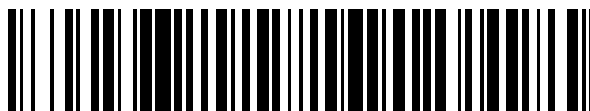


19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 427 141**

51 Int. Cl.:

C07D 401/14	(2006.01)	A01N 47/38	(2006.01)
C07D 403/06	(2006.01)		
C07D 239/96	(2006.01)		
C07D 239/90	(2006.01)		
C07D 243/14	(2006.01)		
C07D 401/06	(2006.01)		
A01N 43/54	(2006.01)		
A01N 43/56	(2006.01)		
A01N 43/62	(2006.01)		
A01N 47/34	(2006.01)		

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **16.01.2003** **E 03708845 (7)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **17.07.2013** **EP 1467988**

54 Título: **Quinazolina(di)onas para el control de plagas de invertebrados**

30 Prioridad:

22.01.2002 US 350632 P

45 Fecha de publicación y mención en BOPI de la traducción de la patente:

29.10.2013

73 Titular/es:

**E. I. DU PONT DE NEMOURS AND COMPANY
(100.0%)
1007 MARKET STREET
WILMINGTON, DELAWARE 19898, US**

72 Inventor/es:

**CLARK, DAVID ALAN y
LAHM, GEORGE PHILIP**

74 Agente/Representante:

DE ELZABURU MÁRQUEZ, Alberto

ES 2 427 141 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

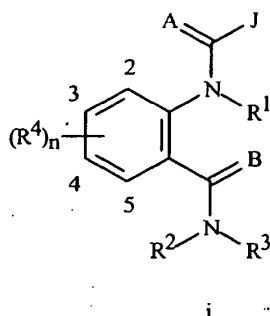
Quinazolina(di)onas para el control de plagas de invertebrados

Antecedentes de la invención

Esta invención se refiere a ciertas quinazolina(di)onas, sus *N*-óxidos, sales agrícolamente adecuadas y composiciones de las mismas, y un método de uso para controlar plagas de invertebrados en medios tanto

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

La solicitud de patente internacional WO 01/070671 describe derivados del ácido *N*-acilantranílico de Fórmula i que actúan como artropodocidas

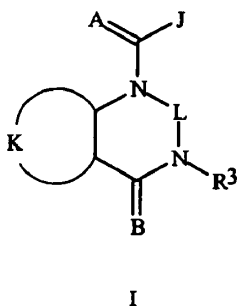


en la que, entre otros, A y B son independientemente O o S; J es un anillo de fenilo opcionalmente sustituido, un anillo heteroaromático de 5 ó 6 miembros, un sistema de anillo naftilo o un sistema de anillo heterobícíclico condensado aromático de 8, 9 ó 10 miembros; R¹ y R³ son independientemente H o alquilo C₁-C₆ opcionalmente sustituido; R² es H o alquilo C₁-C₆; cada R⁴ es independientemente H, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, halógeno o CN; y n es 1 a 4.

La solicitud de patente internacional WO 0105784 describe diversos compuestos heterobícíclicos que contienen nitrógeno como inhibidores del Factor Xa. La patente de EE.UU. 4.537.966 describe aminobenzoil-1H-indazol-3-oles que son útiles como inmunomoduladores y en controlar la inflamación en animales de sangre caliente. La patente de EE.UU. 4.340.417 describe 1-(5-[2-cloro-4-(trifluorometil)-fenoxi]-2-nitrobenzoyl)-3-isopropil-2,1,3-benzotiadiazin-4-ona, 2,2-dióxido, como herbicida. La patente alemana DE 2444822 describe ciertos derivados de 2,1,3-benzotiadiazin(4)ona-2,2-dióxido útiles como herbicidas. La patente alemana DE 2652144 describe diversas quinazolinodionas farmacéuticamente activas. La patente de EE.UU. 3.092.631 describe 7-cloro-2-alquilo inferior-1,2,3,4-tetra-hidro-4-oxoquinazolin-3-onas útiles como relajantes musculares y diuréticos. La patente de EE.UU. 3.041.336 describe 3-oxo-1,2,6-tiadiazina-1,1-dióxidos farmacológicamente activos. La patente francesa FR 1.516.600 describe derivados de tetrahydroquinazolina herbicidamente activos.

Compendio de la invención

Esta invención está dirigida a compuestos de Fórmula I que incluyen todos los isómeros geométricos y estereoisómeros, sus *N*-óxidos y sales agrícolamente adecuadas de los mismos,

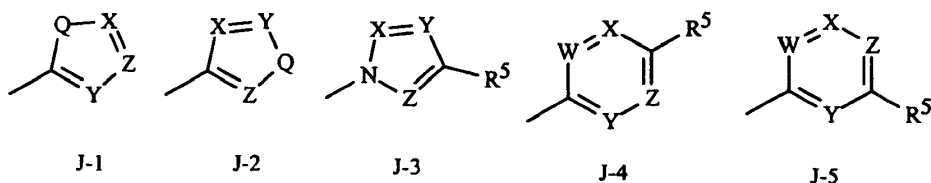


en la que

A y B son los dos O;

J es un anillo de fenilo que está opcionalmente sustituido con 1 a 4 sustituyentes seleccionados independientemente de R^5 ; o

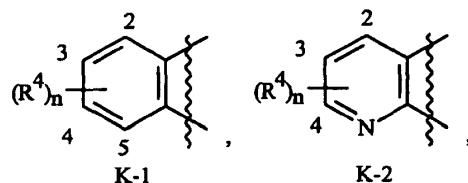
- 5 J es un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros seleccionado del grupo que consiste en J-1, J-2, J-3, J-4 y J-5, cada J opcionalmente sustituido con 1 a 3 sustituyentes seleccionados independientemente de R^5



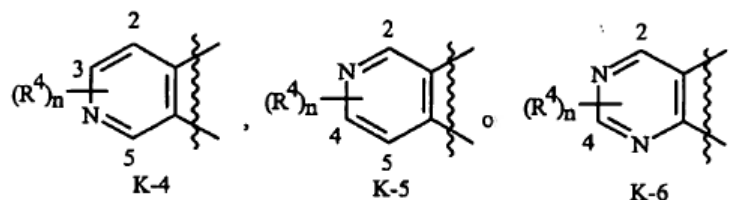
Q es O, S, NH o NR^5 ;

- 10 W, X, Y y Z son independientemente N, CH o CR^5 , con la condición de que en J-4 y J-5 al menos uno de W, X, Y o Z sea N;

K es, junto con los dos átomos de carbono enlazantes contiguos, un anillo de fenilo condensado, un piridinilo condensado o un pirimidinilo condensado seleccionado del grupo que consiste en K-1, K-2, K-4, K-5 y K-6, cada uno sustituido con 1 grupo R^4 en la posición 2 y opcionalmente sustituido con 0 a 3 sustituyentes adicionales seleccionados independientemente de R^4



15



L es un enlace directo; o una cadena enlazante de 1 a 3 miembros seleccionada de carbono, nitrógeno, oxígeno y azufre, que incluye opcionalmente uno o dos miembros de cadena como $C(=E)$, SO o $S(O)_2$, y sustituida opcionalmente con uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente de R^{13} ;

- 20 E es O, S o NR^8 ;

R^3 es H; G; alquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , cada uno opcionalmente sustituido con 1 a 5 sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste en G, halógeno, CN, NO_2 , hidroxilo, alcoxi C_1-C_4 , haloalcoxi C_1-C_4 , alquil(C_1-C_4)tio, alquil(C_1-C_4)sulfinilo, alquil(C_1-C_4)sulfonilo, alcoxi(C_2-C_6)carbonilo, alquil(C_2-C_6)carbonilo, trialquil(C_3-C_6)sililo, fenilo, fenoxi y anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, cada uno fenilo, fenoxi y anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros opcionalmente sustituido con uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente de R^6 ; o fenilo opcionalmente sustituido con 1 a 3 sustituyentes seleccionados independientemente de R^6 ;

