,5-diBr	CF3	CN	G6	H	CH	
2-79	3,5-diBr	CF3	CN	G8	H	CH	
2-80	3,5-diBr	CF3	Br	G6	H	CH	
2-81	3,5-diBr	CF3	Br	G8	H	CH	
2-82	3,4,5-triCl	CF3	CN	G6	H	CH	

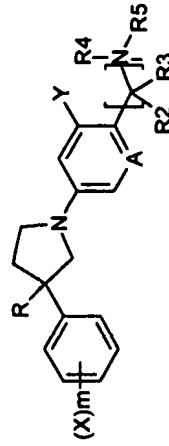
(Continuación)

	(X)m	R	Y	G	Z	A	p.f. (°C)
2-83	3,4,5-triCl	CF3	CN	G8	H	CH	
2-84	3,4,5-triCl	CF3	Br	G6	H	CH	
2-85	3,4,5-triCl	CF3	Br	G8	H	CH	
2-86	3,5-diMe-4-NO2	CF3	CN	G8	H	CH	
2-87	3-CH3	CF3	CN	G6	H	CH	
2-88	3-CH3O	CF3	CN	G6	H	CH	
2-89	3-CN	CF3	CN	G6	H	CH	
2-90	3-CF3O	CF3	CN	G6	H	CH	
2-91	3-CF3O	CF3	CN	G8	H	CH	
2-92	3-CH3S	CF3	CN	G6	H	CH	
2-93	3-CH3S	CF3	CN	G8	H	CH	
2-94	3-CH3S(O)	CF3	CN	G6	H	CH	
2-95	3-CH3S(O)2	CF3	CN	G6	H	CH	
2-96	3-CF3S	CF3	CN	G6	H	CH	
2-97	3-CF3S(O)	CF3	CN	G6	H	CH	
2-98	3-CF3S(O)2	CF3	CN	G6	H	CH	
2-99	3-OH	CF3	CN	G6	H	CH	
2-100	3-SH	CF3	CN	G6	H	CH	
2-10	1,3,5-diCl	CH3	Br	G6	H	CH	
2-102	3,5-diCl	CH3	Br	G8	H	CH	
2-103	3,5-diCl	CF3	Br	G6	H	N	
2-104	3,5-diCl	CF3	Br	G8	H	N	

(Continuación)

	(X)m	R	Y	G	Z	A	p.f. (°C)
2-105	3,5-diCl	CF3	CN	G6	H	N	
2-106	3,5-diCl	CF3	CN	G8	H	N	
2-107	3,5-diCl	CF3	C=NOCH3	G6	H	CH	
2-108	3,5-diCl	CF3	C=NOCH3	G8	H	CH	
2-109	3,5-diCl	CF3	NHSO2CH3	G6	H	CH	
2-110	3,5-diCl	CF3	NHSO2CH3	G8	H	CH	
2-111	3,5-diCl	CF3	NHSO2CF3	G6	H	CH	
2-112	3,5-diCl	CF3	NHSO2CF3	G8	H	CH	

Tabla 3



	(X)m	R	Y	R2	R3	R4	R5	A	1	p.f. (°C)
3-1	3,5-diCl	CF3	H	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-2	3,5-diCl	CF3	H	H	H	H	COC2H5	CH	1	
3-3	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-4	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-5	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COC2H5	CH	1	
3-6	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	CO(i-Pr)	CH	1	

(Continuación)

	(X)m	R	Y	R2	R3	R4	R5	A	1	p.f. (°C)
3-7	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	CO2-piridilo	CH	1	
3-8	3,5-diCl	CF3	F	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-9	3,5-diCl	CF3	I	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-10	3,5-diCl	CF3	NO2	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-11	3,5-diCl	CF3	CH3	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-12	3,5-diCl	CF3	MeS	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-13	3,5-diCl	CF3	MeSO	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-14	3,5-diCl	CF3	MeSO2	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-15	3,5-diCl	CF3	CF3S	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-16	3,5-diCl	CF3	CF3S(O)	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-17	3,5-Cl	CF3	CF3S(O)2	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-18	3,5-diCl	CF3	OCH3	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-19	3,5-diCl	CF3	OCF3	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-20	3,5-diCl	CF3	OH	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-21	3,5-diCl	CF3	SH	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-22	3,5-diCl	CF3	NH2	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-23	3,5-diCl	CF3	NHCOCH3	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-24	3,5-diCl	CF3	NHCO2CH3	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-25	3,5-diCl	CF3	NHCO2CH2CCl3	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-26	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	Me	CO2-piridil	CH	1	
3-27	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	Me	COCH3	CH	1	

(Continuación)

	(X)m	R	Y	R2	R3	R4	R5	A	1	p.f. (°C)
3-28	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	Et	COCH3	CH	1	
3-29	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	vinilo	COCH3	CH	1	
3-30	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	propargilo	COCH3	CH	1	
3-31	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	CH2Ph	COCH3	CH	1	
3-32	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	CN	COCH3	CH	1	
3-33	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	CH2CF3	COCH3	CH	1	
3-34	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	cicloPr	COCH3	CH	1	
3-35	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	COCH3	COCH3	CH	1	
3-36	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	H	COC2H5	CH	1	
3-37	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	H	COC2F5	CH	1	
3-38	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	H	COPh	CH	1	
3-39	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	H	CO2-piridilo	CH	1	
3-40	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	H	CONMe2	CH	1	
3-41	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	H	CO2Me	CH	1	
3-42	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	H	COSMe	CH	1	
3-43	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	Me	COCH3	CH	1	
3-44	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	2-piridilCO	COCH3	CH	1	
3-45	3,5-diBr	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-46	3-Cl	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-47	3-CF3	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-48	3,5-diCF3	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-49	3,4,5-triCl	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	CH	1	

(Continuación)

	(X)m	R	Y	R2	R3	R4	R5	A	1	p.f. (°C)
3-50	3,5-diMe-4-NO2	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-51	3-NO2	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-52	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	N	1	
3-53	3-CH3	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-54	3-CH30	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-55	3-CN	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-56	3-CF30	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-57	3-CH3S	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-58	3-CH3S(O)	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-59	3-CH3S(O)2	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-60	3-CF3S	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-61	3-CF3S(O)	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-62	3-CF3S(O)2	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-63	3-OH	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-64	3-SH	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-65	3,5-diCl	CF3	Cl	CN	H	H	COCH3	CH	1	
3-66	3,5-diCl	CF3	Cl	Me	H	H	COCH3	CH	1	
3-67	3,5-diCl	CF3	Cl	Me	Me	H	COCH3	CH	1	
3-68	3,5-diCl	CF3	Cl	ciclo-Pr	H	H	COCH3	CH	1	
3-69	3,5-diCl	CF3	Cl	CF3	H	H	COCH3	CH	1	
3-70	3,5-diCl	CF3	Cl	CO2Me	H	H	COCH3	CH	1	
3-71	3,5-diCl	CF3	Cl	CH=CH2	H	H	COCH3	CH	1	

(Continuación)

	(X)m	R	Y	R2	R3	R4	R5	A	1	p.f. (°C)
3-72	3,5-diCl	CF3	Cl	CH2C	H2	H	COCH3	CH	1	
3-73	3,5-diCl	CF3	Cl	CCH	H	H	COCH3	CH	1	
3-74	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COEt	CH	1	
3-75	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPr-n	CH	1	
3-76	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPr-iso	CH	1	
3-77	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COBu-terc	CH	1	
3-78	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COCF3	CH	1	
3-79	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh	CH	1	
3-80	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPiridil-2	CH	1	
3-81	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPiridil-3	CH	1	
3-82	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPiridilCO-4	CH	1	
3-83	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-F-2	CH	1	
3-84	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-F-3	CH	1	
3-85	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-F-4	CH	1	
3-86	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-Cl-2	CH	1	
3-87	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-Cl-3	CH	1	
3-88	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-Cl-4	CH	1	
3-89	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-Br-2	CH	1	
3-90	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-Me-2	CH	1	
3-91	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	Covinilo	CH	1	
3-92	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COpropargilo	CH	1	
3-93	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	MeSO2	CH	1	

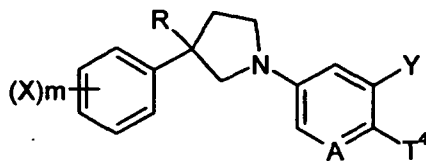
(Continuación)

	(X)m	R	Y	R2	R3	R4	R5	A	1	p.f. (°C)
3-94	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	CF3SO2	CH	1	
3-95	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	CONHMe	CH	1	
396	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	CONMe2	CH	1	
3-97	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	CO2Me	CH	1	
3-98	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	C(O)SMe	CH	1	
3-99	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	CSMe	CH	1	
3-100	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	CON(Me)OMe	CH	1	
3-101	3,5-diCl	CH3	Br	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-102	3,5-diCl	CH3	CF3	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-103	3,5-diCl	CH3	CN	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-104	3,5-diCl	CH3	NH2	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-105	3,5-diCl	CH3	NHCOCH3	H	H	H	COCH3	CH	1	
3106	3,5-diCl	CH3	NHCOCF3	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-107	3,5-diCl	CH3	NHCO2CH3	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-106	3,5-diCl	CH3	NHCO2CH2CCl3	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-109	3,5-diCl	CH3	NHSO2CH3	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-110	3,5-diCl	CH3	NHSO2CF3	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-111	3,5-diCl	CH3	C=NOCH3	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-112	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COCH3	CH		
3-113	3,5-diCF3	CF3	CF3	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-114	3,5-diCF3	CF3	CF3	H	H	H	COC2H5	CH	1	
3-115	3,5-diCF3	CF3	CF3	H	H	H	COPr-ciclo	CH	1	

(Continuación)

	(X)m	R	Y	R2	R3	R4	R5	A	1	p.f. (°C)
3-116	3,4,5-triCl	CF3	CF3	H	H	H	COCH3	CH	1	
3-117	3,4,5-triCl	CF3	CF3	H	H	H	COC2H5	CH	1	
3-118	3,4,5-triCl	CF3	CF3	H	H	H	COPr-ciclo	CH	1	
3-119	3,4-diCl, 5-CF3	CF3	CF3	H	H	H	COCH3	CH	1	

Tabla 4



	(X)m	R	Y	T ⁴	A	p.f. (C)
4-1	3,5-diCl	CF ₃	H	NO ₂	CH	
4-2	3,5-diCl	CF ₃	H	CN	CH	
4-3	3,5-diCl	CF ₃	H	NH ₂	CH	
4-4	3,5-diCl	CF ₃	H	CO ₂ Et	CH	161-163
4-5	3,5-diCl	CF ₃	H	CO ₂ H	CH	
4-6	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	CH	
4-7	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ H	CH	
4-8	3,5-diCl	CF ₃	NH ₂	CO ₂ Me	CH	
4-9	3,5-diCl	CF ₃	F	CO ₂ Me	CH	
4-10	3,5-diCl	CF ₃	Cl	CO ₂ Me	CH	
4-11	3,5-diCl	CF ₃	Cl	CO ₂ Bu-t	CH	
4-12	3,5-diCl	CF ₃	Cl	CO ₂ H	CH	
4-13	3,5-diCl	CF ₃	Br	CO ₂ Me	CH	
4-14	3,5-diCl	CF ₃	I	CO ₂ Me	CH	
4-15	3,5-diCl	CF ₃	CH ₃	CO ₂ Me	CH	
4-16	3,5-diCl	CF ₃	Cl	CH ₃	CH	
4-17	3,5-diCl	CF ₃	CN	F	CH	184-186
4-18	3,5-diCl	CF ₃	CH ₃	NO ₂	CH	
4-19	3,5-diCl	CF ₃	CH ₃	NH ₂	CH	
4-20	3,5-diCl	CF ₃	Br	NO ₂	CH	
4-21	3,5-diCl	CF ₃	Br	NH ₂	CH	
4-22	3-CF ₃	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	CH	146-148
4-23	3-CF ₃	CF ₃	NO ₂	CO ₂ H	CH	
4-24	1,3,5-diCF ₃	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	CH	
4-25	3,5-diCF ₃	CF ₃	NO ₂	CO ₂ H	CH	
4-26	3,4-diCl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	CH	
4-27	3,4-diCl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ H	CH	
4-28	3-Cl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	CH	142-144
4-29	3-Cl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ H	CH	

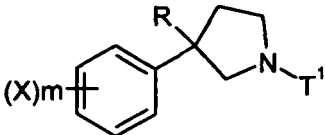
ES 2 379 845 T3

(Continuación)

	(X)m	R	Y	T ⁴	A	p.f. (C)
4-30	3,5-diBr	CF3	NO2	CO2Me	CH	
4-31	3,4,5-triCl	CF3	NO2	CO2Me	CH	
4-32	3,5-diMe-4-NO2	CF3	NO2	CO2Me	CH	
4-33	3-NO2	CF3	NO2	CO2Me	CH	
4-34	3-CH3	CF3	NO2	CO2Me	CH	
4-35	3-CH3O	CF3	NO2	CO2Me	CH	
4-36	3-CN	CF3	NO2	CO2Me	CH	
4-37	3-CF3O	CF3	NO2	CO2Me	CH	
4-38	3-CH3S	CF3	NO2	CO2Me	CH	
4-39	3-CH3S(O)	CF3	NO2	CO2Me	CH	
4-40	3-CH3S(O)2	CF3	NO2	CO2Me	CH	
4-41	3-CF3S	CF3	NO2	CO2Me	CH	
4-42	3-CF3S(O)	CF3	NO2	CO2Me	CH	
4-43	3-CF3S(O)2	CF3	NO2	CO2Me	CH	
4-44	3-OH	CF3	NO2	CO2Me	CH	
4-45	3-SH	CF3	NO2	CO2Me	CH	
4-46	3,5-diCl	CF3	H	CO2Me	N	
4-47	3-NO2	CF3	NO2	CO2H	CH	
4-48	3,4,5-triCl	CF3	NO2	CO2H	CH	
4-49	2-Cl	CF3	NO2	CO2Me	CH	
4-50	2-Cl	CF3	NO2	CO2H	CH	
4-51	4-Cl	CF3	NO2	CO2Me	CH	
4-52	4-Cl	CF3	NO2	CO2H	CH	
4-53	3,5-diCl	CF3	CF3	CO2Et	CH	
4-54	3,5-diCl	CF3	CF3	CO2H	CH	
4-55	3,5-diMe-4-NO2	CF3	NO2	CO2H	CH	
4-56	3,4,5-triCl	CF3	NO2	CO2Me	CH	
4-57	3,5-diCl	CF3	CN	CO2H	CH	
4-58	3,5-diCl	CF3	CN	CO2Me	CH	
4-59	3,5-diCl	CF3	H	CO2Bu-t	N	
4-60	3,5-diCl	CF3	H	CO2H	N	
4-61	3,5-diCF3	CF3	CF3	CO2Et	CH	
4-62	3,5-diCl	CF3	CF3	F	CH	

4-63	3,5-diCl	CF3	CF3	NO2	CH	
4-64	3,5-diCl	CF3	CF3	NH2	CH	
4-65	3,5-diCl	CF3	F	CO2Et	CH	
4-66	3,4,5-triCl	CF3	CF3	CO2Et	CH	
4-67	3,4,5-triCl	CF3	CF3	CO2H	CH	

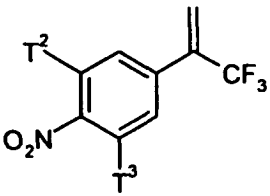
Tabla 5

				
	(X)m	R	T ¹	p.f. (°C)
5-1	2-Cl	CF3	CH ₂ Ph	
5-2	2-Cl	CF3	H	
5-3	3-Cl	CF3	CH ₂ Ph	
5-4	3-Cl	CF3	H	
5-5	3-Cl	CF3	CH ₂ Ph	
5-6	4-Cl	CF3	H	
5-7	2,3-diCl	CF3	CH ₂ Ph	
5-8	2,3-diCl	CF3	H	
5-9	3,4-diCl	CF3	CH ₂ Ph	
5-10	3,4-diCl	CF3	H	
5-11	3,5-diCl	CF3	CH ₂ Ph	
5-12	3,5-diCl	CF3	H	
5-13	3,5-diCl	CF3	H, sal de HCl	
5-14	3,4,5-triCl	CF3	CH ₂ Ph	
5-15	3,4,5-triCl	CF3	H	
5-16	3-CF3	CF3	CH ₂ Ph	
5-17	3-CF3	CF3	H	
5-18	3,5-diCF3	CF3	CH ₂ Ph	
5-19	3,5-diCF3	CF3	H	
5-20	3-Br	CF3	CH ₂ Ph	
5-21	3-Br	CF3	H	

(Continuación)

	(X)m	R	T ¹	p.f. (°C)
5-22	3,5-diBr	CF ₃	CH ₂ Ph	
5-23	3,5-diBr	CF ₃	H	
5-24	3-NO ₂	CF ₃	CH ₂ Ph	
5-25	3-NO ₂	CF ₃	H	
5-26	3,5-diMe-4-NO ₂	CF ₃	CH ₂ Ph	
5-27	3,5-diMe-4-NO ₂	CF ₃	H	
5-28	3-CN	CF ₃	CH ₂ Ph	
5-29	3-CN	CF ₃	H	
5-30	3-OCF ₃	CF ₃	CH ₂ Ph	
5-31	3-OCF ₃	CF ₃	H	
5-32	3-SCF ₃	CF ₃	CH ₂ Ph	
5-33	3-SCF ₃	CF ₃	H	
5-34	3-S(O)CF ₃	CF ₃	CH ₂ Ph	
5-35	3-S(O)CF ₃	CF ₃	H	
5-36	3-S(O) ₂ CF ₃	CF ₃	CH ₂ Ph	
5-37	3-S(O) ₂ CF ₃	CF ₃	H	
5-38	3,4-diCl, 5-CF ₃	CF ₃	CH ₂ Ph	
5-39	3,4-diCl, 5-CF ₃	CF ₃	H	

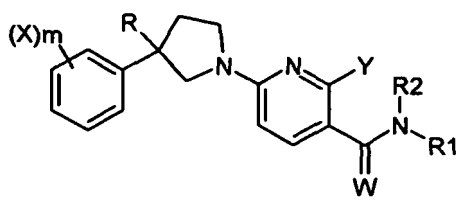
Tabla 6

			
	T2	T3	p.f. (°C)
6-1	CH ₃	CH ₃	
6-2	CH ₃	CH ₂ CH ₃	
6-3	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	
6-4	n-Pr	n-Pr	
6-5	iso-Pr	iso-Pr	
6-6	ciclo-Pr	ciclo-Pr	
6-7	n-Bu	n-Bu	

(Continuación)

	T2	T3	p.f. (°C)
6-8	terc-Bu	terc-Bu	
6-9	n-Pen	n-Pen	

Tabla 7

							
	(X)m	R	Y	R1	R2	W	p.f. (°C)
7-1	3,5-diCl	CF3	H	CF3CH2	H	O	
7-2	3,5-diCl	CF3	H	2-PiridilCH2	H	O	
7-3	3,5-diCl	CF3	CH3	CF3CH2	H	O	
7-4	3,5-diCl	CF3	CH3	2-PiridilCH2	H	O	
7-5	3,5-diCl	CF3	F	CF3CH2	H	O	
7-6	3,5-diCl	CF3	F	2-PiridilCH2	H	O	
7-7	3,5-diCl	CF3	Cl	CF3CH2	H	O	
7-8	3,5-diCl	CF3	Cl	2-PiridilCH2	H	O	
7-9	3,5-diCl	CF3	Br	CF3CH2	H	O	
7-10	3,5-diCl	CF3	Br	2-PiridilCH2	H	O	
7-11	3,5-diCl	CF3	Br	ciclo-Pr	H	O	
7-12	3,5-diCl	CF3	Br	NCCH2CH2	H	O	
7-13	3,5-diCl	CF3	I	CF3CH2	H	O	
7-14	3,5-diCl	CF3	I	2-PiridilCH2	H	O	
7-15	3,5-diCl	CF3	NO2	CF3CH2	H	O	
7-16	3,5-diCl	CF3	NO2	2-PiridilCH2	H	O	
7-17	3-Cl	CF3	NO2	2-PiridilCH2	H	O	
7-18	3-Cl	CF3	NO2	CF3CH2	H	O	
7-19	3-Br	CF3	NO2	2-PiridilCH2	H	O	
7-20	3-CF3	CF3	NO2	2-PiridilCH2	H	O	
7-21	3-CF3	CF3	NO2	CF3CH2	H	O	
7-22	3,5-diCF3	CF3	NO2	2-PiridilCH2	H	O	
7-23	3,5-diCF3	CF3	NO2	CF3CH2	H	O	

ES 2 379 845 T3

(Continuación)

	(X)m	R	Y	R1	R2	W	p.f. (°C)
7-24	3-NO2	CF3	NO2	2-PiridilCH2	H	O	
7-25	3,5-diCl	CF3	CF3	2-PiridilCH2	H	O	
7-26	3,5-diCl	CF3	CF3	CF3CH2	H	O	
7-27	3,5-diCl	CF3	CH3O	2-PiridilCH2	H	O	
7-28	3,5-diCl	CF3	CN	2-PiridilCH2	H	O	
7-29	3,5-diCl	CF3	CF3O	2-PiridilCH2	H	O	
7-30	3,5-diCl	CF3	CH3S	2-PiridilCH2	H	O	
7-31	3,5-diCl	CF3	CH3S(O)	2-PiridilCH2	H	O	
7-32	3,5-diCl	CF3	CH3S(O)2	2-PiridilCH2	H	O	
7-33	3,5-diCl	CF3	CF3S	2-PiridilCH2	H	O	
7-34	3,5-diCl	CF3	CF3S(O)	2-PiridilCH2	H	O	
7-35	3,5-diCl	CF3	CF3S(O)2	2-PiridilCH2	H	O	
7-36	13,5-diCl	CF3	OH	2-PiridilCH2	H	O	
7-37	3,5-diCl	CF3	SH	2-PiridilCH2	H	O	
7-38	3,5-diCl	CF3	NH2	2-PyridilCH2	H	O	
7-39	3,5-diCl	CF3	NHCOCH3	2-PiridilCH2	H	O	
7-40	3,5-diCl	CF3	NHCOCF3	2-PiridilCH2	H	O	
7-41	3,5-diCl	CF3	NHCO2CH3	2-PiridilCH2	H	O	
7-42	3,5-diCl	CF3	NHCO2CH2CCI3	2-PiridilCH2	H	O	
7-43	3-CH3	CF3	H	2-PiridilCH2	H	O	
7-44	3-CH3O	CF3	H	2-PiridilCH2	H	O	
7-45	3-CN	CF3	H	2-PiridilCH2	H	O	
7-46	3-CF3O	CF3	H	2-PiridilCH2	H	O	
7-47	3-CH3S	CF3	H	2-PiridilCH2	H	O	
7-48	3-CH3S(O)	CF3	H	2-PiridilCH2	H	O	
7-49	3-CH3S(O)2	CF3	H	12-PiridilCH2	H	O	
7-50	3-CF3S	CF3	H	2-PiridilCH2	H	O	
7-51	3-CF3S(O)	CF3	H	2-PiridilCH2	H	O	
7-52	3-CF3S(O)2	CF3	H	2-PiridilCH2	H	O	
7-53	3-OH	CF3	H	2-PiridilCH2	H	O	
7-54	3-SH	CF3	H	2-PiridilCH2	H	O	
7-55	3,4-diCl	CF3	H	2-PiridilCH2	H	O	

ES 2 379 845 T3

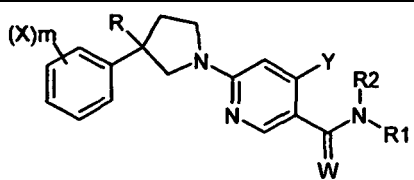
(Continuación)

	(X)m	R	Y	R1	R2	W	p.f. (°C)
7-56	3,4-diCl	CF3	H	CF3CH2	H	O	
7-57	3,4,5-triCl	CF3	H	2-PiridilCH2	H	O	
7-58	3,4,5-triCl	CF3	H	CF3CH2	H	O	
7-59	3,5-diBr	CF3	H	2-PiridilCH2	H	O	
7-60	3,5-diBr	CF3	H	CF3CH2	H	O	
7-61	3,5-diMe-4-NO2	CF3	H	2-PiridilCH2	H	O	
7-62	3,5-diMe-4-NO2	CF3	H	CF3CH2	H	O	
7-63	3,5-diCl	CF3	H	2-PiridilCH2	H	S	
7-64	3,5-diCl	CF3	NO2	H	H	O	
7-65	3,5-diCl	CF3	NO2	Me	H	O	
7-66	3,5-diCl	CF3	NO2	iso-Pr	H	O	
7-67	3,5-diCl	CF3	NO2	PhCH2	H	O	
7-68	3,5-diCl	CF3	NO2	CH2CO2CH3	H	O	
7-69	3,5-diCl	CF3	NO2	CH2CONMe	H	O	
7-70	3,5-diCl	CF3	NO2	CH2(ciclo)Pr	H	O	
7-71	3,5-diCl	CF3	NO2	S02Me	H	O	
7-72	3,5-diCl	CF3	NO2	S02CF3	H	O	
7-73	3,5-diCl	CF3	NO2	CH2=CHCH2	H	O	
7-74	3,5-diCl	CF3	NO2	HCCCH2	H	O	
7-75	3,5-diCl	CF3	NO2	CH2CN	H	O	
7-76	3,5-diCl	ICF3	NO2	C(Me)2CH2SCH3	H	O	
7-77	3,5-diCl	CF3	NO2	2-F-Ph	H	O	
7-78	3,5-diCl	CH3	H	2-PiridilCH2	H	O	
7-79	3,5-diCl	CF3	H	2-PiridilCH2	CH3	O	
7-80	3-NO2	CF3	NO2	CF3CH2	H	O	
7-81	3,5-diCl	CF3	Cl	2-PiridilCH2	H	S	
7-82	2-diCl	CF3	NO2	2-PiridilCH2	H	O	
7-83	2,3-diCl	CF3	NO2	2-PiridilCH2	H	O	
7-84	3,5-diCl	CF3	NO2	3-PiridilCH2	H	O	
7-85	3,5-diCl	CF3	NO2	4-PiridilCH2	H	O	
7-86	3,5-diCl	CF3	NO2	2-(6-Cl-piridil)CH2	H	O	
7-87	3,5-diCl	CF3	NO2	3-(6-Cl-piridil)CH2	H	O	
7-88	3,5-diCl	CF3	NO2	2-PiridinilCH2	H	O	

(Continuación)

	(X)m	R	Y	R1	R2	W	p.f. (°C)
7-89	3,5-diCl	CF3	NO2	1-(1-etilpirrolidin-2-il) CH2	H	O	
7-90	3,5-diCl	CF3	CF3	CF3CH2	H	O	
7-91	3,5-diCl	CF3	CF3	2-(6-Cl-piridil)CH2	H	O	
7-92	3,5-diCl	CF3	NO2	Me2NCH=		O	
7-93	3,5-diCl	CF3	NO2	EtON=CH	H	O	
7-94	3,5-diCl,	CF3	C=NOCH3	2-PiridilCH2	H	O	
7-95	4-Cl	CF3	NO2	2-PiridilCH2	H	O	
7-96	4-Cl	CF3	NO2	CF3CH2	H	O	
7-97	3,5-diCl	CF3	CN	CF3CH2	H	O	
7-98	3,5-diCl	CF3	CF3	H	H	O	
7-99	3,5-diCF3	CF3	CF3	2-PiridilCH2	H	O	
7-100	3,5-diCF3	CF3	CF3	CF3CH2	H	O	

Tabla 8

							
	(X)m	R	Y	R1	R2	W	p.f. (°C)
8-1	3,5-diCl	CF3	CH3	CF3CH2	H	O	
8-2	3,5-diCl	CF3	CH3	2-PiridilCH2	H	O	
8-3	3,5-diCl	CF3	F	CF3CH2	H	O	
8-4	3,5-diCl	CF3	F	2-PiridilCH2	H	O	
8-5	3,5-diCl	CF3	Cl	CF3CH2	H	O	
8-6	3,5-diCl	CF3	Cl	2-PiridilCH2	H	O	
8-7	3,5-diCl	CF3	Br	CF3CH2	H	O	
8-8	3,5-diCl	CF3	Br	2-PiridilCH2	H	O	
8-9	3,5-diCl	CF3	Br	ciclo-Pr	H	O	
8-10	3,5-diCl	CF3	Br	NCCH2CH2	H	O	
8-11	3,5-diCl	CF3	I	CF3CH2	H	O	
8-12	3,5-diCl	CF3	I	2-PiridilCH2	H	O	
8-13	3,5-diCl	CF3	NO2	CF3CH2	H	O	

ES 2 379 845 T3

(Continuación)

	(X)m	R	Y	R1	R2	W	p.f. (°C)
8-14	3,5-diCl	CF3	NO2	2-PiridilCH2	H	O	
8-15	3-Cl	CF3	NO2	2-PiridilCH2	H	O	
8-16	3-Cl	CF3	NO2	CF3CH2	H	O	
8-17	3-Br	CF3	NO2	2-PiridilCH2	H	O	
8-18	3-CF3	CF3	NO2	2-PiridilCH2	H	O	
8-19	3-CF3	CF3	NO2	CF3CH2	H	O	
8-20	3,5-diCF3	CF3	NO2	2-PiridilCH2	H	O	
8-21	3,5-diCF3	CF3	NO2	CF3CH2	H	O	
8-22	3-NO2	CF3	NO2	2-PiridilCH2	H	O	
8-23	3,5-diCl	CF3	CF3	2-PiridilCH2	H	O	
8-24	3,5-diCl	CF3	CF3	CF3CH2	H	O	
8-25	3,5-diCl	CF3	CF3	H	H	O	
8-26	3,5-diCl	CF3	CH3O	2-PiridilCH2	H	O	
8-27	3,5-diCl	CF3	CN	2-PiridilCH2	H	O	
8-28	3,5-diCl	CF3	CF3O	2-PiridilCH2	H	O	
8-29	3,5-diCl	CF3	CH3S	2-PiridilCH2	H	O	
8-30	3,5-diCl	CF3	CH3S(O)	2-PiridilCH2	H	O	
8-31	3,5-diCl	CF3	CH3S(O)2	2-PiridilCH2	H	O	
8-32	3,5-diCl	CF3	CF3S	2-PiridilCH2	H	O	
8-33	3,5-diCl	CF3	CF3S(O)	2-PiridilCH2	H	O	
8-34	3,5-diCl	CF3	CF3S(O)2	2-PiridilCH2	H	O	
8-35	3,5-diCl	CF3	OH	2-PiridilCH2	H	O	
8-36	3,5-diCl	CF3	SH	2-PiridilCH2	H	O	
8-37	3,5-diCl	CF3	NH2	2-PiridilCH2	H	O	
8-38	3,5-diCl	CF3	NHCOCH3	2-PiridilCH2	H	O	
8-39	3,5-diCl	CF3	NHCOCF3	2-PiridilCH2	H	O	
8-40	3,5-diCl	CF3	NHCO2CH3	2-PiridilCH2	H	O	
8-41	3,5-diCl	CF3	NHCO2CH2CCI3	2-PiridilCH2	H	O	
8-42	3-CH3	CF3	H	2-PiridilCH2	H	O	
8-43	3-CH3O	CF3	H	2-PiridilCH2	H	O	
8-44	3-CN	CF3	H	2-PiridilCH2	H	O	
8-45	3-CF3O	CF3	H	2-PiridilCH2	H	O	

ES 2 379 845 T3

(Continuación)

	(X)m	R	Y	R1	R2	W	p.f. (°C)
8-46	3-CH3S	CF3	H	2-PiridilCH2	H	O	
8-47	3-CH3S(O)	CF3	H	2-PiridilCH2	H	O	
8-48	3-CH3S(O)2	CF3	H	2-PiridilCH2	H	O	
8-49	3-CF3S	CF3	H	2-PiridilCH2	H	O	
8-50	3-CF3S(O)	CF3	H	2-PiridilCH2	H	O	
8-51	3-CF3S(O)2	CF3	H	2-PiridilCH2	H	O	
8-52	3-OH	CF3	H	2-PiridilCH2	H	O	
8-53	3-SH	CF3	H	2-PiridilCH2	H	O	
8-54	3,4-diCl	CF3	H	2-PiridilCH2	H	O	
8-55	3,4-diCl	CF3	H	CF3CH2	H	O	
8-56	3,4,5-triCl	CF3	H	2-PiridilCH2	H	O	
8-57	3,4,5-triCl	CF3	H	CF3CH2	H	O	
8-58	3,5-diBr	CF3	H	2-PiridilCH2	H	O	
8-59	3,5-diBr	CF3	H	CF3CH2	H	O	
8-60	3,5-diMe-4-NO2	CF3	H	2-PiridilCH2	H	O	
8-61	3,6-diMe-4-NO2	CF3	H	CF3CH2	H	O	
8-62	3,5-diCl	CF3	H	2-PiridilCH2	H	S	
8-63	3,5-diCl	CF3	NO2	H	H	O	
8-64	3,5-diCl	CF3	NO2	Me	H	O	
8-65	3,5-diCl	CF3	NO2	iso-Pr	H	O	
8-66	3,5-diCl	CF3	NO2	PhCH2	H	O	
8-67	3,5-diCl	CF3	NO2	CH2CO2CH3	H	O	
8-68	3,5-diCl	CF3	NO2	CH2CONMe	H	O	
8-69	3,5-diCl	CF3	NO2	CH2(ciclo)Pr	H	O	
8-70	3,5-diCl	CF3	NO2	SO2Me	H	O	
8-71	3,5-diCl	CF3	NO2	SO2CF3	H	O	
8-72	3,5-diCl	CF3	NO2	CH2=CHCH2	H	O	
8-73	3,5-diCl	CF3	NO2	HCCCH2	H	O	
8-74	3,5-diCl	CF3	NO2	CH2CN	H	O	
8-75	3,5-diCl	CF3	NO2	C(Me)2CH2SCH3	H	O	
8-76	3,5-diCl	CF3	NO2	2-F-Ph	H	O	
8-77	3,5-diCl	CH3	H	2-PiridilCH2	H	O	
8-78	3,5-diCl	CF3	H	2-PiridilCH2	CH3	O	