25

G es un anillo carbocíclico o heterocíclico no aromático de 5 o 6 miembros, que incluye opcionalmente uno o dos miembros de anillo seleccionados del grupo que consiste en $C(=O)$, SO y $S(O)_2$ y opcionalmente sustituido con 1 a 4 sustituyentes seleccionados independientemente de R^{12} ;

30

el grupo R^4 unido al anillo K en la posición 2 es alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , halógeno, CN, NO_2 , alcoxi C_1-C_4 , haloalcoxi C_1-C_4 , alquil(C_1-C_4)tio, alquil(C_1-C_4)sulfinilo, alquil(C_1-C_4)sulfonilo, haloalquil(C_1-C_4)tio, haloalquil(C_1-C_4)sulfinilo o haloalquil(C_1-C_4)sulfonilo;

cada R^4 adicional es independientemente alquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , haloalquenilo C_2-C_6 , haloalquinilo C_2-C_6 , halocicloalquilo C_3-C_6 , halógeno, CN, NO_2 , hidroxilo, alcoxi

35

C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquil(C₁-C₄)tio, alquil(C₁-C₄)sulfinilo, alquil(C₁-C₄)sulfonilo, haloalquil(C₁-C₄)tio, haloalquil(C₁-C₄)sulfinilo, haloalquil(C₁-C₄)sulfonilo, alquil(C₁-C₄)amino, dialquil(C₂-C₈)amino, cicloalquil(C₃-C₆)amino, alcoxialquilo C₁-C₄, hidroxialquilo C₁-C₄, C(O)R¹⁰, CO₂R¹⁰, C(O)NR¹⁰R¹¹, NR¹⁰R¹¹, N(R¹¹)CO₂R¹⁰ o trialquil(C₃-C₆)sililo; o

- 5 cada R⁴ adicional es independientemente un fenilo, bencilo, fenoxi o un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, cada anillo opcionalmente sustituido con uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente de R⁶;

cada R⁵ es independientemente halógeno, alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, CN, NO₂, haloalcoxi C₁-C₄, alquil(C₁-C₄)tio, alquil(C₁-C₄)sulfinilo, alquil(C₁-C₄)sulfonilo, haloalquil(C₁-C₄)tio, haloalquil(C₁-C₄)sulfinilo, haloalquil(C₁-C₄)sulfonilo o alcoxi(C₂-C₄)carbonilo; o

- 10 cada R⁵ es independientemente un fenilo, o un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, cada anillo opcionalmente sustituido con uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente de R⁶; o

cuando J denota fenilo opcionalmente sustituido, R⁵ puede denotar también alcoxi C₁-C₄, o dos grupos R⁵ cuando están unidos a átomos de carbono adyacentes pueden ser tomados juntos como -OCF₂O-, -CF₂CF₂O- o -OCF₂CF₂O-;

- 15 cada R⁶ es independientemente alquilo C₁-C₄, alqueno C₂-C₄, alquino C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, haloalqueno C₂-C₄, haloalquino C₂-C₄, halocicloalquilo C₃-C₆, halógeno, CN, NO₂, hidroxilo, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquil(C₁-C₄)tio, alquil(C₁-C₄)sulfinilo, alquil(C₁-C₄)sulfonilo, haloalquil(C₁-C₄)tio, haloalquil(C₁-C₄)sulfinilo, haloalquil(C₁-C₄)sulfonilo, alquil(C₁-C₄)amino, dialquil(C₂-C₈)amino, cicloalquil(C₃-C₆)amino, alquil(C₃-C₆)cicloalquilamino, alquil(C₂-C₄)carbonilo, alcoxi(C₂-C₆)carbonilo, alquil(C₂-C₆)aminocarbonilo, dialquil(C₃-C₈)aminocarbonilo o trialquil(C₃-C₆)sililo;

- 20 R⁸ es H; alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆ o cicloalquilo C₃-C₆, cada uno opcionalmente sustituido con 1 a 5 sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste en halógeno, CN, NO₂, hidroxilo, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquil(C₁-C₄)tio, alquil(C₁-C₄)sulfinilo, alquil(C₁-C₄)sulfonilo, alcoxi(C₂-C₆)carbonilo, alquil(C₂-C₆)carbonilo, trialquil(C₃-C₆)sililo, un anillo de fenilo y un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, cada anillo opcionalmente sustituido con uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente de R⁶; CN; NO₂; alcoxi(C₂-C₆)carbonilo; alquil(C₁-C₄)sulfonilo; o fenilo o fenilsulfonilo opcionalmente sustituido con 1 a 3 sustituyentes seleccionados independientemente de R⁶;

cada R¹⁰ es independientemente H, alquilo C₁-C₄ o haloalquilo C₁-C₄;

cada R¹¹ es independientemente H o alquilo C₁-C₄;

- 30 cada R¹² es independientemente alquilo C₁-C₂, halógeno, CN, NO₂ o alcoxi C₁-C₂;

cada R¹³ es independientemente alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, halógeno, CN, COOH, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alcoxi(C₂-C₆)carbonilo, alcoxi(C₂-C₆)carbonilalquilo; o

cada R¹³ es un fenilo o un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, cada anillo opcionalmente sustituido con uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente de R⁶; y

- 35 n es 1, 2, 3 o 4.

Esta invención también se refiere a un método para controlar una plaga de invertebrados que comprende poner en contacto la plaga de invertebrados o su medio con una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto de fórmula I, su N-óxido o una sal agrícolamente adecuada del compuesto (p.ej., como una composición descrita en la presente memoria). Esta invención también se refiere a un método tal en donde la plaga de invertebrados o su medio se pone en contacto con una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto de Fórmula I o una composición que comprende un compuesto de Fórmula I y una cantidad biológicamente activa de al menos un compuesto o agente adicional para controlar plagas de invertebrados.

- 40 Esta invención también se refiere a una composición para controlar una plaga de invertebrados que comprende una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto de Fórmula I, su N-óxido o una sal agrícolamente adecuada del compuesto y al menos un componente adicional seleccionado del grupo que consiste en tensioactivos, un diluyente sólido y un diluyente líquido. Esta invención también se refiere a una composición que comprende una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto de Fórmula I, su N-óxido o una sal agrícolamente adecuada del compuesto y una cantidad eficaz de al menos un compuesto o agente biológicamente activo adicional.