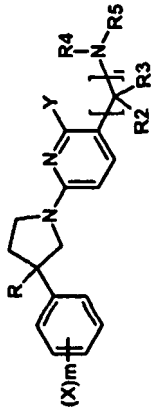
ES 2 379 845 T3

(Continuación)

	(X)m	R	Y	R1	R2	W	p.f. (°C)
8-79	3-NO ₂	CF ₃	NO ₂	CF ₃ CH ₂	H	O	
8-80	3,5-diCl	CF ₃	Cl	2-PiridilCH ₂	H	S	
8-81	2-diCl	CF ₃	NO ₂	2-PiridilCH ₂	H	O	
8-82	2,3-diCl	CF ₃	NO ₂	2-PiridilCH ₂	H	O	
8-83	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	3-PiridilCH ₂	H	O	
8-84	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	2-PiridilCH ₂	H	O	
8-85	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	2-(6-Cl-piridil)CH ₂	H	O	
8-86	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	3-(6-Cl-piridil)CH ₂	H	O	
8-87	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	2-PiridinilCH ₂	H	O	
8-88	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	1-(1-etilpirrolidin-2-il) CH ₂	H	O	
8-89	3,5-diCl	CF ₃	CF ₃	CF ₃ CH ₂	H	O	
8-90	3,5-diCl	CF ₃	CF ₃	2-(6-Cl-piridil)CH ₂	H	O	
8-91	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	Me ₂ NCH=		O	
8-92	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	EtON=CH	H	O	
8-93	3,5-diCl	CF ₃	C=NOCH ₃	2-PiridilCH ₂	H	O	
8-94	4-Cl	CF ₃	NO ₂	2-PiridilCH ₂	H	O	
8-95	4-Cl	CF ₃	NO ₂	CF ₃ CH ₂	H	O	
8-96	3,5-diCl	CF ₃	CN	CF ₃ CH ₂	H	O	
8-97	3,5-diCl	CF ₃	CF ₃	H	H	O	
8-98	3,5-diCF ₃	CF ₃	CF ₃	2-PiridilCH ₂	H	O	
8-99	3,5-diCF ₃	CF ₃	CF ₃	CF ₃ CH ₂	H	O	

Tabla 9

	(X)m	R	Y	R2	R3	R4	R5	I	(p.f. °C)
9-1	3,5-diCl	CF3	H	H	H	H	COCH3	1	
9-2	3,5-diCl	CF3	H	H	H	H	COC2H5	1	
9-3	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
9-4	13,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	CONCH3	1	
9-5	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COC2H5	1	
9-6	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	CO(i-Pr)	1	
9-7	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	CO2-piridilo	1	
9-8	3,5-diCl	CF3	F	H	H	H	COCH3	1	
9-9	3,5-diCl	CF3	I	H	H	H	COCH3	1	
9-10	3,5-diCl	CF3	NO2	H	H	H	COCH3	1	
9-11	3,5-diCl	CF3	CH3	H	H	H	COCH3	1	
9-12	3,5-diCl	CF3	MeS	H	H	H	COCH3	1	
9-13	3,5-diCl	CF3	MeSO	H	H	H	COCH3	1	
9-14	3,5-diCl	CF3	MeSO2	H	H	H	COCH3	1	
9-15	3,5-diCl	CF3	CF3S	H	H	H	COCH3	1	
9-16	3,5-diCl	CF3	CF3S(O)	H	H	H	COCH3	1	
9-17	3,5-diCl	CF3	CF3S(O)2	H	H	H	COCH3	1	
9-18	3,5-diCl	CF3	OCH3	H	H	H	COCH3	1	



(Continuación)

	(X)m	R	Y	R2	R3	R4	R5	I	(p.f. °C)
9-19	3,5-diCl	CF3	OCF3	H	H	H	COCH3	1	
9-20	3,5-diCl	CF3	OH	H	H	H	COCH3	1	
9-21	3,5-diCl	CF3	SH	H	H	H	COCH3	1	
9-22	3,5-diCl	CF3	NH2	H	H	H	COCH3	1	
9-23	3,5-diCl	CF3	NHCOCH3	H	H	H	COCH3	1	
9-24	3,5-diCl	CF3	NHCO2CH3	H	H	H	COCH3	1	
9-25	3,5-diCl	CF3	NHCO2CH2CCl3	H	H	H	COCH3	1	
9-26	13,5-diCl	CF3	Cl	H	H	Me	CO2-piridilo	1	
9-27	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	Me	COCH3	1	
9-28	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	Et	COCH3	1	
9-29	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	vinilo	COCH3	1	
9-30	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	propargilo	COCH3	1	
9-31	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	CH2Ph	COCH3	1	
9-32	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	CN	COCH3	1	
9-33	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	CH2CF3	COCH3	1	
9-34	13,5-diCl	CF3	Cl	H	H	cicloPr	COCH3	1	
9-35	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	COCH3	COCH3	1	
9-36	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	H	COC2H5	1	
9-37	13,5-diCl	CF3	Cl	H	H	H	COC2F5	1	
9-38	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	H	COPh	1	
9-39	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	H	CO2-piridilo	1	
9-40	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	H	CONMe2	1	

(Continuación)

	(X)m	R	Y	R2	R3	R4	R5	I	(p.f. °C)
9-41	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	H	CO2Me	1	
9-42	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	H	COSMe	1	
9-43	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	Me	COCH3	1	
9-44	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	2-piridilCO	COCH3	1	
9-45	3,5-diBr	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
9-46	3-Cl	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
9-47	3-CF3	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
9-48	3,5-diCF3	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
9-49	3,4,5-triCl	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
9-50	3,5-diMe-4-NO2	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
9-51	3-NO2	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
9-52	3-CH3	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
9-53	3-CH3O	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
9-54	3-CN	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
9-55	3-CF3O	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
9-56	3-CH3S	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
9-57	3-CH3S(O)	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
9-58	3-CH3S(O)2	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
9-59	3-CF3S	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
9-60	3-CF3S(O)	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
9-61	3-CF3S(O)2	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
9-62	3-OH	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	

(Continuación)

	(X)m	R	Y	R2	R3	R4	R5	I	(p.f. °C)
9-63	3-SH	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
9-64	3,5-diCl	CF3	Cl	CN	H	H	COCH3	1	
9-65	3,5-diCl	CF3	Cl	Me	H	H	COCH3	1	
9-66	3,5-diCl	CF3	Cl	Me	Me	H	COCH3	1	
9-67	3,5-diCl	CF3	Cl	ciclo-Pr	H	H	COCH3	1	
9-68	3,5-diCl	CF3	Cl	CF3	H	H	COCH3	1	
9-69	3,5-diCl	CF3	Cl	CO2Me	H	H	COCH3	1	
9-70	3,5-diCl	CF3	Cl	CH=CH2	H	H	COCH3	1	
9-71	3,5-diCl	CF3	Cl	CH2C	H2	H	COCH3	1	
9-72	3,5-diCl	CF3	Cl	CCH	H	H	COCH3	1	
9-73	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COEt	1	
9-74	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPr-n	1	
9-75	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPr-iso	1	
9-76	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COBu-terc	1	
9-77	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COCF3	1	
9-78	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh	1	
9-79	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPiridil-2	1	
9-80	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPiridil-3	1	
9-81	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPiridilCO-4	1	
9-82	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-F-2	1	
9-83	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-F-3	1	
9-84	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-F-4	1	

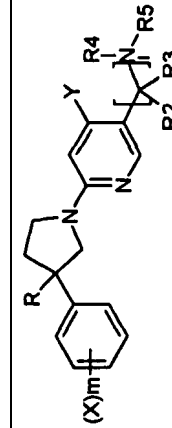
(Continuación)

	(X)m	R	Y	R2	R3	R4	R5	I	(p.f. °C)
9-85	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-Cl-2	1	
9-86	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-Cl-3	1	
9-87	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-Cl-4	1	
9-88	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-Br-2	1	
9-89	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-Me-2	1	
9-90	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	Covinilo	1	
9-91	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COpropargilo	1	
9-92	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	MeSO2	1	
9-93	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	CF3SO2	1	
9-94	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	CONHMe	1	
9-95	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	C0NMe2	1	
9-96	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	CO2Me	1	
9-97	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	C(O)SMe	1	
9-98	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	CSMe	1	
9-99	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	CON(Me)OMe	1	
9-100	3,5-diCl	CH3	Br	H	H	H	COCH3	1	
9-101	3,5-diCl	CH3	CF3	H	H	H	COCH3	1	
9-102	3,5-diCl	CH3	CN	H	H	H	COCH3	1	
9-103	3,5-diCl	CH3	NH2	H	H	H	COCH3	1	
9-104	3,5-diCl	CH3	NHCOCH3	H	H	H	COCH ₃	1	
9-105	3,5-diCl	CH3	NHCOCF3	H	H	H	COCH3	1	
9-106	3,5-diCl	CH3	NHCO2CH3	H	H	H	COCH3	1	

(Continuación)

	(X)m	R	Y	R2	R3	R4	R5	I	(p.f. °C)
9-107	3,5-diCl	CH3	NHCO2CH2CCl3	H	H	H	COCH3	1	
9-108	3,5-diCl	CH3	NHSO2CH3	H	H	H	COCH3	1	
9-109	3,5-diCl	CH3	NHSO2CF3	H	H	H	COCH3	1	
9-110	3,5-diCl	CH3	C=NOCH3	H	H	H	COCH3	1	
9-111	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COCH3		
9-112	3,5-diCF3	CF3	CF3	H	H	H	COCH3	1	
9-113	3,5-diCF3	CF3	CF3	H	H	H	COC2H5	1	
9-114	3,5-diCF3	CF3	CF3	H	H	H	COPr-ciclo	1	
9-115	3,4,5-triCl	CF3	CF3	H	H	H	COCH3	1	
9-116	3,4,5-triCl	CF3	CF3	H	H	H	COC2H5	1	
9-117	3,4,5-triCl	CF3	CF3	H	H	H	COPr-ciclo	1	
9-118	3,4,-diCl, 5-CF3	CF3	CF3	H	H	H	COCH3	1	

Tabla 10



	(X)m	R	Y	R2	R3	R4	R5	I	p.f. (°C)
10-1	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
10-2	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COCH3	1	
10-3	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COC2H5	1	

(Continuación)

	(X)m	R	Y	R2	R3	R4	R5	I	p.f. (°C)
10-4	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	CO(-i-Pr)	1	
10-5	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	CO2-piridilo	1	
10-6	3,5-diCl	CF3	F	H	H	H	COCH3	1	
10-7	3,5-diCl	CF3	I	H	H	H	COCH3	1	
10-8	3,5-diCl	CF3	NO2	H	H	H	COCH3	1	
10-9	3,5-diCl	CF3	CH3	H	H	H	COCH3	1	
10-10	3,5-diCl	CF3	MeS	H	H	H	COCH3	1	
10-11	3,5-diCl	CF3	MeSO	H	H	H	COCH3	1	
10-12	3,5-diCl	CF3	MeSO2	H	H	H	COCH3	1	
10-13	3,5-diCl	CF3	CF3S	H	H	H	COCH3	1	
10-14	3,5-diCl	CF3	CF3S(O)	H	H	H	COCH3	1	
10-15	3,5-diCl	CF3	CF3S(O)2	H	H	H	COCH3	1	
10-16	3,5-diCl	CF3	OCH3	H	H	H	COCH3	1	
10-17	3,5-diCl	CF3	OCF3	H	H	H	COCH3	1	
10-18	3,5-diCl	CF3	OH	H	H	H	COCH3	1	
10-19	3,5-diCl	CF3	SH	H	H	H	COCH3	1	
10-20	3,5-diCl	CF3	NH2	H	H	H	COCH3	1	
10-21	3,5-diCl	CF3	NHCOCH3	H	H	H	COCH3	1	
10-22	3,5-diCl	CF3	NHCO2CH3	H	H	H	COCH3	1	
10-23	3,5-diCl	CF3	NHCO2CH2CCl3	H	H	H	COCH3	1	
10-24	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	Me	CO2-piridilo	1	

(Continuación)

	(X)m	R	Y	R2	R3	R4	R5	I	p.f. (°C)
10-25	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	Me	COCH3	1	
10-26	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	Et	COCH3	1	
10-27	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	vinilo	COCH3	1	
10-28	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	propargilo	COCH3	1	
10-29	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	CH2Ph	COCH3	1	
10-30	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	CN	COCH3	1	
10-31	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	CH2CF3	COCH3	1	
10-32	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	cicloPr	COCH3	1	
10-33	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	COCH3	COCH3	1	
10-34	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	H	COC2H5	1	
10-35	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	H	COC2F5	1	
10-36	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	H	COPh	1	
10-37	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	H	CO2-piridilo	1	
10-38	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	H	CONMe2	1	
10-39	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	H	CO2Me	1	
10-40	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	H	COSMe	1	
10-41	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	Me	COCH3	1	
10-42	3,5-diCl	CF3	Cl	H	H	2-piridilCO	COCH3	1	
10-43	3,5-diBr	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
10-44	3-Cl	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
10-45	3-CF3	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
10-46	3,5-diCF3	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	

(Continuación)

	(X)m	R	Y	R2	R3	R4	R5	I	p.f. (°C)
10-47	3,4,5-triCl	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
10-48	3,5-diMe-4-NO2	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
10-49	3-NO2	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
10-50	3-CH3	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
10-51	3-CH30	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
10-52	3-CN	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
10-53	3-CF30	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
10-54	3-CH3S	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
10-55	3-CH3S(O)	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
10-56	3-CH3S(O)2	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
10-57	3-CF3S	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
10-58	3-CF3S(O)	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
10-59	3-CF3S(O)2	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
10-60	3-OH	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
10-61	3-SH	CF3	Cl	H	H	H	COCH3	1	
10-62	3,5-diCl	CF3	Cl	CN	H	H	COCH3	1	
10-63	3,5-diCl	CF3	Cl	Me	H	H	COCH3	1	
10-64	3,5-diCl	CF3	Cl	Me	Me	H	COCH3	1	
10-65	3,5-diCl	CF3	Cl	ciclo-Pr	H	H	COCH3	1	
10-66	3,5-diCl	CF3	Cl	CF3	H	H	COCH3	1	
10-67	3,5-diCl	CF3	Cl	CO2Me	H	H	COCH3	1	
10-68	3,5-diCl	CF3	Cl	CH=CH2	H	H	ICOCH3	1	

(Continuación)

	(X)m	R	Y	R2	R3	R4	R5	I	p.f. (°C)
10-69	3,5-diCl	CF3	Cl	CH2C	H2	H	COCH3	1	
10-70	3,5-diCl	CF3	Cl	CCH	H	H	COCH3	1	
10-71	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COEt	1	
10-72	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPr-n	1	
10-73	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPr-iso	1	
10-74	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COBu-terc	1	
10-75	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COCF3	1	
10-76	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh	1	
10-77	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPiridil-2	1	
10-78	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPiridil-3	1	
10-79	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPiridilCO-4	1	
10-80	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-F-2	1	
10-81	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-F-3	1	
10-82	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-F-4	1	
10-83	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-Cl-2	1	
10-84	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-Cl-3	1	
10-85	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-Cl-4	1	
10-86	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-Br-2	1	
10-87	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COPh-Me-2	1	
10-88	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	Covinilo	1	
10-89	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COpropargilo	1	
10-90	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	MeSO2	1	

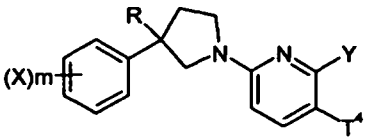
(Continuación)

	(X)m	R	Y	R2	R3	R4	R5	I	p.f. (°C)
10-91	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	CF3SO2	1	
10-92	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	CONHMe	1	
10-93	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	CONMe2	1	
10-94	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	CO2Me	1	
10-95	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	C(O)SMe	1	
10-96	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	CSMe	1	
10-97	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	CON(Me)OMe	1	
10-98	3,5-diCl	CH3	Br	H	H	H	COCH3	1	
10-99	3,5-diCl	CH3	CF3	H	H	H	COCH3	1	
10-100	3,5-diCl	CH3	CN	H	H	H	COCH3	1	
10-101	3,5-diCl	CH3	NH2	H	H	H	COCH3	1	
10-102	3,5-diCl	CH3	NHCOCH3	H	H	H	COCH3	1	
10-103	3,5-diCl	CH3	NHCOCF3	H	H	H	COCH3	1	
10-104	3,5-diCl	CH3	NHCO2CH3	H	H	H	COCH3	1	
10-105	3,5-diCl	CH3	NHCO2CH2CCl3	H	H	H	COCH3	1	
10-106	3,5-diCl	CH3	NHSO2CH3	H	H	H	COCH3	1	
10-107	3,5-diCl	CH3	NHSO2CF3	H	H	H	COCH3	1	
10-108	3,5-diCl	CH3	C=NOCH3	H	H	H	COCH3	1	
10-109	3,5-diCl	CF3	Br	H	H	H	COCH3		
10-110	3,5-diCF3	CF3	CF3	H	H	H	COCH3	1	
10-111	3,5-diCF3	CF3	CF3	H	H	H	COC2H5	1	
10-112	3,5-diCF3	CF3	CF3	H	H	H	COPr-ciclo	1	

(Continuación)

	(X)m	R	Y	R2	R3	R4	R5	I	p.f. (°C)
10-113	3,4,5-triCl	CF3	CF3	H	H	H	COCH3	1	
10-114	3,4,5-triCl	CF3	CF3	H	H	H	COC2H5	1	
10-115	3,4,5-triCl	CF3	CF3	H	H	H	COPr-ciclo	1	
10-116	3,4,-diCl, 5-CF3	CF3	CF3	H	H	H	COCH3	1	

Tabla 11

					
	(X)m	R	Y	T ⁴	p.f. (°C)
11-1	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
11-2	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ H	
11-3	3,5-diCl	CF ₃	NH ₂	CO ₂ Me	
11-4	3,5-diCl	CF ₃	F	CO ₂ Me	
11-5	3,5-diCl	CF ₃	Cl	CO ₂ Me	
11-6	3,5-diCl	CF ₃	Cl	CO ₂ Bu-t	
11-7	3,5-diCl	CF ₃	Cl	CO ₂ H	
11-8	3,5-diCl	CF ₃	Br	CO ₂ Me	
11-9	3,5-diCl	CF ₃	I	CO ₂ Me	
11-10	3,5-diCl	CF ₃	CH ₃	CO ₂ Me	
11-11	3,5-diCl	CF ₃	Cl	CH ₃	
11-12	3,5-diCl	CF ₃	CN	F	
11-13	3,5-diCl	CF ₃	CH ₃	NO ₂	
11-14	3,5-diCl	CF ₃	CH ₃	NH ₂	
11-15	3,5-diCl	CF ₃	Br	NO ₂	
11-16	3,5-diCl	CF ₃	Br	NH ₂	
11-17	3-CF ₃	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
11-18	3-CF ₃	CF ₃	NO ₂	CO ₂ H	
11-19	3,5-diCF ₃	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
11-20	3,5-diCF ₃	CF ₃	NO ₂	CO ₂ H	
11-21	3,4-diCl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
11-22	3,4-diCl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ H	
11-23	3-Cl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
11-24	3-Cl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ H	
11-25	3,5-diBr	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
11-26	3,4,5-triCl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
11-27	3,5-diMe-4-NO ₂	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
11-28	3-NO ₂	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
11-29	3-CH ₃	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
11-30	3-CH ₃ O	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	

ES 2 379 845 T3

(Continuación)

	(X)m	R	Y	T ⁴	p.f. (°C)
11-31	3-CN	CF3	NO2	CO2Me	
11-32	3-CF3O	CF3	NO2	CO2Me	
11-33	3-CH3S	CF3	NO2	CO2Me	
11-34	3-CH3S(O)	CF3	NO2	CO2Me	
11-35	3-CH3S(O)2	CF3	NO2	CO2Me	
11-36	3-CF3S	CF3	NO2	CO2Me	
11-37	3-CF3S(O)	CF3	NO2	CO2Me	
11-38	3-CF3S(O)2	CF3	NO2	CO2Me	
11-39	3-OH	CF3	NO2	CO2Me	
11-40	3-SH	CF3	NO2	CO2Me	
11-41	3-NO2	CF3	NO2	CO2H	
11-42	3,4,5-triCl	CF3	NO2	CO2H	
11-43	2-Cl	CF3	NO2	CO2Me	
11-44	2-Cl	CF3	NO2	CO2H	
11-45	4-Cl	CF3	NO2	CO2Me	
11-46	4-Cl	CF3	NO2	CO2H	
11-47	3,5-diCl	CF3	CF3	CO2Et	
11-48	3,5-diCl	CF3	CF3	CO2H	
11-49	3,5-diMe-4-NO2	CF3	NO2	CO2H	
11-50	3,4,5-triCl	CF3	NO2	CO2Me	
11-51	3,5-diCl	CF3	CN	CO2H	
11-52	3,5-diCl	CF3	CN	CO2Me	
11-53	3,5-diCF3	CF3	CF3	CO2Et	
11-54	3,5-diCl	CF3	CF3	F	
11-55	3,5-diCl	CF3	CF3	NO2	
11-56	3,5-diCl	CF3	CF3	NH2	
11-57	3,5-diCl	CF3	F	CO2Et	
11-58	3,4,5-triCl	CF3	CF3	CO2Et	
11-59	3,4,5-triCl	CF3	CF3	CO2H	

Tabla 12

					
	(X)m	R	Y	T ⁴	p.f. (°C)
12-1	3,5-diCl	CF ₃	H	NO ₂	
12-2	3,5-diCl	CF ₃	H	CN	
12-3	3,5-diCl	CF ₃	H	NH ₂	
12-4	3,5-diCl	CF ₃	H	CO ₂ Me	
12-5	3,5-diCl	CF ₃	H	CO ₂ H	
12-6	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
12-7	3,5-diCl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ H	
12-8	3,5-diCl	CF ₃	NH ₂	CO ₂ Me	
12-9	3,5-diCl	CF ₃	F	CO ₂ Me	
12-10	3,5-diCl	CF ₃	Cl	CO ₂ Me	
12-11	3,5-diCl	CF ₃	Cl	CO ₂ Bu-t	
12-12	3,5-diCl	CF ₃	Cl	CO ₂ H	
12-13	3,5-diCl	CF ₃	Br	CO ₂ Me	
12-14	3,5-diCl	CF ₃	I	CO ₂ Me	
12-15	3,5-diCl	CF ₃	CH ₃	CO ₂ Me	
12-16	3,5-diCl	CF ₃	Cl	CH ₃	
12-17	3,5-diCl	CF ₃	CN	F	
12-18	3,5-diCl	CF ₃	CH ₃	NO ₂	
12-19	3,5-diCl	CF ₃	CH ₃	NH ₂	
12-20	3,5-diCl	CF ₃	Br	NO ₂	
12-21	3,5-diCl	CF ₃	Br	NH ₂	
12-22	3-CF ₃	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
12-23	3-CF ₃	CF ₃	NO ₂	CO ₂ H	
12-24	3,5-diCF ₃	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
12-25	3,5-diCF ₃	CF ₃	NO ₂	CO ₂ H	
12-26	3,4-diCl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
12-27	3,4-diCl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ H	
12-28	3-Cl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	
12-29	3-Cl	CF ₃	NO ₂	CO ₂ H	
12-30	3,5-diBr	CF ₃	NO ₂	CO ₂ Me	

ES 2 379 845 T3

(Continuación)

	(X)m	R	Y	T ⁴	p.f. (°C)
12-31	3,4,5-triCl	CF3	NO2	CO2Me	
12-32	3,5-diMe-4-NO2	CF3	NO2	CO2Me	
12-33	3-NO2	CF3	NO2	CO2Me	
12-34	3-CH3	CF3	NO2	CO2Me	
12-35	3-CH3O	CF3	NO2	CO2Me	
12-36	3-CN	CF3	NO2	CO2Me	
12-37	3-CF3O	CF3	NO2	CO2Me	
12-38	3-CH3S	CF3	NO2	CO2Me	
12-39	3-CH3S(O)	CF3	NO2	CO2Me	
12-40	3-CH3S(O)2	CF3	NO2	CO2Me	
12-41	3-CF3S	CF3	NO2	CO2Me	
12-42	3-CF3S(O)	CF3	NO2	CO2Me	
12-43	3-CF3S(O)2	CF3	NO2	CO2Me	
12-44	3-OH	CF3	NO2	CO2Me	
12-45	3-SH	CF3	NO2	CO2Me	
12-46	12-46 3-NO2	CF3	NO2	CO2H	
12-47	3,4,5-triCl	CF3	NO2	CO2H	
12-48	2-Cl	CF3	NO2	CO2Me	
12-49	2-Cl	CF3	NO2	CO2H	
12-50	4-Cl	CF3	NO2	CO2Me	
12-51	4-Cl	CF3	NO2	CO2H	
12-52	3,5-diCl	CF3	CF3	CO2Et	
12-53	3,5-diCl	CF3	CF3	CO2H	
12-54	3,5-diMe-4-NO2	CF3	NO2	CO2H	
12-55	3,4,5,3,4,5-triCl	CF3	NO2	CO2Me	
12-56	3,5-diCl	CF3	CN	CO2H	
12-57	12-5-3,5-diCl	CF3	CN	CO2Me	
12-58	3,5-diCF3	CF3	CF3	CO2Et	
12-59	3,5-diCl	CF3	CF3	F	
12-60	3,5-diCl	CF3	CF3	NO2	
12-61	3,5-diCl	CF3	CF3	NH2	
12-62	3-5-diCl	CF3	F	CO2Et	
12-63	3,4,5-triCl	CF3	CF3	CO2Et	

ES 2 379 845 T3

(Continuación)

	(X)m	R	Y	T ⁴	p.f. (°C)
12-64	3,4,5-triCl	CF3	CF3	CO2H	

Tabla 13

	RMN 1H
1-2	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 2,50-2,60 (1H, m), 2,83-2,91 (1H, m), 3,49-3,65 (2H, m), 3,82 (1H, d), 4,12 (1H, d), 4,75 (2H, d), 6,61 (2H, d), 7,21 (1H, dd), 7,29 (2H, d), 7,33-7,40 (3H, m), 7,68 (1H, td),
1-3	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 2,51-2,56 (4H, m), 2,83-2,87 (1H, m), 3,50-3,56 (2H, m), 3,78 (1H, d), 4,00-4,15 (3H, m), 6,03 (1H, s a), 6,38-6,41 (2H, m), 7,26-7,39 (4H, m).
1-4	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 2,49-2,55 (4H, m), 2,80-2,88 (1H, m), 3,50-3,56 (2H, m), 3,78 (1H, d), 4,08 (1H, d), 4,71 (2H, d), 6,39-6,41 (2H, m), 7,10-7,18 (2H, m), 7,32-7,43 (4H, m), 7,65-7,68 (1H, m),
1-6	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 2,50-2,63 (1H, m), 2,86-2,90 (1H, m), 3,53-3,58 (2H, m), 3,78-3,81 (1H, m), 4,10-4,14 (1H, m), 4,78 (2H, d), 6,23-6,28 (1H, m), 6,43-6,46 (1H, m), 7,17-7,40 (5H, m), 7,67-
1-7	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 2,55-2,57 (1H, m), 2,87-2,88 (1H, m), 3,51-3,61 (2H, m), 3,80 (1H, d), 4,08-4,19 (3H, m), 6,53-6,56 (2H, m), 6,87-6,91 (1H, m), 7,26-7,27 (1H, m), 7,39-7,42 (1H, m), 7,85-
1-8	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 2,53-2,60 (1H, m), 2,86-2,90 (1H, m), 3,53-3,56 (2H, m), 3,79 (1H, d), 4,09 8: 2,53-2,60 (1H, d), 4,80 (2H, d), 6,52-6,56 (2H, m), 7,20-7,27 (2H, m), 7,38-7,39 (2H, m), 7,70-7,73 (2H, m),
1-9	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 2,56-2,58 (1H, m), 2,85-2,93 (1H, m), 3,51-3,58 (2H, m), 3,78 (1H, d), 4,10-4,14 (3H, m), 6,56-6,61 (2H, m), 6,75-6,76 (1H, m), 7,26-7,29 (1H, m), 7,40-7,40 (1H, m), 7,69
1-10	1H-NMP (CDCl ₃) δ: 2,53-2,60 (1H, m), 2,85-2,90 (1H, m), 3,46-3,59 (2H, m), 3,78 (1H, d), 4,08 (1H, d), 4,77 (2H, d), 6,55-6,56 (1H, m), 6,75-6,78 (1H, m), 7,18-7,44 (5H, m), 7,65-7,70 (2H, m),
1-11	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 0,62-0,65 (2H, m), 0,83-0,89 (2H, m), 2,54-2,61 (1H, m), 2,86-2,90 (2H, m), 3,47-3,57 (2H, m), 3,76 (1H, d), 4,06 (1H, d), 6,34 (1H, s a), 6,52-6,55 (1H, m), 6,71 (1H, d),
1-12	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 2,55-2,60 (1H, m), 2,74 (2H, t, J = 6,3 Hz), 2,86-2,90 (1H, m), 3,50-3,57 (2H, 8: 2,55-2,60 (1H, m), Hz), 2,86-2,90 m), 3,67-3,79 (3H, m), 4,08 (1H, d), 6,53-6,56 (1H, m), 6,74-6,81 (2H, m), 7,27-7,27 (1H, m),
1-15	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 2,56-2,66 (1H, m), 2,90-2,98 (1H, m), 3,52-3,68 (2H, m), 3,83 (1H, d), 4,04-4,16 (3H, m), 6,09 (1H, t), 6,75 (1H, dd), 7,10 (1H, d), 7,28 (2H, d), 7,40-7,43 (2H, m).
1-16	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 2,54-2,65 (1H, m), 2,89-2,97 (1H, m), 3,51-3,67 (2H, m), 3,83 (1H, d), 4,13 (1H, d), 4,74 (2H, d), 6,75 (1H, dd), 7,08 (1H, d), 7,15-7,23 (2H, m), 7,28 (2H, s a), 7,37 (1H, d),
1-17	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 2,57-2,67 (1H, m). 2,88-2,98 (1H, m), 3,49-3,67 (2H, m), 3,87 (1H, d), 4,15 (1H, d), 4,75 (2H, d), 6,74 (1H, dd), 7,08 (1H, d), 7,14 (1H, t), 7,21 (1H, dd), 7,26-7,38 (5H, m),
1-18	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 2,58-2,68 (1H, m), 2,91-3,00 (1H, m), 3,50-3,68 (2H, m), 3,87 (1H, d), 4,04-4,17 (3H, m), 6,06 (1H, t), 6,75 (1H, d), 7,10 (1H, s), 7,26-7,42 (5H, m).
1-21	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 2,61-2,72 (1H, m), 2,98-3,06 (1H, m), 3,53-3,70 (2H, m), 3,90 (1H, d), 4,09 (2H, dt), 4,22 (1H, d), 6,08 (1H, t), 6,76 (1H, dd), 7,11 (1H, d), 7,42 (1H, d), 7,57-7,69 (4H, m).
1-22	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 2,62-2,73 (1H, m), 3,03-3,11 (1H, m), 3,57-3,73 (2H, m), 3,89 (1H, d), 4,27 (1H, d), 4,75 (2H, d), 6,79 (1H, dd), 7,12 (1H, d), 7,16-7,24 (2H, m), 7,37 (1H, d), 7,51 (1H, d), 7,70 (1H, td), 7,84 (2H, s a), 7,95 (1H, s a), 8,52 (1H, d).
1-23	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 2,63-2,73 (1H, m), 3,04-3,13 (1H, m), 3,58-3,74 (2H, m), 3,89 (1H, d), 4,10 (2H, td), 4,28 (1H, d), 6,07 (1H, t), 6,80 (1H, dd), 7,15 (1H, d), 7,43 (1H, d), 7,83 (2H, s a), 7,95
1-25	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 2,54-2,61 (1H, m), 2,86-2,94 (1H, m), 3,52-3,64 (2H, m), 3,81 (1H, d), 4,11 (1H, d), 4,72 (2H, d), 6,69-6,72 (1H, m), 6,82-6,83 (1H, m), 7,15-7,40 (5H, m), 7,50-7,53 (1H, m),

ES 2 379 845 T3

(Continuación)