Detalles de la invención

- 50 En los recitados anteriores, el término "alquilo", usado sólo o en palabras compuestas tales como "alquiltio" o "haloalquilo", incluye alquilo de cadena lineal o ramificada, tal como metilo, etilo, n-propilo, i-propilo o los diferentes isómeros de butilo, pentilo o hexilo. "Alqueno" incluye alquenos de cadena lineal o ramificados tales como etenilo, 1-propenilo, 2-propenilo, y los diferentes isómeros de butenilo, pentenilo y hexenilo. "Alqueno" también incluye

polienos tales como 1,2-propadienilo y 2,4-hexadienilo. "Alquinilo" incluye alquinos de cadena lineal o ramificados tales como etinilo, 1-propinilo, 2-propinilo y los diferentes isómeros de butinilo, pentinilo y hexinilo. "Alquinilo" también puede incluir restos compuestos por múltiples triples enlaces tales como 2,5-hexadiinilo. "Alcoxi" incluye, por Ejemplo, metoxi, etoxi, n-propiloxi, isopropiloxi y los diferentes isómeros butoxi, pentoxi y hexiloxi. "Alcoxialquilo" se refiere a una sustitución alcoxi sobre alquilo. Los Ejemplos de "alcoxialquilo" incluyen CH_3OCH_2 , $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2$ y $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2$. "Alquiltio" incluye restos alquiltio de cadena lineal o ramificada tales como metiltio, etiltio, y los diferentes isómeros de propiltio, butiltio, pentiltio y hexiltio. "Alquilsulfínilo" incluye ambos enantiómeros de un grupo alquilsulfínilo. Los Ejemplos de "alquilsulfínilo" incluyen $\text{CH}_3\text{S(O)-}$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S(O)-}$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S(O)-}$, $(\text{CH}_3)_2\text{CHS(O)-}$ y los diferentes isómeros de butilsulfínilo, pentilsulfínilo y hexilsulfínilo. Los Ejemplos de "alquilsulfínilo" incluyen $\text{CH}_3\text{S(O)}_2-$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S(O)}_2-$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S(O)}_2-$, $(\text{CH}_3)_2\text{CHS(O)}_2-$, y los diferentes isómeros de butilsulfínilo, pentilsulfínilo y hexilsulfínilo. Los Ejemplos de "alquilsulfíniloxi" incluyen $\text{CH}_3\text{S(O)}_2\text{O}$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{S(O)}_2\text{O}$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S(O)}_2\text{O}$, $(\text{CH}_3)_2\text{CHS(O)}_2\text{O}$ y los diferentes isómeros de butilsulfíniloxi, pentilsulfíniloxi y hexilsulfíniloxi. "Alquilamino", "dialquilamino", "alqueniltio", "alquensulfínilo", "alquensulfínilo", "alquinitio", "alquinsulfínilo", "alquinsulfínilo" y similares se definen de forma análoga a los Ejemplos anteriores. "Cicloalquilo" incluye, por Ejemplo, ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo y ciclohexilo.

"Aromático" indica que cada uno de los átomos del anillo está esencialmente en el mismo plano y tiene un orbital p perpendicular al plano del anillo, y en el que $(4n + 2)$ electrones π , donde n es 0 o un número entero positivo, están asociados con el anillo para cumplir con la regla de Hückel. La expresión "sistema de anillos aromáticos" se refiere a carbociclos y heterociclos totalmente insaturados en los que al menos un anillo de un sistema de anillos policíclicos es aromático. La expresión "anillo o sistema de anillos carbocíclicos aromáticos" incluye carbociclos totalmente aromáticos y carbociclos en los que al menos un anillo de un sistema de anillos policíclicos es aromático (por Ejemplo, fenilo y naftilo). El término "arilo" se refiere a cualquier anillo o sistema de anillos aromático opcionalmente sustituido. La expresión "anillo o sistema de anillos carbocíclicos no aromáticos" representa carbociclos saturados así como carbociclos parcial o completamente insaturados en los que ninguno de los anillos del sistema de anillos satisface la regla de Hückel. El término "hetero" con respecto a anillos o sistemas de anillos se refiere a un anillo o sistema de anillos en los que al menos un átomo del anillo no es carbono y que puede contener de 1 a 4 heteroátomos seleccionados independientemente del grupo que consiste en nitrógeno, oxígeno y azufre, con la condición de que cada anillo contenga no más de 4 nitrógenos, no más de 2 oxígenos y no más de 2 azufres. El término "anillo o sistema de anillos heteroaromático" incluye heterociclos totalmente aromáticos y heterociclos en los que al menos un anillo de un sistema de anillos policíclico es aromático (donde aromático indica que la regla de Hückel es satisfecha). La expresión "sistema de anillos o anillo heterocíclico no aromático" denota heterociclos completamente saturados, así como heterociclos parcial o completamente insaturados en los que ninguno de los anillos del sistema de anillos satisface la regla de Hückel. El anillo o sistema de anillos heterocíclicos puede unirse a través de cualquier carbono o nitrógeno disponible por reemplazo de un hidrógeno sobre dicho carbono o nitrógeno.

El término "halógeno", sólo o en palabras compuestas tales como "haloalquilo", incluye flúor, cloro, bromo o yodo. Además, cuando se usa en palabras compuestas tales como "haloalquilo", dicho alquilo puede estar parcial o totalmente sustituido con átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes. Los Ejemplos de "haloalquilo" incluyen F_3C , ClCH_2 , CF_3CH_2 y CF_3CCl_2 . Los términos "haloalqueno", "haloalquino", "haloalcoxi", "haloalquiltio", y similares, se definen análogamente al término "haloalquilo". Los Ejemplos de "haloalqueno" incluyen $(\text{Cl})_2\text{C}=\text{CHCH}_2$ y $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{CH}=\text{CHCH}_2$. Los Ejemplos de "haloalquino" incluyen $\text{HC}\equiv\text{CCHCl}$, $\text{CF}_3\text{C}\equiv\text{C}$, $\text{CCl}_3\text{C}\equiv\text{C}$ y $\text{FCH}_2\text{C}\equiv\text{CCH}_2$. Los Ejemplos de "haloalcoxi" incluyen CF_3O , $\text{CCl}_3\text{CH}_2\text{O}$, $\text{HCF}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{O}$ y $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{O}$. Los Ejemplos de "haloalquiltio" incluyen $\text{CCl}_3\text{S-}$, $\text{CF}_3\text{S-}$, $\text{CCl}_3\text{CH}_2\text{S-}$ y $\text{ClCH}_2\text{CH}_2\text{CH}_2\text{S-}$. Los Ejemplos de "haloalquilsulfínilo" incluyen $\text{CF}_3\text{S(O)-}$, $\text{CCl}_3\text{S(O)-}$, $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{S(O)-}$ y $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{S(O)-}$. Los Ejemplos de "haloalquilsulfínilo" incluyen $\text{CF}_3\text{S(O)}_2-$, $\text{CCl}_3\text{S(O)}_2-$, $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{S(O)}_2-$ y $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{S(O)}_2-$. Los Ejemplos de "haloalquilsulfíniloxi" incluyen $\text{CF}_3\text{S(O)}_2\text{O}$, $\text{CCl}_3\text{S(O)}_2\text{O}$, $\text{CF}_3\text{CH}_2\text{S(O)}_2\text{O}$ y $\text{CF}_3\text{CF}_2\text{S(O)}_2\text{O}$.

Los Ejemplos de "alquilcarbonilo" incluyen C(O)CH_3 , $\text{C(O)CH}_2\text{CH}_2\text{CH}_3$ y $\text{C(O)CH(CH}_3)_2$. Los Ejemplos de "alcoxycarbonilo" incluyen $\text{CH}_3\text{OC(=O)}$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OC(=O)}$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OC(=O)}$, $(\text{CH}_3)_2\text{CHOC(=O)}$ y los diferentes isómeros de butoxi- o pentoxycarbonilo. Los Ejemplos de "alcoxycarbonilalquilo" incluyen $\text{CH}_3\text{OC(=O)CH}_2$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OC(=O)CH}_2$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OC(=O)CH}_2$ y $(\text{CH}_3)_2\text{CHOC(=O)CH}_2$. Los Ejemplos de "alquilaminocarbonilo" incluyen $\text{CH}_3\text{NHC(=O)}$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{NHC(=O)}$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{NHC(=O)}$, $(\text{CH}_3)_2\text{CHNHC(=O)}$ y los diferentes isómeros de butilamino- o pentilaminocarbonilo. Los Ejemplos de "dialquilaminocarbonilo" incluyen $(\text{CH}_3)_2\text{NC(=O)}$, $(\text{CH}_3\text{CH}_2)_2\text{NC(=O)}$, $\text{CH}_3\text{CH}_2(\text{CH}_3)\text{NC(=O)}$, $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2(\text{CH}_3)\text{NC(=O)}$ y $(\text{CH}_3)_2\text{CHN(CH}_3)\text{C(=O)}$.