	RMN 1H
1-27	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 2,55-2,63 (1H, m), 2,90-2,94 (1H, m), 3,55-3,62 (2H, m), 3,81-3,87 (1H, m), 4,11-4,14 (1H, m), 4,78 (2H, d), 6,76-6,79 (1H, m), 6,87-6,88 (1H, m), 7,26-7,35 (5H, m), 7,57-7,60 (1H, m), 7,68-7,70 (1H, m), 7,79-7,82 (1H, m), 8,55-8,57 (1H,
1-31	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 2,53-2,63 (1H, m), 2,88-2,96 (1H, m), 3,45 (3H, s), 3,56-3,68 (2H, m), 3,82-3,86 (1H, m), 4,14-4,17 (1H, m), 4,74 (2H, d, J = 5,1 Hz), 6,72-6,75 (1H, m), 7,18-7,21 (1H, m), 7,28-7,29 (4H, m), 7,36-7,41 (2H, m), 7,53-7,55 (1H, m), 7,67-7,
1-38	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 2,46-2,56 (1H, m), 2,78-2,87 (1H, m), 3,49-3,57 (2H, m), 3,77 (1H, d), 4,06 (1H, d), 4,70 (2H, d), 5,79 (2H, d), 5,97-6,00 (1H, m), 7,18-7,41 (7H, m), 7,65-7,68 (1H, m), 8,56
1-39	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 2,53-2,61 (1H, m), 2,84-2,92 (1H, m), 3,55-3,67 (2H, m), 3,83 (1H, d), 4,15 (1H, d), 4,72 (2H, d), 6,36-6,39 (1H, m), 7,25-7,36 (4H, m), 7,64-7,70 (2H, m), 7,92-7,95 (2H, m),
1-54	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 2,55-2,64 (1H, m), 2,89-2,94 (1H, m), 3,49-3,66 (2H, m), 3,84 (1H, d), 4,13 (1H, d), 4,74 (2H, d), 6,74 (1H, dd), 7,07 (1H, d), 7,16-7,27 (3H, m), 7,36 (1H, d), 7,47-7,52 (3H,
1-56	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 2,55-2,62 (1H, m), 2,88-2,96 (1H, m), 3,52-3,67 (2H, m), 3,82 (1H, d), 4,12 (1H, d), 4,74 (2H, d), 6,75 (1H, dd), 7,08 (1H, d), 7,21 (2H, t), 7,36 (1H, d), 7,42 (2H, s), 7,49 (1H,
1-57	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 2,54-2,66 (1H, m), 2,89-2,97 (1H, m), 3,53-3,69 (2H, m), 3,82 (1H, d), 4,03-4,15 (3H, m) 6,08 (1H, s a), 6,75 (1H, dd), 7,10 (1H, s), 7,40-7,42 (3H, m).
1-60	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 2,36 (6H, s), 2,56-2,66 (1H, m), 2,91-2,99 (1H, m), 3,51-3,67 (2H, m), 3,85 (1H, d), 4,15 (1H, d), 4,74 (2H, d, J = 4,9 Hz), 6,75 (1H, dd), 7,09 (1H, d), 7,15-7,23 (4H, m), 7,37
1-61	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 2,37 (6H, s), 2,57-2,68 (1H, m), 2,92-3,00 (1H, m), 3,52-3,68 (2H, m), 3,86 (1H, d), 4,03-4,18 (3H, m), 6,09 (1H, t), 6,75 (1H, dd), 7,11 (1H, d), 7,15 (2H, s), 7,41 (1H, d).
1-63	RMN 1H (acetona-d ₆) δ: 2,72-2,85 (1H, m), 3,03-3,07 (1H, m), 3,63-3,71 (2H, m), 4,04 (1H), 4,38 (1H, d), 6,58 (1H, s a), 6,85-6,88 (1H, m), 7,02 (1H, d), 7,23 (1H, s a), 7,53-7,59 (4H, m).
1-73	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 2,09 (1H, s), 2,58-2,62 (1H, m), 2,90-2,94 (1H, m), 3,57-3,61 (2H, m), 3,83 (1H, d), 4,13 (1H), 4,22 (2H, c), 6,04 (1H, s a), 6,73-6,75 (1H, m), 7,07 (1H, d), 7,27-7,28 (2H,
1-74	RMN 1H (acetona-d ₆) δ: 2,77-2,85 (1H, m), 3,08-3,10 (1H, m), 3,66-3,68 (2H, m), 4,09 (1H, d), 4,33-4,46 (3H, m), 6,94-6,97 (1H, m), 7,14 (1H, d), 7,55-7,63 (3H, m), 8,20-8,23 (1H, m).
1-75	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 1,50 (6H, s), 2,17 (3H, s), 2,57-2,62 (1H, m), 2,90-2,94 (1H, m), 3,02 (2H, s), 3,56-3,59 (2H, m), 3,82 (1H, d), 4,11 (1H, d), 5,82 (1H, s a), 6,71-6,73 (1H, m), 7,05 (1H, d),
1-78	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 2,54-2,64 (1H, m), 2,87-2,95 (1H, m), 3,53-3,69 (2H, m), 3,85 (1H, d), 4,15 (1H, d), 4,79 (2H, d), 6,95 (1H, dd), 7,17-7,21 (1H, m), 7,28 (2H, s), 7,35 (1H, d), 7,41 (1H, t), 7,65 (1H, td), 7,96 (1H, d), 8,10 (1H, d), 8,66-8,58 (2H, m).
1-80	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 2,64-2,75 (1H, m), 3,02-3,10 (1H, m), 3,54-3,73 (2H, m), 3,93 (1H, d), 4,04-4,15 (2H, m), 4,25 (1H, d), 6,04 (1H, t), 6,78 (1H, dd), 7,13 (1H, d), 7,43 (1H, d), 7,65 (1H, t), 7,76
1-81	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 2,51-2,61 (1H, m), 2,84-2,92 (1H, m), 3,45-3,61 (2H, m), 3,79 (1H, d), 4,08 (1H, d), 5,08 (2H, d), 6,49-6,54 (2H, m), 7,22-7,28 (3H, m), 7,36 (1H, d), 7,40 (1H, t), 7,72 (1H,
1-82	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 2,65-2,77 (1H, m), 3,18-3,26 (1H, m), 3,59 (2H, d), 3,99 (1H, d), 4,48 (1H, d), 4,75 (2H, d), 6,76 (1H, dd), 7,08-7,51 (9H, m), 7,70 (1H, td), 8,53 (1H, d).
1-83	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 2,65-2,76 (1H, m), 3,18-3,25 (1H, m), 3,59 (2H, d), 3,99 (1H, d), 4,49 (1H, d), 4,74 (2H, d), 6,76 (1H, dd), 7,07-7,38 (6H, m), 7,53 (2H, dt), 7,70 (1H, td), 8,52 (1H, d).
1-84	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 2,61-2,64 (1H, m), 2,89-2,93 (1H, m), 3,57-3,60 (2H, m), 3,82 (1H, d), 4,12 (1H, d), 4,62 (2H, d), 6,42 (1H, s a), 6,71-6,74 (1H, m), 7,06 (1H, d), 7,27-7,42 (5H, m), 7,79 (1H,
1-85	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 2,57-2,63 (1H, m), 2,88-2,94 (1H, m), 3,54-3,63 (2H, m), 3,82 (1H, d), 4,13 (1H, d), 4,59 (2H, d), 6,64-6,74 (2H, m), 7,05 (1H, d), 7,28 (4H, d), 7,41-7,43 (2H, m), 8,51-8,53

ES 2 379 845 T3

(Continuación)

	RMN 1H
1-86	RMN 1H (CDCL3) δ : 2,55-2,65 (1H, m), 2,89-2,97 (1H, m), 3,56-3,68 (2H, m), 3,83 (1H, d), 4,14 (1H, d), 4,72 (2H, d), 6,74-6,79 (2H, m), 7,09-7,10 (1H, m), 7,25-7,50 (5H, m), 7,68 (1H, t).
1-87	RMN 1H (CDCI3) δ : 2,57-2,65 (1H, m), 2,90-2,95 (1H, m), 3,50-3,62 (2H, m), 3,82 (1H, d), 4,12 d), 4,53 (2H, d), 6,66-6,70 (2H, m), 7,02 (1H, d), 7,25-7,41 (5H, m), 7,72-7,74 (1H, m), 8,26
1-88	RMN 1H (CDCI3) δ : 2,58-2,63 (1H, m), 2,91-2,95 (1H, m), 3,533,68 (2H, m), 3,84(1H, d), 4,14(1H, d), 4,88 (2H, d), 6,75-6,78 (1H, m), 7,08 (1H, d), 7,20-7,29 (4H, m), 7,41-7,41 (1H, m), 7,55
1-90	RMN 1H (CDCI3) δ : 2,56-2,61 (1H, m), 2,87-2,95 (1H, m), 3,53-3,65 (2H, m), 3,81 (1H, d), 3,99-4,13 (3H, m), 6,20-6,22 (1H, m), 6,68-6,71 (1H, m), 6,81 (1H, d), 7,27-7,28 (2H, m), 7,40-7,41
1-91	RMN 1H (CDCI3) δ : 2,55-2,60 (1H, m), 2,88-2,92 (1H, m), 3,52-3,65 (2H, m), 3,81 (1H, d), 4,11 (1H, d), 4,67 (2H, d), 6,74-6,82 (3H, m), 7,23-7,28 (4H, m), 7,38-7,39 (1H, m), 7,50 (1H, d), 7,64
1-92	RMN 1H (CDCI3) δ : 2,55-2,62 (1H, m). 2,86-2,94 (1H, m), 3,12 (6H, d), 3,53-3,63 (2H, m), 3,82 (1H, d), 4,13 (1H, d), 6,62-6,67 (2H, m), 7,25-7,28 (1H, m). 7,40 (1H, d), 8,04 (1H, d), 8,54 (1H,
1-93	RMN 1H (CDCI3) δ : 1,28 (3H, t), 2,59-2,64 (1H, m), 2,93-2,97 (1H, m), 3,58-3,67 (2H, m), 3,85 d), 4,10-4,18 (3H, m), 6,75-6,78 (1H, m), 7,09-7,50 (4H, m), 7,70-7,72 (1H, m), 8,47-8,50
1-95	RMN 1H (CDCI3) δ : 2,55-2,65 (1H, m), 2,88-2,97 (1H, m), 3,47-3,65 (2H, m), 3,86 (1H, d), 4,14 (1H, d), 4,73 (2H, d), 6,73 (1H, dd). 7,06 (1H, d), 7,23-7,15 (2H, m), 7,31-7,41 (5H, m), 7,48 (1H,
1-96	RMN 1H (CDCI3) δ : 2,56-2,67 (1H, m), 2,90-2,99 (1H, m), 3,48-3,67 (2H, m), 3,86 (1H, d), 4,03-4,16 (3H, m), 6,06 (1H, s a), 6,73 (1H, dd), 7,09 (1H, d), 7,33 (2H, d), 7,38-7,42 (3H, m).
1-97	RMN 1H (CDCI3) δ : 2,58-2,63 (1H, m), 2,91-2,96 (1H, m), 3,55-3,67 (2H, m), 3,81-3,84 (1H, m), 4,07-4,18 (3H, m), 6,70-6,80 (3H, m), 7,27-7,42 (3H, m), 7,75-7,78 (1H, m)
1-98	RMN 1H (CDCI3) δ : 2,53-2,63 (1H, m), 2,89-2,92 (1H, m), 3,21-3,35 (1H, m), 3,59-3,78 (3H, m), 4,10-4,13 (1H, m), 5,94-5,97 (2H, m), 6,73-6,85 (2H, m), 7,23-7,56 (4H, m)
1-99	RMN 1H (CDCI3) δ : 2,63-2,68 (1H, m), 3,02-3,07 (1H, m), 3,55-3,71 (2H, m), 3,86-3,90 (1H, m), 4,23-4,26 (1H, m), 4,74 (2H, d), 6,74-6,77 (1H, m), 6,86-6,88 (1H, m), 7,07-7,10 (1H, m), 7,20-7,22 (1H, m), 7,31-7,34 (1H, m), 7,53-7,56 (1H, m), 7,68-7,70 (1H,
1-100	RMN 1H (CDCI3) δ : 2,65-2,67 (1H, m), 3,02-3,10 (1H, m), 3,59-3,66 (2H, m), 3,86-3,90 (1H, m). 4,11-4,20 (3H, m), 5,99-6,02 (1H, m), 6,76-6,85 (2H, m), 7,50-7,53 (1H, m), 7,84-7,95 (3H, m).
1-101	RMN 1H (CDCI3) δ : 2,54-2,64 (1H, m), 2,89-2,97 (1H, m), 3,54-3,70 (2H, m), 3,85 (1H, d), 4,04-4,18 (3H, m), 6,94 (1H, dd), 7,29 (2H, s), 7,41 (1H, t), 7,92 (1H, d), 8,14-8,06 (2H, m).
1-102	RMN 1H (CDCI3) δ : 2,46-2,61 (1H, m), 2,83-2,91 (1H, m), 3,50-3,60 (2H, m), 3,77-3,81 (1H, m), 4,07-4,10 (1H, m), 4,70 (2H, d, J = 4,9 Hz), 6,67-6,70 (1H, m), 6,80-6,81 (1H, m), 7,15-7,17 (2H, m), 7,30-7,32 (1H, m), 7,40-7,43 (2H, m), 7,48-7,51 (1H, m), 7,
2-8	RMN 1H (CDCI3) δ : 2,54-2,65 (1H, m), 2,88-2,96 (1H, m), 3,50-3,68 (2H, m), 3,84 (1H, d), 4,13 (1H, d), 6,71 (2H, d), 7,30 (2H, d), 7,41 (1H, t), 7,54 (2H, d), 8,85 (1H, s).
2-29	RMN 1H (CDCI3) δ : 2,14 (3H, s), 2,54-2,64 (1H, m), 2,87-2,95 (1H, m), 3,49-3,65 (2H, m), 3,83 (1H, d), 4,12 (1H, d), 6,51-6,54 (2H, m), 7,17 (1H, d), 7,30 (2H, d), 7,41 (1H, t), 8,68 (1H, s).
2-31	RMN 1H (CDCI3) δ : 2,59-2,69 (1H, m), 2,92-3,01 (1H, m), 3,57-3,73 (2H, m), 3,88 (1H, d), 4,18 d), 6,83 (1H, dd), 6,94 (1H, d), 7,44-7,30 (4H, m), 8,73 (1H, s).
2-40	RMN 1H (DMSO-d6) δ : 2,62-2,73 (1H, m), 2,95-3,03 (1H, m), 3,49-3,55 (2H, m), 3,90 (1H, d), 4,31 (1H, d), 7,09 (1H, dd), 7,29 (1H, d), 7,61 (1H, d), 7,68 (2H, d), 7,71 (1H, t), 8,26 (1H, s). 8,98
3-3	RMN 1H (CDCI3) δ : 1,99 (3H, s), 2,50-2,58 (1H, m), 2,82-2,87 (1H, m), 3,45-3,51 (2H, m), 3,74 (1H, d), 4,02 (1H, d), 4,41 (2H, d), 6,43-6,46 (1H, m), 6,58 (1H, d), 7,26-7,38 (4H, m).

ES 2 379 845 T3

(Continuación)

	RMN 1H
3-4	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 1,98-2,02 (3H, m), 2,53-2,61 (1H, m), 2,81-2,89 (1H, m), 3,46-3,52 (2H, m), 3,74 (1H, d), 4,02 (1H), 4,42-4,44 (2H, m), 5,78-5,81 (1H, m), 6,49-6,51 (1H, m), 6,77 (1H, d),
3-11	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 2,13-2,18 (3H, m), 2,51-2,53 (1H, m), 2,81-2,83 (1H, m), 3,45-3,56 (2H, m), 3,75-3,78 (1H, m), 4,01-4,04 (1H, m), 4,25 (1H, s), 4,57 (1H, s), 6,40-6,44 (2H, m), 6,93-6,96 (1H),
3-102	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 2,03 (3H, s), 2,53-2,60 (1H, m), 2,83-2,91 (1H, m), 3,51-3,59 (2H, m), 3,78-3,82 (1H, m), 4,07-4,13 (1H, m), 4,50-4,55 (2H, m), 5,72-5,76 (1H, m), 6,70-6,78 (2H, m), 7,27-
3-113	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 1,99 (3H, s), 2,58-2,68 (1H, m), 2,99-3,03 (1H, m), 3,51-3,67 (2H, m), 3,83-3,86 (1H, m), 4,18-4,21 (1H, m), 4,50 (2H, d), 5,73-5,76 (1H, m), 6,74-6,81 (2H, m), 7,47-7,50
4-1	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 2,56-2,64 (1H, m), 2,89-2,98 (1H, m), 3,63-3,67 (2H, m), 3,87 (1H, d), 4,19 d), 6,57 (2H, d), 7,27 (2H, s a), 7,42 (1H, t), 8,18 (2H, d).
4-2	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 2,51-2,62 (1H, m), 2,86-2,94 (1H, m), 3,56-3,61 (2H, m), 3,80 (1H, d), 4,12 (1H, d), 6,59 (2H, d), 7,26 (2H, s a), 7,41 (1H, t), 7,52 (2H, d).
4-3	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 2,45-2,54 (1H, m), 2,74-2,82 (1H, m), 3,34-3,47 (4H, m), 3,73 (1H, d), 3,93 (1H, d), 6,49-6,51 (2H, m), 6,67-6,71 (2H, m), 7,30 (2H, s a), 7,36 (1H, t).
4-5	RMN 1H (DMSO-d ₆) δ: 2,58-2,72 (1H, m), 2,88-3,01 (1H, m), 3,41-3,53 (2H, m), 3,85 (1H, d), 4,26 (1H, d), 6,71 (2H, d), 7,65-7,72 (3H, m), 7,78 (2H, d), 12,25 (1H, s a).
4-6	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 2,53-2,67 (1H, m), 2,89-2,97 (1H, m), 3,50-3,71 (2H, m), 3,83 (1H, d), 3,85 (3H, s), 4,15 (1H, d), 6,69 (1H, dd), 6,75 (1H, d), 7,26 (3H, s), 7,42 (1H, t), 7,81 (1H, d).
4-7	RMN 1H (DMSO-d ₆) δ: 2,58-2,72 (1H, m), 2,91-3,04 (1H, m), 3,47-3,57 (2H, m), 3,87 (1H, d), 4,32 (1H, d), 6,86 (1H, dd), 7,04 (1H, d), 7,65 (2H, d), 7,71 (1H, t), 7,78 (1H, d).
4-8	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 2,46-2,56 (1H, m), 2,79-2,85 (1H, m), 3,52-3,57 (2H, m), 3,76-3,86 (4H, m), 4,01-4,12 (1H, m), 5,68-5,76 (2H, m), 5,87-5,99 (1H, m), 6,26-6,32 (2H, m), 7,38-7,41 (1H, m),
4-10	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 2,53-2,58 (1H, m), 2,86-2,92 (1H, m), 3,52-3,62 (2H, m), 3,80 (1H, d), 3,87 (3H, s), 4,11 (1H, d), 6,45-6,48 (1H, m), 6,61 (1H, d), 7,26-7,27 (2H, m), 7,40-7,41 (1H, m), 7,88
4-11	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 1,59 (9H, s), 2,54-2,56 (1H, m), 2,84-2,92 (1H, m), 3,53-3,56 (2H, m), 3,79 (1H, d), 4,09 (1H, d), 6,43-6,46 (1H, m), 6,58 (1H, d), 7,24-7,26 (2H, m), 7,40-7,40 (1H, m), 7,80
4-12	RMN 1H (acetona-d ₆) δ: 2,74-2,84 (1H, m), 3,05-3,10 (1H, m), 3,64-3,69 (2H, m), 4,04 (1H, d), 4,40 (1H, d), 6,70-6,77 (2H, m), 7,55-7,65 (3H, m), 7,91 (1H, d).
4-13	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 2,53-2,60 (1H, m), 2,84-2,93 (1H, m), 3,52-3,62 (2H, m), 3,80-3,87 (4H, m), 4,11 (1H, d), 6,49-6,52 (1H, m), 6,84 (1H, d), 7,26-7,27 (2H, m), 7,40-7,41 (1H, m), 7,87 (1H, d).
4-14	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 2,51-2,56 (1H, m), 2,85-2,86 (1H, m), 3,51-3,57 (2H, m), 3,74-3,87 (4H, m), 4,09 (1H, d), 6,54-6,56 (1H, m), 7,17-7,18 (1H, m), 7,27-7,31 (2H, m), 7,38-7,39 (1H, m), 7,85
4-15	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 2,53-2,60 (4H, m), 2,84-2,85 (1H, m), 3,52-3,62 (2H, m), 3,79-3,84 (4H, m), (1H, d), 6,39-6,44 (2H, m), 7,26-7,29 (2H, m), 7,39-7,39 (1H, m), 7,91-7,94 (1H, m).
4-16	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 2,27 (3H, s), 2,49-2,54 (1H, m), 2,78-2,87 (1H, m), 3,38-3,54 (2H, m), 3,74 (1H, d, J = 10,4 Hz), 3,99 (1H, d, J = 10,4 Hz), 6,40-6,43 (1H, m), 6,60-6,62 (1H, m), 7,05-7,08
4-18	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 2,51-2,64 (1H, m), 2,67 (3H, s), 2,87-2,95 (1H, m), 3,51-3,71 (2H, m), 3,84 (1H, d), 4,17 (1H, d), 6,37 (1H, d), 6,45 (1H, dd), 7,28 (2H, s a), 7,41 (1H, t), 8,14 (1H, d).
4-19	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 2,19 (3H, s), 2,41-2,58 (1H, m), 2,73-2,81 (1H, m), 3,15-3,51 (4H, m), 3,73 (1H, d), 3,92 (1H, d), 6,34-6,44 (2H, m), 6,66 (1H, d), 7,31-7,41 (3H, m).
4-20	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 2,53-2,66 (1H, m), 2,89-2,97 (1H, m), 3,51-3,71 (2H, m), 3,83 (1H, d), 4,16 (1H, d), 6,53 (1H, dd), 6,84 (1H, d), 7,27 (2H, s a), 7,42 (1H, t), 8,07 (1H, d).

ES 2 379 845 T3

(Continuación)

	RMN 1H
4-21	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 2,44-2,54 (1H, m), 2,75-2,83 (1H, m), 3,32-3,50 (2H, m), 3,56-3,76 (3H, m), (1H, d), 6,46 (1H, dd), 6,70-6,78 (2H, m), 7,29 (2H, s a), 7,37 (1H, t).
4-23	RMN 1H (DMSO-d ₆) δ: 2,63-2,75 (1H, m), 2,96-3,12 (1H, m), 3,49-3,59 (2H, m), 3,91 (1H, d), 4,41 (1H, d), 6,88 (1H, dd), 7,06 (1H, d), 7,67-7,90 (5H, m), 13,00 (1H, s a).
4-24	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 2,61-2,73 (1H, m), 3,03-3,13 (1H, m), 3,58-3,75 (2H, m), 3,85 (3H, s), 3,89 (1H, d), 4,29 (1H, d), 6,73 (1H, dd), 6,79 (1H, d), 7,80-7,85 (3H, m), 7,95 (1H, s a).
4-25	RMN 1H (DMSO-d ₆) δ: 2,66-2,80 (1H, m), 3,11-3,22 (1H, m), 3,51-3,61 (2H, m), 3,93 (1H, d), 4,51 (1H, d), 6,90 (1H, d), 7,06 (1H, s a), 7,81 (1H, t), 8,22 (3H, s a), 13,03 (1H, s a).
4-26	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 2,54-2,64 (1H, m), 2,89-2,97 (1H, m), 3,50-3,69 (2H, m), 3,84 (1H, d), 3,85 (3H, s), 4,15 (1H, d), 6,68 (1H, dd), 6,74 (1H, d), 7,22 (1H, dd), 7,47-7,52 (2H, m), 7,81 (1H, t).
4-27	RMN 1H (DMSO-d ₆) δ: 2,59-2,74 (1H, m), 2,90-3,00 (1H, m), 3,49-3,57 (2H, m), 3,90 (1H, d), 4,30 (1H, d), 6,86 (1H, dd), 7,03 (1H, d), 7,55 (1H, d), 7,73-7,86 (3H, m), 12,98 (1H, s a).
4-29	RMN 1H (DMSO-d ₆) δ: 2,59-2,71 (1H, m), 2,90-3,01 (1H, m), 3,49-3,57 (2H, m), 3,89 (1H, d), (1H, d), 6,87 (1H, dd), 7,05 (1H, d), 7,50 (3H, s a), 7,64 (1H, s a), 7,78 (1H, d), 13,00 (1H, t).
4-32	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 2,36 (6H, s), 2,56-2,66 (1H, m), 2,92-3,00 (1H, m), 3,52-3,69 (2H, m), 3,93-(4H, m), 4,17 (1H, d), 6,69 (1H, dd), 6,75 (1H, d), 7,14 (2H, s), 7,81 (1H, d).
4-33	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 2,63-2,73 (1H, m), 3,01-3,09 (1H, m), 3,55-3,73 (2H, m), 3,85 (3H, s), 3,92 (1H, d), 4,26 (1H, d), 6,71 (1H, dd), 6,77 (1H, d), 7,62-7,83 (3H, m), 8,27-8,31 (2H, m).
4-47	RMN 1H (DMSO-d ₆) δ: 2,66-2,77 (1H, m), 3,01-3,10 (1H, m), 3,50-3,62 (2H, m), 3,95 (1H, d), (1H, d), 6,89 (1H, d), 7,08 (1H, s), 7,75-7,81 (2H, m), 8,03 (1H, d), 8,28-8,35 (2H, m), 13,02
4-48	RMN 1H (DMSO-d ₆) δ: 2,60-2,72 (1H, m), 2,94-3,05 (1H, m), 3,50-3,57 (2H, m), 3,90 (1H, d), (1H, d), 6,87 (1H, d), 7,03 (1H, s), 7,79 (1H, d, J = 9,0 Hz), 7,88 (2H, s), 13,03 (1H, s).
4-49	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 2,64-2,75 (1H, m), 3,18-3,25 (1H, m), 3,55-3,63 (2H, m), 3,84 (3H, s), 3,98 (1H, d), 4,50 (1H, d), 6,67-6,74 (2H, m), 7,32-7,48 (4H, m), 7,82 (1H, d).
4-50	RMN 1H (DMSO-d ₆) δ: 2,67-2,78 (1H, m), 3,23-3,37 (1H, m), 3,46-3,64 (2H, m), 3,91 (1H, d), (1H, d), 6,86 (1H, dd), 7,04 (1H, d), 7,43-7,56 (3H, m), 7,64-7,68 (1H, m), 7,80 (1H, d), 13,01
4-51	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 2,55-2,65 (1H, m), 2,89-2,98 (1H, m), 3,49-3,67 (2H, m), 3,84 (3H, s), 3,86 (1H, d), 4,14 (1H, t), 6,66 (1H, dd), 6,73 (1H, d), 7,32 (2H, d), 7,40 (2H, d), 7,80 (1H, d).
4-52	RMN 1H (DMSO-d ₆) δ: 2,58-2,68 (1H, m), 2,88-2,96 (1H, m), 3,45-3,60 (2H, m), 3,90 (1H, d), (1H, d), 6,85 (1H, dd), 7,03 (1H, d), 7,52 (2H, d), 7,57 (2H, d), 7,78 (1H, d), 13,02 (1H, s a).
4-53	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 1,37 (3H, t), 2,56-2,61 (1H, m), 2,89-2,94 (1H, m), 3,58-3,66 (2H, m), 3,82-3,85 (1H, m), 4,12-4,16 (1H, m), 4,35 (2H, c), 6,67-6,70 (1H, m), 6,88-6,89 (1H, m), 7,25-7,28
4-56	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 2,53-2,63 (1H, m), 2,88-2,97 (1H, m), 3,53-3,69 (2H, m), 3,82 (2H, d), 3,85 (3H, s), 4,14 (1H, d), 6,69 (1H, dd), 6,75 (1H, d), 7,41 (2H, s), 7,81 (1H, d).
4-57	RMN 1H (DMSO-d ₆) δ: 2,64-2,67 (1H, m), 2,93-3,00 (1H, m), 3,49-3,52 (2H, m), 3,88-3,90 (1H, m), 4,31-4,35 (1H, m), 6,92-6,95 (1H, m), 7,18-7,21 (1H, m), 7,67-7,69 (3H, m), 7,89-7,92 (1H, m)
4-58	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 2,57-2,63 (1H, m), 2,91-2,96 (1H, m), 3,52-3,69 (2H, m), 3,82-3,86 (1H, m), 3,94 (3H, s), 4,11-4,18 (1H, m), 6,73-6,76 (1H, m), 6,89-6,90 (1H, m), 7,27-7,42 (3H, m), 8,01-
4-59	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 1,63 (9H, s), 2,53-2,63 (1H, m), 2,87-2,95 (1H, m), 3,53-3,69 (2H, m), 3,84 (1H, d), 4,13 (1H, d), 6,86 (1H, dd), 7,28 (2H, d), 7,41 (1H, t), 7,95 (1H, d), 8,10 (1H, d).
4-60	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 2,58-2,69 (1H, m), 2,93-3,02 (1H, m), 3,63-3,73 (2H, m), 3,93 (1H, d), 4,27 (1H, d), 7,18 (1H, d), 7,26 (1H, s), 7,30 (2H, s), 7,41 (1H, s), 8,13 (1H, d), 8,20 (1H, s), 9,92 (1H, t).

ES 2 379 845 T3

(Continuación)

	RMN 1H
4-61	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 1,37 (3H, t), 2,60-2,71 (1H, m), 3,01-3,09 (1H, m), 3,60-3,71 (2H, m), 3,88-(1H, m), 4,28-4,36 (3H, m), 6,71-6,74 (1H, m), 6,91-6,91 (1H, m), 7,84-7,97 (4H, m)
4-62	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 2,51-2,61 (1H, m), 2,83-2,91 (1H, m), 3,43-3,58 (2H, m), 3,77 (1H, d), 4,03 (1H, d), 6,71-6,66 (2H, m), 7,10 (1H, t), 7,29 (2H, s), 7,39 (1H, s).
4-63	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 2,57-2,68 (1H, m), 2,93-3,01 (1H, m), 3,75-3,59 (2H, m), 3,87 (1H, d), 4,20 (1H, d), 6,70 (1H, dd), 6,88 (1H, d), 7,28 (2H, d), 7,43 (1H, t), 8,08 (1H, d).
4-65	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 1,37 (3H, t), 2,53-2,58 (1H, m), 2,85-2,93 (1H, m), 3,53-3,62 (2H, m), 3,78-3,81 (1H, m), 4,08-4,16 (1H, m), 4,34 (2H, c), 6,25-6,36 (2H, m), 7,28-7,33 (3H, m), 7,84-7,87
4-66	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 1,36 (3H, t), 2,55-2,62 (1H, m), 2,86-2,94 (1H, m), 3,57-3,63 (2H, m), 3,80-3,84 (1H, m), 4,12-4,15 (1H, m), 4,33 (2H, c), 6,67-6,70 (1H, m), 6,87-6,88 (1H, m), 7,41-7,45
5-1	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 2,50-2,68 (2H, m), 2,74-2,82 (1H, m), 2,90-2,98 (1H, m), 3,16-3,20 (1H, m), 3,61-3,75 (3H, m), 7,20-7,41 (9H, m).
5-2	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 2,45-2,55 (1H, m), 2,76-2,85 (1H, m), 3,00-3,09 (1H, m), 3,22-3,35 (2H, m), 4,10 (1H, d), 7,23-7,44 (4H, m).
5-3	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 2,33-2,42 (1H, m), 2,55-2,63 (1H, m), 2,74-2,78 (2H, m), 3,09 (1H, d), 3,18 (1H, d), 3,67 (2H, s), 7,26-7,38 (9H, m).
5-4	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 2,28-2,38 (1H, m), 2,49-2,59 (1H, m), 2,97-3,06 (1H, m), 3,19-3,30 (2H, m), 3,75 (1H, d), 7,28-7,33 (4H, m).
5-5	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 2,31-2,41 (1H, m), 2,55-2,63 (1H, m), 2,70-2,81 (2H, m), 3,08 (1H, d), 3,18 (1H, d), 3,66 (2H, s), 7,24-7,33 (9H, m).
5-6	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 2,27-2,36 (1H, m), 2,49-2,59 (1H, m), 2,96-3,05 (1H, m), 3,20-3,29 (2H, m), 3,76 (1H, d), 7,28-7,36 (4H, m).
5-7	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 2,50-2,66 (2H, m), 2,76-2,84 (1H, m), 2,91-2,99 (1H, m), 3,16 (1H, dd), 3,61-(3H, m), 7,17 (1H, t), 7,25-7,35 (6H, 7,46 (1H,
5-8	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 2,41-2,53 (1H, m), 2,78-2,87 (1H, m), 3,00-3,09 (1H, m), 3,23-3,32 (2H, m), (1H, d), 7,18-7,30 (2H, m), 7,48 (1H, dd).
5-9	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 2,28-2,37 (1H, m), 2,54-2,62 (1H, m), 2,70-2,82 (2H, m), 3,06 (1H, d), 3,13 (1H, d), 3,66 (2H, s), 7,21-7,33 (6H, m), 7,41 (1H, d), 7,49 (1H, d).
5-10	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 2,25-2,34 (1H, m), 2,50-2,59 (1H, m), 2,97-3,08 (1H, m), 3,20-3,28 (2H, m), (1H, d), 7,20 (1H, d), 7,44 (2H, d).
5-11	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 2,27-2,36 (1H, m), 2,53-2,62 (1H, m), 2,69-2,83 (2H, m), 3,08 (2H, dd), 3,67
5-12	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 2,24-2,33 (1H, m), 2,51-2,56 (1H, m), 2,97-3,07 (1H, m), 3,19-3,26 (2H, m), 3,74 (1H, d), 7,25 (2H, d), 7,35 (1H, t).
5-14	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 2,24-2,34 (1H, m), 2,53-2,61 (1H, m), 2,67-2,87 (2H, m), 3,06 (2H, dd), 3,67 (2H, dd), 7,24-7,43 (7H, m).
5-15	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 2,22-2,32 (1H, m), 2,49-2,58 (1H, m), 2,98-3,08 (1H, m), 3,20-3,29 (2H, m),
5-16	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 2,35-2,44 (1H, m), 2,60-2,68 (1H, m), 2,72-2,85 (2H, m), 3,16 (2H, dd), 3,68 (2H, dd), 7,28-7,34 (5H, m), 7,46 (1H, t), 7,55-7,60 (2H, m), 7,66 (1H, s).
5-17	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 2,32-2,41 (1H, m), 2,55-2,65 (1H, m), 2,98-3,07 (1H, m), 3,21-3,33 (2H, m), 3,82 (1H, d), 7,47-7,62 (4H, m).
5-18	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 2,29-2,40 (1H, m), 2,63-2,77 (2H, m), 2,88-2,96 (1H, m), 3,09 (1H, d), 3,16 (1H, d), 3,62 (1H, d), 3,76 (1H, d, J = 13,0 Hz), 7,28-7,34 (5H, m), 7,83 (1H, s), 7,89 (2H, s).