El número total de átomos de carbono en un grupo sustituyente se indica mediante el sufijo " $\text{C}_i\text{-C}_j$ " en el que i y j son números de 1 a 6. Por Ejemplo, alquilsulfonilo $\text{C}_1\text{-C}_3$ designa metilsulfonilo a propilsulfonilo; alcoxialquilo C_2 indica CH_3OCH_2 ; alcoxialquilo C_3 indica, por Ejemplo, $\text{CH}_3\text{CH(OCH}_3)$, $\text{CH}_3\text{OCH}_2\text{CH}_2$ o $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2$; y alcoxialquilo C_4 indica los diversos isómeros de un grupo alquilo sustituido con un grupo alcoxi que contiene un total de cuatro átomos de carbono, incluyendo los Ejemplos $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{CH}_2\text{OCH}_2$ y $\text{CH}_3\text{CH}_2\text{OCH}_2\text{CH}_2$.

En las indicaciones anteriores, cuando un compuesto de Fórmula I está comprendido por uno o más anillos heterocíclicos, todos los sustituyentes están unidos a estos anillos a través de cualquier carbono o nitrógeno disponible por reemplazo de un hidrógeno en dicho carbono o nitrógeno.

Cuando un compuesto está sustituido con un sustituyente que tiene un subíndice que indica que el número de dichos sustituyentes puede superar 1, dichos sustituyentes (cuando superan 1) se seleccionan independientemente entre el grupo de sustituyentes definidos. Además, cuando el subíndice indica un intervalo, por Ejemplo (R)_{i-j}, entonces el número de sustituyentes puede seleccionarse entre los números enteros comprendidos entre i y j, inclusive.

La expresión "opcionalmente sustituido con uno a tres sustituyentes", y similares, indica que de una a tres de las posiciones disponibles en el grupo pueden estar sustituidas. Cuando un grupo contiene un sustituyente que puede ser hidrógeno, por Ejemplo R³ o R⁸, entonces, cuando este sustituyente se toma como hidrógeno, se reconoce que esto es equivalente a que dicho grupo no está sustituido.

Los compuestos de esta invención pueden existir como uno o más estereoisómeros. Los diversos estereoisómeros incluyen enantiómeros, diastereómeros, atropisómeros e isómeros geométricos. Un especialista en la técnica apreciará que un estereoisómero puede ser más activo y/o puede mostrar efectos beneficiosos cuando está enriquecido con respecto al otro u otros estereoisómeros o cuando se separa del otro u otros estereoisómeros. Además, el especialista sabe cómo separar, enriquecer y/o preparar de forma selectiva dichos estereoisómeros. Por lo tanto, la presente invención comprende compuestos seleccionados de Fórmula I, *N*-óxidos y sales agrícolas adecuadas del mismo. Los compuestos de la invención pueden estar presentes como una mezcla de estereoisómeros, estereoisómeros individuales, o como una forma ópticamente activa.

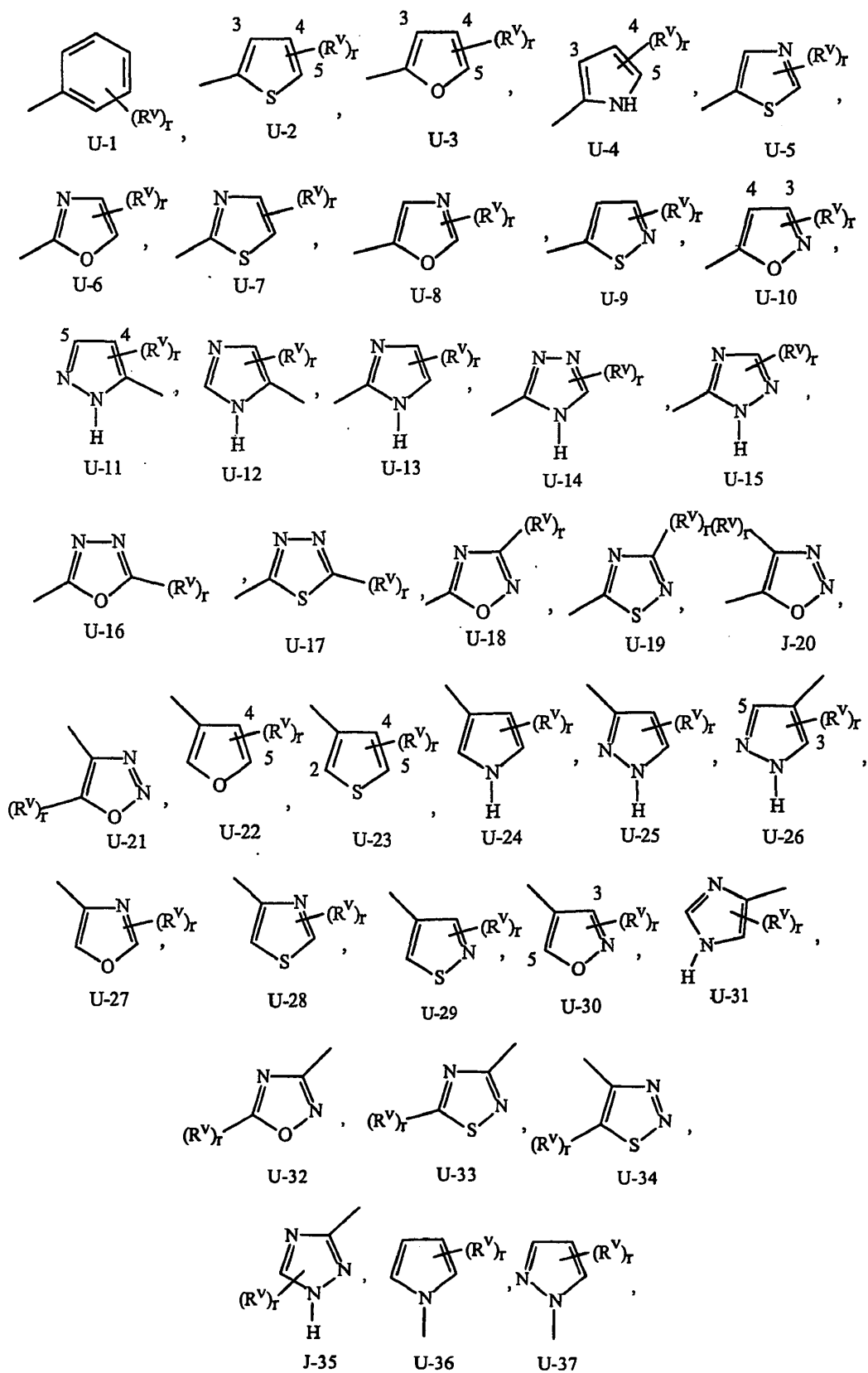
Un experto en la técnica apreciará que no todos los heterociclos que contienen nitrógeno pueden formar *N*-óxidos, ya que el nitrógeno requiere un par de electrones disponible para la oxidación al óxido; un experto en la técnica reconocerá que los heterociclos que contienen nitrógeno pueden formar *N*-óxidos.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