ES 2 379 845 T3

(Continuación)

	RMN 1H
5-19	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 2,30-2,39 (1H, m), 2,61-2,70 (1H, m), 3,02-3,10 (1H, m), 3,24-3,33 (2H, m), 3,86 (1H, d), 7,81 (2H, s), 7,87 (1H, s).
5-24	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 2,35-2,44 (1H, m), 2,63-2,90 (3H, m), 3,17 (2H, s), 3,69 (2H, dd), 7,26-7,34 (5H, m) 7,53 (1H, t), 7,74 (1H, d), 8,18 (1H, dc), 8,34 (1H, s).
5-25	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 2,34-2,43 (1H, m), 2,59-2,69 (1H, m), 3,01-3,10 (1H, m), 3,24-3,35 (2H, m), 3,85 (1H, d), 7,57 (1H, t), 7,72 (1H, d), 8,20-8,27 (2H, m).
5-26	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 2,31-2,42 (7H, m), 2,55-2,63 (1H, m), 2,75-2,80 (2H, m), 3,11 (2H, dd), 3,67
5-27	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 2,29-2,38 (7H, m), 2,51-2,60 (1H, m), 2,97-3,07 m), 3,21-3,31 (2H, m),
6-1	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 2,34 (6H, s), 5,78-5,80 (1H, m), 6,03-6,04 (1H, m), 7,20 (2H, s).
7-1	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 2,52-2,63 (1H, m), 2,88-2,96 (1H, m), 3,60-3,77 (2H, m), 4,00 (1H, d), 4,18-4,07 (2H, m), 4,48 (1H, d), 6,16 (1H, t), 6,43 (1H, d), 7,30 (2H, d), 7,39 (1H, t), 7,95 (1H, dd), 8,62
7-2	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 2,52-2,62 (1H, m), 2,87-2,96 (1H, m), 3,59-3,75 (2H, m), 4,01 (1H, d), 4,48 (1H, d), 4,75 (2H, d), 6,43 (1H, d), 7,25-7,20 (1H, m), 7,31 (2H, d), 7,39 (1H, t), 7,47 (1H, s), 7,69
7-3	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 2,49-2,57 (CH, m). 2,60 (3H, s), 2,84-2,92 (1H, m), 3,59-3,70 (2H, m), 3,95-4,15 (3H, m), 4,45 (1H, d), 5,94 (1H, s a), 6,23 (1H, d), 7,26-7,39 (4H, m), 7,58 (1H, d)
7-7	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 2,54-2,61 (1H, m), 2,89-2,94 (1H, m), 3,65-3,68 (2H, m), 3,94-3,98 (1H, m), 4,10-4,16 (2H, m), 4,45-4,48 (1H, m), 6,37-6,40 (1H, m), 7,23-7,38 (4H, m), 8,12-8,15 (1H, m)
7-25	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 2,54-2,61 (1H, m), 2,88-2,92 (1H, m), 3,64-3,70 (2H, m), 3,98 (1H, d), 4,44 (1H, d), 4,73 (2H, d), 6,54 (1H, d). 7,14-7,40 (6H, m), 7,69-7,74 (2H, m), 8,52 (1H, d)
7-26	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 2,53-2,63 (1H, m), 2,88-2,96 (1H, m), 3,68-3,71 (2H, m), 4,05-4,16 (3H, m), 4,45 (1H, d), 6,03 (1H, s a), 6,55 (1H, d), 7,24-7,37 (4H, m), 7,72 (1H, d)
8-23	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 2,55-2,65 (1H, m), 2,92-2,97 (1H, m), 3,69-3,77 (2H, m), 3,97-4,01 (1H, m), 4,47-4,51 (1H, m), 4,75 (2H, d), 6,62 (1H, s), 7,24-7,36 (6H, m), 7,68-7,70 (1H, m), 8,51-8,52 (2H,
8-24	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 2,58-2,63 (1H, m), 2,93-2,97 (1H, m), 3,71-3,74 (2H, m), 3,96-4,09 (3H, m), 4,47-4,51 (1H, m), 6,42-6,44 (1H, m), 6,61 (1H, s), 7,30 (2H, s), 7,40 (1H, s), 8,41 (1H, s)
8-25	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 2,55-2,65 (1H, m), 2,91-2,97 (1H, m), 3,68-3,73 (2H, m), 3,97-4,01 (1H, m), 4,48-4,52 (1H, m), 5,74-5,77 (2H, m), 6,62 (1H, s), 7,20-7,37 (3H, m), 8,52 (1H, s)
11-47	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 1,37 (3H, t, J = 7,1 Hz), 2,55-2,66 (1H, m), 2,91-2,99 (1H, m), 3,73-3,75 (2H, m), 4,00-4,04 (1H, m), 4,36 (2H, c, J = 7,1 Hz), 4,49-4,54 (1H, m), 6,65 (1H, s), 7,30 (2H, s), 7,40
12-4	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 2,52-2,62 (1H, m), 2,87-2,95 (1H, m), 3,61-3,75 (2H, m), 3,88 (3H, s), 4,01 d), 4,50 (1H, d), 6,39 (1H, d), 7,31 (2H, s), 7,39 (1H, s), 8,06 (1H, dd), 8,84 (1H, d).
12-5	RMN 1H (DMSO-d ₆) δ: 2,61-2,72 (1H, m), 2,90-3,01 (1H, m), 3,57-3,66 (2H, m), 3,96 (1H, d), 4,49 (1H, d), 6,67 (1H, d), 7,65 (2H, s), 7,70 (1H, t), 7,97 (1H, dd), 8,66 (1H, d), 12,46 (1H, s a).
12-10	RMN 1H (CDCl ₃) δ: 2,54-2,59 (1H, m), 2,87-2,95 (1H, m), 3,66-3,68 (2H, m), 3,88-3,97 (4H, m), 4,45-4,48 (1H, m), 6,30 (1H, d), 7,28-7,30 (2H, m), 7,39 (1H, s), 8,05-8,08 (1H, m)

Ejemplo de Ensayo Biológico 1: Ensayo para larvas de *Spodoptera litura*

Disolvente: 3 partes en peso de dimetilformamida, Emulsionante: 1 parte en peso de polioxietilen alquil fenil éter.

Para preparar un compuesto activo adecuado, se mezcla 1 parte en peso del compuesto activo con la cantidad anterior del disolvente que contiene la cantidad anterior del emulsionante, y la mezcla se diluye con agua a la concentración prescrita.

5

5 Se sumergen hojas de batata en la solución de muestra diluida con agua a una concentración prescrita y, después de que se seque al aire la solución que se deposita en las hojas, las hojas resultantes se ponen en una placa de laboratorio de 9 cm de diámetro, en la que se liberan después 10 larvas de tercera etapa de *Spodoptera litura*, y la placa se pone después en una sala con temperatura controlada a 25 °C, seguido de adición de hojas de batata a la placa el segundo día y el cuarto día y la investigación del número de insectos muertos después de 7 días para calcular la relación de insecticida.

Los resultados son las medias de dos placas de laboratorio por grupo en este ensayo.

10 Los compuestos N° 1-3, 1-4, 1-7, 1-8, 1-9, 1-10, 1-11, 1-12, 1-14, 1-15, 1-16, 1-22, 1-23, 1-25, 1-54, 1-55, 1-56, 1-57, 1-63, 1-73, 1-75, 1-81, 1-83, 1-85, 1-86, 1-87, 1-88, 1-90, 1-91, 1-93, 2-8, 2-23, 2-29, 2-40, 2-41, 3-3 y 3-4 mostraron 100 % de tasa de muerte a una concentración de 100 ppm del compuesto activo.

Ejemplo de Ensayo Biológico 2: Ensayo para *Tetranychus urticae* (ensayo de pulverización)

Para preparar una formulación apropiada de un compuesto activo, se mezcla una parte en peso del compuesto activo con la cantidad anteriormente mencionada del disolvente que contiene la cantidad anteriormente mencionada del emulsionante, y la mezcla se diluye a una concentración prescrita con agua.

15 Se inoculan de 50 a 100 ácaros adultos de *Tetranychus urticae* a hojas de alubia en la etapa de dos hojas plantada en una maceta de 6 cm de diámetro. Un día después, se pulveriza una cantidad abundante de la solución acuosa diluida de la concentración prescrita de un compuesto activo con una pistola de pulverización. Después de la pulverización, la maceta se mantiene en un invernadero durante 7 días y se calcula la tasa de acaricida usando los siguientes criterios de evaluación:

Tasa acaricida	
100	todos los ácaros inoculados están muertos
98	de 1 a 4 ácaros sobrevivieron / se propagaron
90	de 5 a 20 ácaros sobrevivieron / se propagaron
60	muchos ácaros sobrevivieron / se propagaron, pero menos que el control no tratado, se observan algunos cuerpos muertos
0	no se observó diferencia con el control no tratado

20 Los compuestos N° 1-3, 1-4, 1-7, 1-8, 1-9, 1-10, 1-12, 1-14, 1-15, 1-16, 1-17, 1-20, 1-22, 1-23, 1-25, 1-54, 1-55, 1-56, 1-57, 1-75, 1-81, 1-84, 1-86, 1-87, 1-90, 2-29, 3-3 y 3-4 mostraron una tasa acaricida de más del 98 % a una concentración de 500 ppm del compuesto activo.

Ejemplo de Ensayo Biológico 3: Ensayo para *Aulacophora femoralis* (ensayo de pulverización)

25 Disolvente: Dimetilformamida 3 partes en peso
Emulsionante: Polioxietilen alquil fenil éter 1 parte en peso

Para preparar una formulación apropiada de un compuesto activo, se mezcla 1 parte en peso del compuesto activo con la cantidad anteriormente mencionada del disolvente que contiene la cantidad anteriormente mencionada del emulsionante, y la mezcla se diluye a una concentración prescrita con agua.

30 Las hojas de pepino se empapan en una solución acuosa diluida de la concentración prescrita de un compuesto activo preparado de la misma manera que en los ensayos anteriormente mencionados, se secan al aire y se colocan en un vaso de plástico que contiene suelo negro esterilizado. En este vaso, se liberan después 5 larvas de *Aulacophora femoralis* en la segunda fase. Después de 7 días, se cuenta el número de larvas muertas para calcular la tasa de muerte.

35 Los compuestos N° 1-3, 1-4, 1-7, 1-8, 1-9, 1-10, 1-11, 1-12, 1-14, 1-15, 1-16, 1-17, 1-18, 1-20, 1-21, 1-22, 1-23, 1-24, 1-25, 1-54, 1-55, 1-56, 1-57, 1-60, 1-61, 1-80, 1-81, 1-85, 1-87, 1-88, 1-90, 1-91, 2-29, 3-3 y 3-4 mostraron 100 % de tasa de muerte a una concentración de 100 ppm del compuesto activo.

Ejemplo de Ensayo Biológico 4: Ensayo contra *Myzus persicas* resistente a agente de carbamato y agente de fósforo orgánico.

40 Disolvente: Dimetilformamida 3 partes en peso
Emulsionante: Polioxietilen alquil fenil éter 1 parte en peso

Para preparar una formulación apropiada de un compuesto activo, se mezcla 1 parte en peso del compuesto activo con la cantidad anteriormente mencionada del disolvente que contiene la cantidad anteriormente mencionada del

emulsionante, y la mezcla se diluye a una concentración prescrita con agua.

- 5 Se inoculan con aproximadamente 30 a 50 adultos de *Myzus persicae* resistente a agente de carbamato y agente de fósforo orgánico por plántula hojas de berenjena en la etapa de dos hojas cultivada en una maceta de 6 cm de diámetro. Un día después de la inoculación, se pulveriza una cantidad abundante de la solución acuosa diluida de la concentración prescrita de un compuesto activo preparado de la misma manera que en los ensayos anteriormente mencionados con una pistola de pulverización. Después de la pulverización, la maceta se mantiene en un invernadero a 28 °C durante 7 días, se calcula la tasa de muerte. El ensayo se duplica.

Los compuestos N° 1-7, 1-10, 1-14 y 1-16 mostraron 98 % de tasa de muerte a una concentración de 500 ppm del compuesto activo.

10 **Ejemplo de Ensayo Biológico 5: Ensayo para *Ctenocephalides felis*.**

Disolvente: Dimetilformamida

Para preparar una formulación apropiada de un compuesto activo, se disuelven 10 mg del compuesto activo en 0,5 ml del disolvente anteriormente mencionado, y la mezcla se diluye a una concentración prescrita con sangre de animales domésticos.

- 15 Se mantuvieron aproximadamente 10 a 15 adultos de *Ctenocephalides felis* en un recipiente específico para pulgas. Se cubre otro recipiente que contiene la solución de sangre que contiene el compuesto preparado como se ha descrito anteriormente con una película de laboratorio [PARAFILM (marca comercial)]. El recipiente que contiene sangre se pone boca abajo y se coloca en el recipiente específico de pulgas. Este sistema permite que *Ctenocephalides felis* chupe la sangre del recipiente. La solución de sangre se mantiene a 37 °C y el recipiente
20 específico de pulgas se mantiene a temperatura ambiente. Después de un cierto periodo de tiempo, se calcula la tasa de muerte de *Ctenocephalides felis*. Para este ensayo, la tasa de muerte de 100 % significa la muerte de todas las *Ctenocephalides felis*, mientras que la tasa de muerte de 0 % significa que todas las pulgas sobrevivieron.

En este ensayo biológico, los compuestos 1-16 mostraron más del 80 % de tasa de muerte a una concentración de 100 ppm del principio activo.

25 **Ejemplo de Ensayo Biológico 6: Ensayo para *Boophilus microplus***

Disolvente: Dimetilformamida

Para preparar una formulación apropiada de un compuesto activo, se disuelven 10 mg del compuesto activo en 0,5 ml del disolvente anteriormente mencionado y la mezcla se diluye a una concentración prescrita con agua.

- 30 Se inyecta una solución de un compuesto formulada como anteriormente en 5 *Boophilus microplus* hembras adultas completamente alimentadas en su abdomen. Estas *Boophilus microplus* se transfirieron a una placa de réplica y se mantienen en cabina de incubación durante un cierto periodo de tiempo.

Después de un cierto periodo de tiempo, se calcula la tasa de muerte de *Boophilus microplus*. En este ensayo, la tasa de muerte de 100 % significa muerte de todos los *Boophilus microplus*, mientras que la tasa de muerte de 0 % significa que todos los ácaros sobreviven.

- 35 En el ensayo biológico anterior, el compuesto 1-16 mostró más del 80 % de tasa de muerte a una dosis de 20 µg/animal de principio activo.

Ejemplo de Ensayo Biológico 7: Ensayo para *Lucillia cuprina*.

Disolvente: Dimetilformamida

- 40 Para preparar una formulación apropiada de un compuesto activo, se disuelven 10 mg del compuesto activo en 0,5 ml del disolvente anteriormente mencionado, y la mezcla se diluye a una concentración prescrita con agua.

Se colocan aproximadamente 20 a 30 larvas de *Lucillia cuprina* en un tubo de ensayo que contiene 1 cm³ de carne de caballo picada y 0,5 ml de una solución acuosa de un compuesto preparado como anteriormente.

- 45 Después de un cierto periodo de tiempo, se calcula la tasa de muerte de *Lucillia cuprina*. Para este ensayo, la tasa de muerte de 100 % significa muerte de todas las *Lucillia cuprina*, mientras que la tasa de muerte de 0 % significa que todos las moscas sobrevivieron.

En este ensayo biológico, el compuesto 1-16 mostró más del 80 % de tasa de muerte a una concentración de 100 ppm del principio activo.

Ejemplo de Formulación 1 (gránulos)

A una mezcla que contiene 10 partes de un compuesto de acuerdo con la invención, concretamente compuesto N°

1-3, 30 partes de bentonita (montmorillonita), 58 partes de talco y 2 partes de sal de ácido lignilsulfónico se añaden 25 partes de agua, y la mezcla se amasa bien y se granula con mallas de 10 a 40 por un granulador de extrusión y se seca a 40 a 50 °C para obtener gránulos.

Ejemplo de Formulación 2 (gránulos)

- 5 Se humectan 95 partes de gránulos de mineral de arcilla que tienen una distribución de diámetro de partículas dentro del intervalo de 0,2 a 2 mm, que se ponen en un mezclador rotatorio, de forma uniforme pulverizando 5 partes del compuesto de acuerdo con la invención, concretamente compuesto N° 1-3 junto con un diluyente líquido en condiciones rotatorias y se seca a 40 a 50 °C para obtener gránulos.

Ejemplo de Formulación 3 (emulsiones)

- 10 Se mezclan 30 partes del compuesto de acuerdo con la invención, concretamente compuesto N° 1-3, 55 partes de xileno, 8 partes de polioxietilen alquilfenil éter y 7 partes de alquilbencenosulfonato cálcico entre sí para obtener la emulsión.

Ejemplo de Formulación 4 (agente humectable)

- 15 Se mezclan 15 partes del compuesto de acuerdo con la invención, concretamente compuesto N° 1-3, 80 partes de una mezcla de carbono blanco (polvo fino de óxido de silicio amorfo hidratado) y arcilla en polvo (1 : 5), 2 partes de alquilbencenosulfonato sódico y 3 partes de condensado de alquilnaftalenosulfonato formalina sódica entre sí y la mezcla se tritura para obtener polvo dispersable en agua.

Ejemplo de Formulación 5 (gránulos humectables)

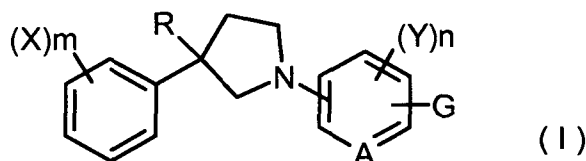
- 20 Se mezclan bien 20 partes del compuesto activo de acuerdo con la invención, concretamente compuesto N° 1-3, 30 partes de ligninsulfonato sódico, 15 partes de bentonita y 35 partes de polvo de tierra diatomea calcinada, y después de la adición de agua, que se extruye luego con una criba de 0,3 mm y se seca para obtener gránulos dispersables en agua.

Disponibilidad industrial

- 25 Las nuevas aril pirrolidinas de la invención tienen una excelente acción insecticida como insecticidas como se ha mostrado en ejemplos anteriores.