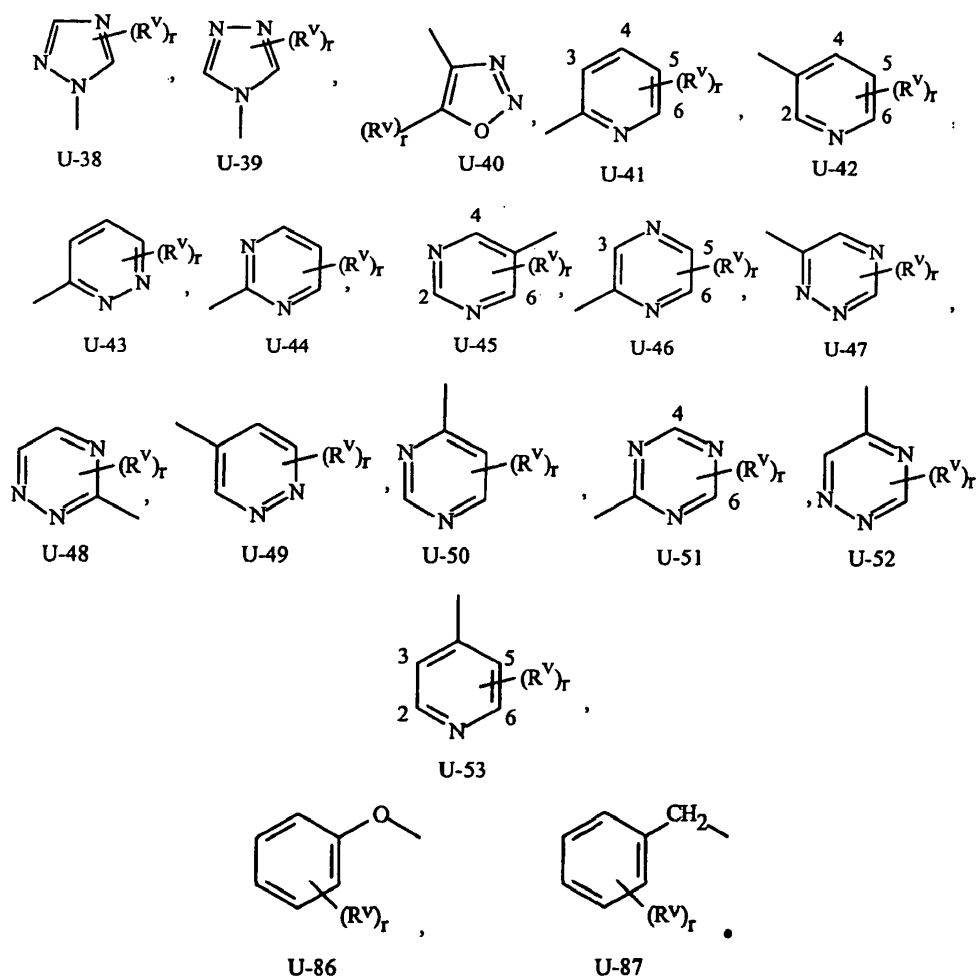
Las sales de los compuestos de la invención incluyen sales de adición de ácido con ácidos inorgánicos u orgánicos tales como ácido bromhídrico, clorhídrico, nítrico, fosfórico, sulfúrico, acético, butírico, fumárico, láctico, maleico, malónico, oxálico, propiónico, salicílico, tartárico, 4-toluenosulfónico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

Como se apuntó anteriormente, J es un anillo de fenilo, o un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros en donde cada anillo está opcionalmente sustituido con 1 a 4 sustituyentes seleccionados independientemente de R⁵. La expresión "opcionalmente sustituido" en conexión con estos grupos J se refiere a grupos que son no sustituidos o tienen al menos un sustituyente distinto del hidrógeno que no extingue la actividad biológica poseída por el análogo no sustituido. Un Ejemplo de fenilo opcionalmente sustituido con 1 a 4 R⁵ es el anillo ilustrado como U-1 en el Cuadro 1, en donde R^v es R⁵ y r es un número entero de 0 a 4. Los Ejemplos de anillos heteroaromáticos de 5 o 6 miembros opcionalmente sustituidos con 1 a 4 R⁵ incluyen los anillos U-2 a U-53 ilustrados en el Cuadro I, en donde R^v es R⁵ y r es un número entero de 0 a 4. Debe apreciarse que J-1 a J-13 mostrados a continuación también representan anillos heteroaromáticos de 5 ó 6 miembros. Nótese que U-2 a U-20 son Ejemplos de J-1, U-21 a U-35 y U-40 son Ejemplos de J-2, U-36 a U-39 son Ejemplos de J-3; U-41 a U-48 son Ejemplos de J-4 y U-49 a U-53 son Ejemplos de J-5. Nótese que U-11 es equivalente a J-6, U-26 es equivalente a J-7 o J-10, U-42 es equivalente a J-8, U-45 es equivalente a J-9, U-4 es equivalente a J-11 y U-24 es equivalente a J-12 o J-13. Nótese también que en J-6 a J-13 R⁷ y R⁹ son subconjuntos de R⁵ de Fórmula I.

R^v está unido a estos anillos mediante cualquier carbono o nitrógeno disponible por reemplazo de un hidrógeno en dicho carbono o nitrógeno. Nótese que algunos grupos U sólo pueden ser sustituidos con menos que 4 grupos R^v (p.ej. U-16 a U-21 y U-32 a U-34 sólo pueden ser sustituidos con un R^v). Nótese que cuando el punto de unión entre (R^v)_r y el grupo U se ilustra como flotante, (R^v)_r puede estar unido a cualquier carbono o nitrógeno disponible del grupo U. Nótese que cuando el punto de unión en el grupo U se ilustra como flotante, el grupo U puede estar unido al resto de la Fórmula I mediante cualquier carbono o nitrógeno disponible del grupo U por sustitución de un átomo de hidrógeno.

Cuadro 1





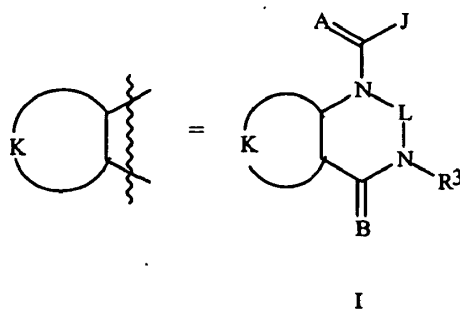
5

10

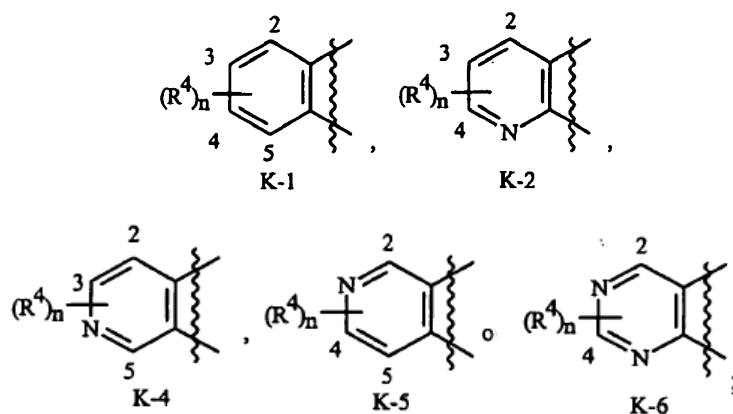
15

Como se apuntó anteriormente K es, junto con los dos átomos de carbono enlazantes contiguos, un fenilo condensado, un anillo de piridinilo condensado o un anillo de pirimidinilo condensado seleccionado del grupo que consiste en K-1, K-2, K-4, K-5 y K-6, cada uno sustituido con 1 grupo R^4 en la posición 2 y opcionalmente sustituido con 0 a 3 sustituyentes adicionales seleccionados independientemente de R^4 . El término "opcionalmente sustituido" en conexión con estos grupos K se refiere a grupos que no están sustituidos o tienen al menos un sustituyente distinto del hidrógeno que no extingue la actividad biológica poseída por el análogo no sustituido. Los grupos K se ilustran como K-1 a K-6 en el Cuadro 2. Nótese que K-2 a K-5 pueden estar opcionalmente sustituidos además con uno o dos sustituyentes seleccionados independientemente de R^4 . Nótese también que K-6 puede estar opcionalmente sustituido además con un sustituyente seleccionado independientemente de R^4 . En los grupos K, el enlace superior derecho está unido mediante el átomo de carbono enlazante disponible al átomo de nitrógeno de la porción N(L)-C(=A)J de la Fórmula I, y el enlace inferior derecho está unido mediante el átomo de carbono enlazante disponible al átomo de carbono de la porción C(=B)N(L)R³ de la Fórmula I. La línea ondulada indica que el anillo K está unido al resto de la Fórmula I como se ilustra a continuación.

Cuadro 2



20

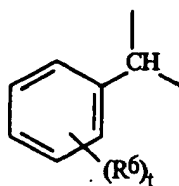


Los anillos K preferidos son K-1, K-2, K-5 y K-6. El más preferido es K-1.

5 Como se apuntó anteriormente, L es un enlace directo; o una cadena enlazante de 1 a 3 miembros seleccionados de carbono, nitrógeno, oxígeno y azufre, que incluye opcionalmente uno o dos miembros de cadena como C(=E), SO o S(O)₂, y sustituida opcionalmente con uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente de R¹³. El término "opcionalmente sustituido" en conexión con estos grupos L se refiere a grupos que no están sustituidos o tienen al menos un sustituyente distinto del hidrógeno que no extingue la actividad biológica poseída por el análogo no sustituido. Los Ejemplos de L incluyen los grupos L-1 a L-17 ilustrados en el Cuadro 3. En L-17, t es un número entero de 1 a 3. Aunque se muestran grupos R⁶ en la estructura L-17, se apunta que no necesitan estar presentes, dado que son sustituyentes opcionales. Los grupos L preferidos son L-1, L-6, L-7, L-9 y L-10.

Cuadro 3

-C(=O)-	-C(=S)-	-C(=NR ⁶)-	-S(O)-
L-1	L-2	L-3	L-4
-SO ₂ -	-CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ -	-CH ₂ CH ₂ CH ₂ -
L-5	L-6	L-7	L-8
-CH(CH ₃)-	-C(CH ₃) ₂ -	-CH(OCH ₃)-	-C(OCH ₃) ₂ -
L-9	L-10	L-11	L-12
-CF ₂ -	-CF ₂ CF ₂ -	-CH(CF ₃)-	-CH(CCl ₃)-
L-13	L-14	L-15	L-16

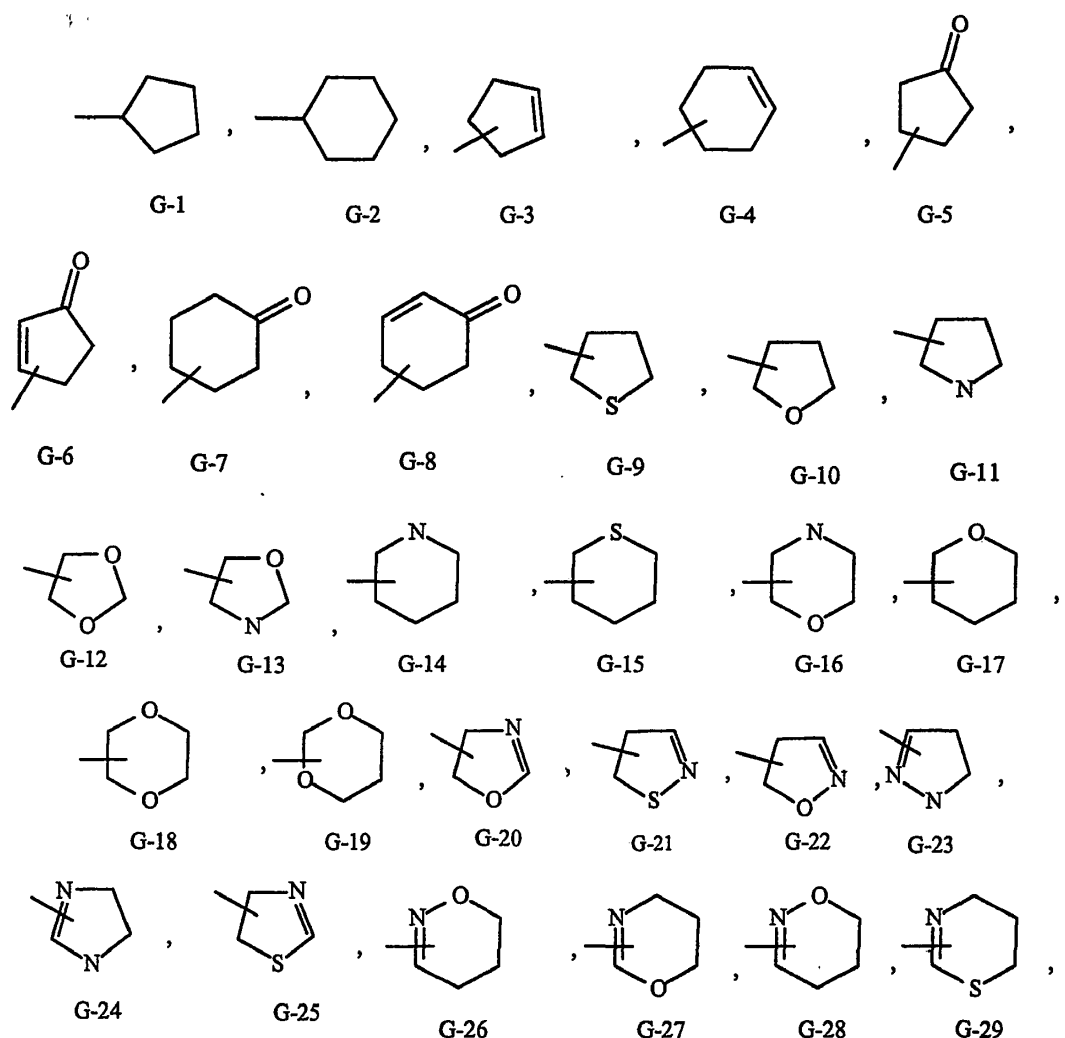


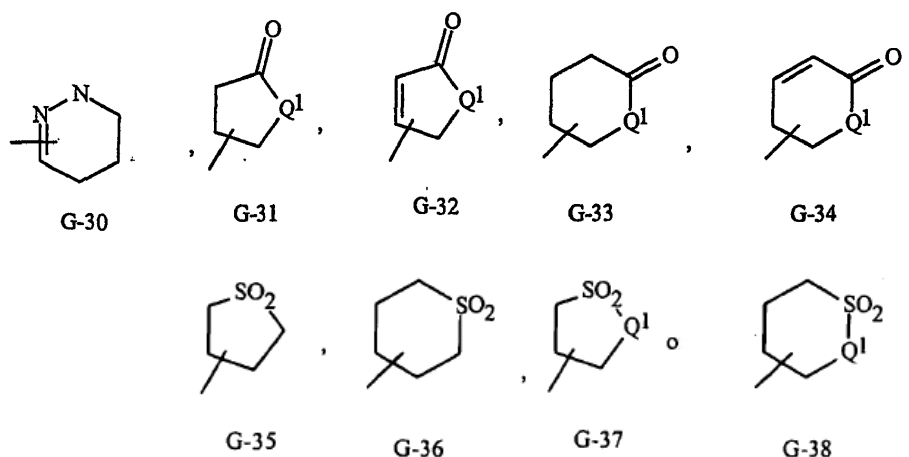
15 Como se apuntó anteriormente, R³ puede ser (entre otros) alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, cada uno opcionalmente sustituido con uno a cinco sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste en un anillo de fenilo y un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, cada anillo opcionalmente sustituido con uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente de R⁶. Los Ejemplos de tales anillos incorporados a dichos grupos R³ incluyen los anillos ilustrados como U-1 a U-53 ilustrados en el Cuadro 1, excepto

que tales anillos están opcionalmente sustituidos con 1 a 3 sustituyentes seleccionados independientemente de R^6 en lugar de $(R^v)_r$, y están unidos a un grupo R^3 seleccionado de la lista inmediatamente anterior.