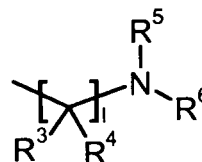
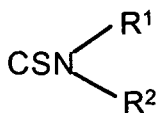
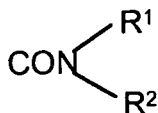
REIVINDICACIONES

1. Aril pirrolidinas representadas por la fórmula (I)



en la que

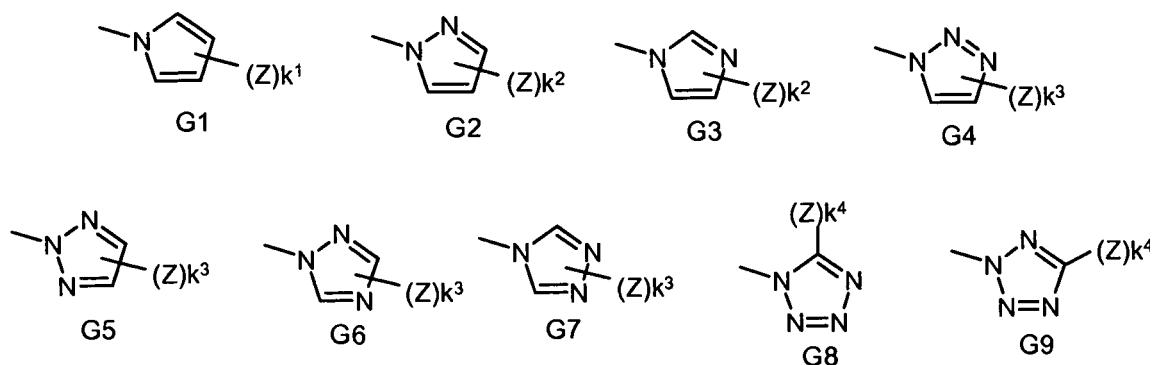
- 5 X que puede ser igual o diferente, representa halógeno, haloalquilo C₁₋₁₂, nitro, alquilo C₁₋₁₂, alcoxi C₁₋₁₂, ciano, haloalcoxi C₁₋₁₂, alquiltio C₁₋₁₂, alquilsulfinilo C₁₋₁₂, alquilsulfonilo C₁₋₁₂, haloalquiltio C₁₋₁₂, haloalquilsulfinilo C₁₋₁₂, haloalquilsulfonilo C₁₋₁₂, hidroxilo, mercapto, amino, alquilcarbonilamino C₁₋₁₂, haloalquilcarbonilamino C₁₋₁₂, benzoilamino, alcoxycarbonilamino C₁₋₁₂, haloalcoxycarbonilamino C₁₋₁₂, alquilsulfonilamino C₁₋₁₂ o haloalquilsulfonilamino C₁₋₁₂;
- 10 Y que puede ser igual o diferente, representa halógeno, haloalquilo C₁₋₁₂, nitro, alquilo C₁₋₁₂, alcoxi C₁₋₁₂, ciano, haloalcoxi C₁₋₁₂, alquiltio C₁₋₁₂, alquilsulfinilo C₁₋₁₂, alquilsulfonilo C₁₋₁₂, haloalquiltio C₁₋₁₂, haloalquilsulfinilo C₁₋₁₂, haloalquilsulfonilo C₁₋₁₂, hidroxilo, mercapto, amino, alquilcarbonilamino C₁₋₁₂, haloalquilcarbonilamino C₁₋₁₂, benzoilamino, alcoxycarbonilamino C₁₋₁₂, haloalcoxycarbonilamino C₁₋₁₂, alquilsulfonilamino C₁₋₁₂ o haloalquilsulfonilamino C₁₋₁₂;
- 15 R representa alquilo C₁₋₁₂ o haloalquilo C₁₋₁₂;
- m representa 0, 1, 2, 3, 4 ó 5;
- n representa 1, 2, 3 ó 4;
- G se selecciona entre el grupo que consiste en



20 en las que

- cada R¹ y R² representa independientemente hidrógeno; alquilo C₁₋₁₂ opcionalmente sustituido, alquenilo C₂₋₅, alquinilo C₂₋₅, cicloalquilo C₃₋₈ o alquilsulfonilo C₁₋₁₂; haloalquilsulfonilo C₁₋₁₂ o CH₂-R⁷; o cuando se toman juntos representan alquileo C₂₋₆;
- 25 cada R³ y R⁴ representa independientemente hidrógeno; ciano; alquilo C₁₋₁₂ opcionalmente sustituido, alquenilo C₂₋₅, alquinilo C₂₋₅, cicloalquilo C₃₋₈; o cuando se toman juntos representan alquileo C₂₋₆;
- l representa 1, 2 ó 3;
- R⁵ representa hidrógeno; alquilo C₁₋₁₂; cicloalquilo C₃₋₈ opcionalmente sustituido; haloalquilo C₁₋₁₂; ciano; alquenilo C₂₋₅; alquinilo C₂₋₅; alquilcarbonilo C₁₋₁₂ o CH₂-R⁷;
- 30 R⁶ representa formilo, ciano, alquilcarbonilo C₁₋₁₂, alquiltiocarbonilo C₁₋₁₂, haloalquilcarbonilo C₁₋₁₂, haloalquiltiocarbonilo C₁₋₁₂, alquilaminocarbonilo C₁₋₁₂, alquilaminotiocarbonilo C₁₋₁₂, dialquilaminocarbonilo C₁₋₁₂, dialquilaminotiocarbonilo C₁₋₁₂, alcoxiaminocarbonilo C₁₋₁₂, alcoxiaminotiocarbonilo C₁₋₁₂, alcoxycarbonilo C₁₋₁₂, alcoxitiocarbonilo C₁₋₁₂, tioalcoxycarbonilo C₁₋₁₂, tioalcoxitiocarbonilo C₁₋₁₂, CO-R⁷, CS-R⁷, alquilsulfinilo C₁₋₁₂ o haloalquilsulfinilo C₁₋₁₂; o como alternativa R⁵ y R⁶, cuando se toman junto con el nitrógeno al que están unidos, forman un anillo de 3-6 miembros que contiene al menos un átomo de N y, opcionalmente, al menos otro heteroátomo seleccionado entre S y O, en el que el anillo está opcionalmente sustituido con ceto o tioceto;
- 35

o se selecciona entre el grupo que consiste en los heterociclos G1 a G9:



en los que

Z que puede ser igual o diferente, representa halógeno, haloalquilo C₁₋₁₂, nitro, alquilo C₁₋₁₂, alcoxi C₁₋₁₂, ciano, haloalcoxi C₁₋₁₂, alquilsulfonilo C₁₋₁₂, haloalquilsulfonilo C₁₋₁₂, hidroxilo o mercapto;

k¹ representa 0, 1, 2, 3 ó 4;

k² representa 0, 1, 2 ó 3;

k³ representa 0, 1 ó 2;

k⁴ representa 0 ó 1;

R⁷ representa fenilo o un grupo heterocíclico de 5 ó 6 miembros sustituido o sin sustituir que contiene al menos un heteroátomo seleccionado entre N, O o S, en el que dicho anillo también se refiere a un grupo heterocíclico condensado que puede estar bezo-condensado; y

A representa C o N.

2. Los compuestos de acuerdo con la reivindicación 1, en los que

X, que puede ser igual o diferente, representa halógeno, haloalquilo C₁₋₆, nitro, alquilo C₁₋₆, alcoxi C₁₋₆, ciano, haloalcoxi C₁₋₆, alquiltio C₁₋₆, alquilsulfino C₁₋₆, alquilsulfonilo C₁₋₆, haloalquiltio C₁₋₆, haloalquilsulfino C₁₋₆, haloalquilsulfonilo C₁₋₆, hidroxilo, mercapto, amino, alquilcarbonilamino C₁₋₆, haloalquilcarbonilamino C₁₋₆, benzoilamino, alcocarbonilamino C₁₋₆, haloalcoxi C₁₋₆-carbonilamino, alquilsulfonilamino C₁₋₆ o haloalquil C₁₋₆-sulfonilamino;

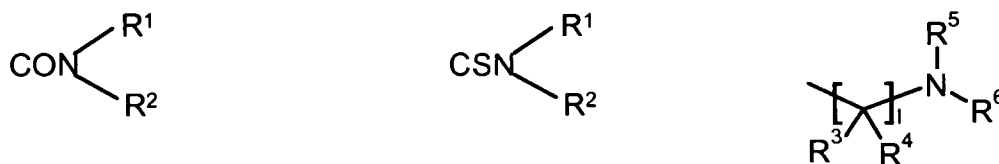
Y, que puede ser igual o diferente, representa halógeno, haloalquilo C₁₋₆, nitro, alquilo C₁₋₆, alcoxi C₁₋₆, ciano, haloalcoxi C₁₋₆, alquiltio C₁₋₆, alquilsulfino C₁₋₆, alquilsulfonilo C₁₋₆, haloalquiltio C₁₋₆, haloalquilsulfino C₁₋₆, haloalquilsulfonilo C₁₋₆, hidroxilo, mercapto, amino, alquilcarbonilamino C₁₋₆, haloalquilcarbonilamino C₁₋₆, benzoilamino, alcocarbonilamino C₁₋₆, haloalcoxi C₁₋₆-carbonilamino, alquilsulfonilamino C₁₋₆ o haloalquil C₁₋₆-sulfonilamino;

R representa alquilo C₁₋₆ o haloalquilo C₁₋₆;

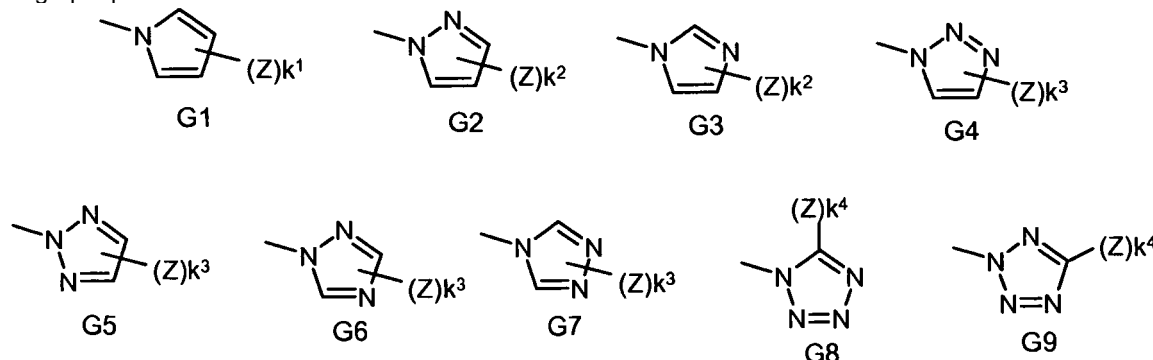
m representa 0, 1, 2, 3, 4 ó 5;

n representa 0, 1, 2, o 4;

G se selecciona entre el grupo que consiste en



o el grupo que consiste en los heterociclos G1 a G9:



en los que

cada R¹ y R² representa independientemente hidrógeno; alquilo C₁₋₆ opcionalmente sustituido, alquenilo C₂₋₆, alquinilo C₂₋₆, cicloalquilo C₃₋₇; alquilsulfonilo C₁₋₆, haloalquilsulfonilo C₁₋₆ o CH₂-R⁷; o cuando se toman juntos representan alquileo C₂₋₆;

cada R³ y R⁴ representa independientemente hidrógeno, ciano; alquilo C₁₋₆ opcionalmente sustituido, alquenilo C₂₋₆, alquinilo C₂₋₆, cicloalquilo C₃₋₇; o alcocarbonilo C₁₋₆; o cuando se toman juntos representan alquileo C₂₋₆;

I representa 1 ó 2 ó 3;

R⁵ representa hidrógeno; alquilo C₁₋₆; cicloalquilo C₃₋₇ opcionalmente sustituido; haloalquilo C₁₋₆; ciano; alquenilo C₂₋₆; alquinilo C₂₋₆; alquilcarbonilo C₁₋₆; o CH₂-R⁷;

R⁶ representa formilo, ciano, alquilcarbonilo C₁₋₆, alquiltiocarbonilo C₁₋₆, haloalquil C₁₋₆-carbonilo, haloalquiltiocarbonilo C₁₋₆, alquilaminocarbonilo C₁₋₆, alquilaminotio C₁₋₆-carbonilo, dialquilamino-carbonilo que tiene de 2 a 8 átomos de carbono, dialquilaminotio-carbonilo que tiene de 2 a 8 átomos de carbono, alcóxiaminocarbonilo C₁₋₆, alcóxiaminotiocarbonilo C₁₋₆, alcocarbonilo C₁₋₆, alcóxitiocarbonilo C₁₋₆, tioalcóxycarbonilo C₁₋₆, tioalcóxitiocarbonilo C₁₋₆, CO-R⁷, CS-R⁷, alquilsulfonilo C₁₋₆ o haloalquilsulfonilo C₁₋₆; o R⁵ y R⁶, cuando se toman junto con el nitrógeno al que están unidos, forman un anillo de 3-6 miembros que contiene al menos un átomo de N y, opcionalmente, al menos otro heteroátomo seleccionado entre S y O, en el que el anillo está opcionalmente sustituido con ceto o tioceto;

Z que puede ser igual o diferente, representa halógeno, haloalquilo C₁₋₆, nitro, alquilo C₁₋₆, alcóxi C₁₋₆, ciano, haloalcóxi C₁₋₆, alquilsulfonilo C₁₋₆, haloalquilsulfonilo C₁₋₆, hidroxilo o mercapto;

K¹ representa 0, 1, 2, 3 ó 4;

K² representa 0, 1, 2 ó 3;

k³ representa 0 ó 1;

k⁴ representa 0 ó 1;

R⁷ representa fenilo o un anillo heterocíclico como se ha definido en la reivindicación 1, que están opcionalmente sustituidos con al menos un sustituyente seleccionado entre flúor, cloro, bromo, yodo y alquilo C₁₋₆; y

A representa C o N.

3. Composición insecticida que comprende al menos un compuesto de acuerdo con la reivindicación 1 ó 2.

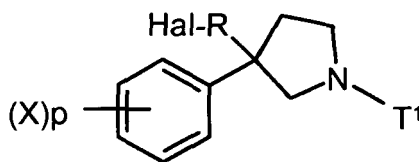
4. Procedimiento para controlar insectos y/o ácaros, que comprende la etapa de tratar insectos y/o ácaros no deseados y/o su hábitat con la composición de acuerdo con la reivindicación 3.

5. Uso de los compuestos de acuerdo con la reivindicación 1 ó 2 para controlar insectos y/o ácaros no deseados.

6. Uso de los compuestos de acuerdo con la reivindicación 1 ó 2 para tratar semillas.

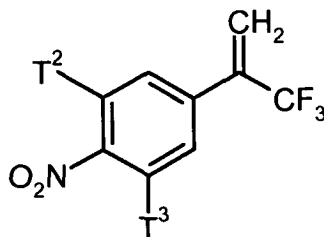
7. Uso de los compuestos de acuerdo con la reivindicación 1 ó 2 para tratar plantas transgénicas.

8. Compuestos representados por la fórmula (IIa)



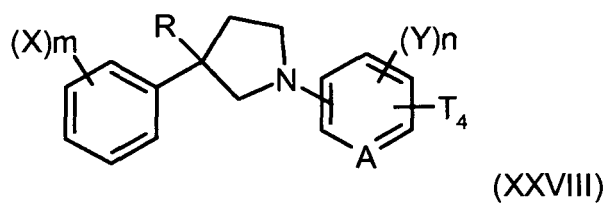
en la que X se define como en la reivindicación 1 ó 2 y T¹ representa hidrógeno o bencilo, Hal-R representa haloalquilo C₁₋₁₂ y p representa 1, 2, 3, 4 ó 5.

9. Compuestos representados por la fórmula (XVI-a)

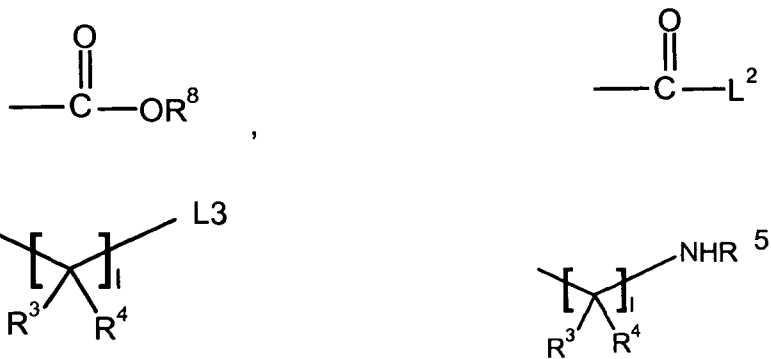


en la que T² y T³ representan independientemente alquilo C₁₋₁₂.

10. Compuestos representados por la fórmula (XXVIII)



en la que X, Y, R, A, m y n se definen como en la reivindicación 1 ó 2 y T⁴ representa ciano, amino o nitro, o un grupo



5 en los que

I, R³, R⁴, R⁵ y R⁶ se definen como en la reivindicación 1 ó 2;

R⁸ representa hidrógeno o alquilo C₁₋₄;

L² representa cloro, bromo, alquilcarbonilo C₁₋₄, alcoxi C₁₋₄ carbonilo o azolilo; y

L³ representa cloro, bromo, yoduro, alquilsulfonilo C₁₋₄, haloalquilsulfonilo C₁₋₄, arilsulfonilo o azolilo.