Como se apuntó anteriormente, R^3 puede ser (entre otros) G; o alquilo C_1-C_6 , alqueno C_2-C_6 , alquino C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , cada uno opcionalmente sustituido con G; en donde G es un anillo carbocíclico o heterocíclico no aromático de 5 ó 6 miembros, que incluye opcionalmente uno o dos miembros de anillo seleccionados del grupo que consiste en C(=O), SO o S(O)₂, y opcionalmente sustituido con 1 a 4 sustituyentes seleccionados de R^{12} . El término "opcionalmente sustituido" en conexión con estos grupos G se refiere a grupos que no están sustituidos o tienen al menos un sustituyente distinto del hidrógeno que no extingue la actividad biológica poseída por el análogo no sustituido. Los sustituyentes opcionales pueden estar unidos a cualquier carbono disponible reemplazando a un átomo de hidrógeno. Los Ejemplos de anillos carbocíclicos no aromáticos de 5 ó 6 miembros como G incluyen los anillos ilustrados como G-1 a G-8 del Cuadro 3. Los Ejemplos de anillos heterocíclicos no aromáticos de 5 ó 6 miembros como G incluyen los anillos ilustrados como G-9 a G-38 del Cuadro 4. Debe apreciarse que cuando G comprende un anillo seleccionado entre G-31 a G-34, G-37 y G-38, Q^1 se selecciona entre O, S o N. Debe apreciarse que cuando G es G-11, G-13, G-14, G-16, G-23, G-24, G-30 a G-34, G-37 y G-38 y Q^1 es N, el átomo de nitrógeno puede completar su valencia por sustitución con H o alquilo C_1-C_2 . Nótese que cuando el punto de unión sobre el grupo G se ilustra como flotante, el grupo G puede estar unido al resto de la Fórmula I mediante cualquier carbono disponible del grupo G por reemplazo de un átomo de hidrógeno.

Cuadro 4





5 Como se apuntó anteriormente, cada R^4 puede ser independientemente (entre otros) un fenilo, bencilo, fenoxi o anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, cada anillo opcionalmente sustituido con uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente de R^6 . Los Ejemplos de tales grupos R^4 incluyen los anillos o sistemas de anillos ilustrados como U-1 a U-53, U-86 y U-87 ilustrados en el Cuadro 1, excepto que tales anillos están opcionalmente sustituidos con 1 a 3 sustituyentes seleccionados independientemente de R^6 en lugar de $(R^v)_r$.

10 Como se apuntó anteriormente, cada R^5 puede ser independientemente (entre otros) un fenilo, o un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, cada anillo opcionalmente sustituido con uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente de R^6 . Los Ejemplos de tales grupos R^5 incluyen los anillos o sistemas de anillos ilustrados como U-1 a U-53 ilustrados en el Cuadro 1, excepto que tales anillos están opcionalmente sustituidos con 1 a 3 sustituyentes seleccionados independientemente de R^6 en lugar de $(R^v)_r$.

Son compuestos preferidos por razones de mejor actividad y/o facilidad de síntesis:

15 Preferencia 1. Compuestos de la Fórmula I anterior, sus *N*-óxidos y sales agrícolamente adecuadas de los mismos, en donde

R^3 es alquilo C_1 - C_4 opcionalmente sustituido con 1 a 5 sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste en halógeno, CN, OCH_3 y $S(O)_pCH_3$;

cada grupo R^4 unido al anillo K en la posición 2 es CH_3 , CF_3 , OCF_3 , $OCHF_2$, $S(O)_pCF_3$, $S(O)_pCHF_2$, CN o halógeno;

un segundo R^4 opcional es F, Cl, Br, I, CN o CF_3 ;

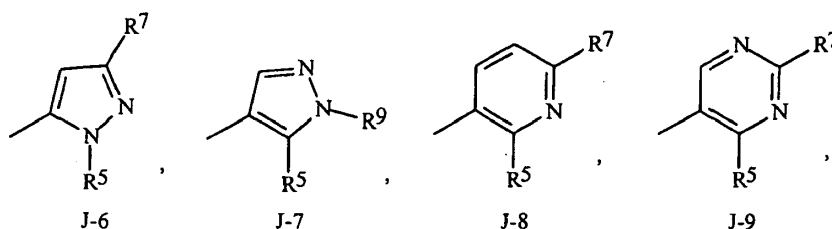
20 cada R^5 es independientemente halógeno, metilo, CF_3 , OCF_3 , $OCHF_2$, $S(O)_pCF_3$, $S(O)_pCHF_2$, OCH_2CF_3 , OCF_2CHF_2 , $S(O)_pCH_2CF_3$ o $S(O)_pCF_2CHF_2$; o un anillo fenilo, pirazol, imidazol, triazol, piridina o pirimidina, cada anillo opcionalmente sustituido con 1 a 3 sustituyentes seleccionados independientemente de alquilo C_1 - C_4 , haloalquilo C_1 - C_4 , halógeno y CN; y

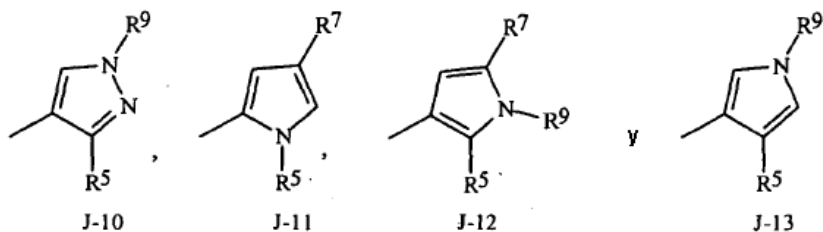
p es 0, 1 ó 2.

25 Preferencia 2. Compuestos de la Preferencia 1 en donde R^3 es alquilo C_1 - C_4 .

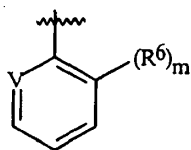
Preferencia 3. Compuestos de la Preferencia 1 en los que

J se selecciona del grupo que consiste en





R⁵ es alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, o



V es N, CH, CF, CCl, CBr o Cl;

5 R⁶ es alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, halógeno, CN, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄ o haloalquil(C₁-C₄)tio;

R⁷ es H, alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, haloalquilo C₁-C₄, halógeno, CN, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄ o haloalquil(C₁-C₄)tio;

10 R⁹ es H, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alquenilo C₃-C₆, haloalquenilo C₃-C₆, alquinilo C₃-C₆ o haloalquinilo C₃-C₆; con la condición de que R⁷ y R⁹ no sean los dos H; y

m es 0 o 1.

Preferencia 4. Compuestos de la Preferencia 3 en donde V es N.

Preferencia 5. Compuestos de la Preferencia 3 en donde V es CH, CF, CCl o CBr.

Preferencia 6. Compuestos de la Preferencia 4 o la Preferencia 5 en la que

15 R³ es H; o alquilo C₁-C₄ opcionalmente sustituido con 1 a 5 sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste en halógeno, CN, OCH₃ y S(O)_pCH₃;

un grupo R⁴ está unido al anillo K en la posición 2 y dicho R⁴ es CH₃, CF₃, OCF₃, OCHF₂, S(O)_pCF₃, S(O)_pCHF₂, CN o halógeno;

un segundo R⁴ opcional es F, Cl, Br, I, CN o CF₃;

20 R⁶ es H, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, halógeno o CN;

R⁷ es H, CH₃, CF₃, OCHF₂, OCH₂CF₃ o halógeno; y

p es 0, 1 ó 2.

Preferencia 7. Compuestos de la Preferencia 6 en donde R³ es H o alquilo C₁-C₄; y el grupo R⁴ unido a la posición 2 es CH₃, Cl, Br o I.

25 Preferencia 8. Compuestos de la Preferencia 7 en la que J es J-6; R⁶ es halógeno; y R⁷ es halógeno o CF₃.

Preferencia 9. Compuestos de la Preferencia 8 en la que V es N; R³ es H o metilo, etilo, isopropilo o butilo terciario; y R⁷ es Br, Cl o CF₃.

Preferencia 10. Compuestos de la Preferencia 7 en la que J es J-7; R⁶ es halógeno; y R⁹ es CF₃, CHF₂, CH₂CF₃ o CF₂CHF₂.

30 Preferencia 11. Compuestos de la Preferencia 7 en la que J es J-8; R⁶ es halógeno; y R⁷ es halógeno o CF₃.

Preferencia 12. Compuestos de la Preferencia 7 en la que J es J-9; R⁶ es halógeno; y R⁷ es CF₃.

Preferencia 13. Compuestos de la Preferencia 7 en la que J es J-10; R⁶ es halógeno; y R⁹ es CF₃, CHF₂, CH₂CF₃ o CF₂CHF₂.

Preferencia 14. Compuestos de la Preferencia 7 en la que J es J-11; R⁶ es halógeno; y R⁷ es halógeno o CF₃.

5 Preferencia 15. Compuestos de la Preferencia 7 en la que J es J-12; R⁶ es halógeno; R⁷ es H, halógeno o CF₃; y R⁹ es H, CF₃, CHF₂, CH₂CF₃, o CF₂CHF₂.

Preferencia 16. Compuestos de la Preferencia 7 en la que J es J-13; R⁶ es halógeno; R⁷ es H, halógeno o CF₃; y R⁹ es H, CF₃, CHF₂, CH₂CF₃, o CF₂CHF₂.

Los más preferidos son compuestos de la Preferencia 9 seleccionados del grupo:

- 10 6-Bromo-1-[[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]carbonil]-8-metil-3-(1-metiletil)-2,4(1H,3H)-quinazolinadiona,
- 6-Bromo-1-[[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-il]carbonil]-3,8-dimetil-2,4(1H,3H)-quinazolinadiona,
- 6-Bromo-1-[[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]carbonil]-3,8-dimetil-2,4(1H,3H)-quinazolinadiona,
- 1-[[3-Bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]carbonil]-2,3-dihidro-8-metil-3-(1-metiletil)-4(1H)-quinazolinona,
- 6,8-Dicloro-1-[[3-cloro-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]carbonil]-2,3-dihidro-3-(1-metiletil)-4(1H)-quinazolinona,
- 15 1-[[3-Bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]carbonil]-6,8-dicloro-2,3-dihidro-3-(1-metiletil)-4(1H)-quinazolinona,
- 6,8-Dicloro-1-[[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-il]carbonil]-2,3-dihidro-3-metil-4(1H)-quinazolinona,
- 6-Cloro-1-[[3-cloro-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]carbonil]-2,3-dihidro-8-metil-3-(1-metiletil)-4(1H)-quinazolinona,
- 1-[[3-Bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]carbonil]-6-cloro-2,3-dihidro-8-metil-3-(1-metiletil)-4(1H)-quinazolinona,
- 20 6,8-Dicloro-1-[[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-il]carbonil]-2,3-dihidro-3-(1-metiletil)-4(1H)-quinazolinona,
- 6-8-Dicloro-1-[[3-cloro-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]carbonil]-2,3-dihidro-3-metil-4(1H)-quinazolinona,
- 1-[[3-Bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]carbonil]-6,8-dicloro-2,3-dihidro-3-metil-4(1H)-quinazolinona,
- 25 6-Cloro-1-[[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-il]carbonil]-2,3-dihidro-8-metil-3-(1-metiletil)-4(1H)-quinazolinona,
- 6-Cloro-1-[[3-cloro-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]carbonil]-2,3-dihidro-3,8-dimetil-4(1H)-quinazolinona,
- 1-[[3-Bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]carbonil]-6-cloro-2,3-dihidro-3,8-dimetil-4(1H)-quinazolinona,
- 6-Cloro-1-[[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-il]carbonil]-2,3-dihidro-3,8-dimetil-4(1H)-quinazolinona,
- 6,8-Dicloro-1-[[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-il]carbonil]-2,3-dihidro-4(1H)-quinazolinona y
- 30 6,8-Dicloro-1-[[3-cloro-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]carbonil]-2,3-dihidro-4(1H)-quinazolinona.

Esta invención también se refiere a una composición para controlar una plaga de invertebrados que comprende una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto de Fórmula I, y al menos un componente adicional seleccionado entre el grupo que consiste en tensioactivos, un N-óxido del mismo o una sal agrícolamente adecuada del mismo, diluyentes sólidos y diluyentes líquidos. Esta invención se refiere también a una composición que comprende una

35 cantidad biológicamente eficaz de un compuesto de la Fórmula I y una cantidad eficaz de al menos un compuesto o agente biológicamente activo adicional. Las composiciones preferidas de la presente invención son aquellas que comprenden los compuestos preferidos anteriores.

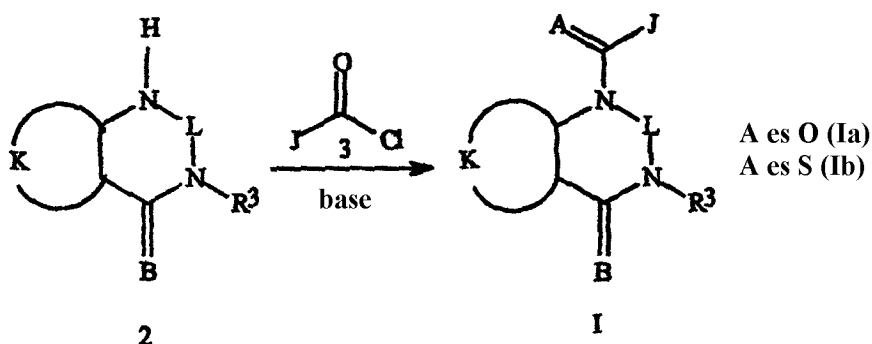
Esta invención también se refiere a un método para controlar una plaga de invertebrados que comprende poner en contacto la plaga de invertebrados o su medio con una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto de Fórmula I (p.ej., como una composición descrita en la presente memoria). Esta invención también se refiere a un método tal que la plaga de invertebrados o su medio se pone en contacto con una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto de Fórmula I o una composición que comprende un compuesto de Fórmula I y una cantidad biológicamente activa de al menos un compuesto o agente adicional para controlar plagas de invertebrados. Los métodos preferidos de uso son aquellos que implican los compuestos preferidos anteriores.

40

Los compuestos de la Fórmula I se pueden preparar mediante uno o más de los siguientes métodos y variaciones descritos en los Esquemas 1-1. Las definiciones de A, B, J, K, L, R³, R⁴, R⁵ y n en los compuestos de Fórmulas I y 2-23 más adelante son como se definen anteriormente en el compendio de la invención. Los compuestos de Fórmulas Ia-Ic, If, 2a-c, 9a-i y 10a-c son diversos subconjuntos de los compuestos de Fórmula I, 2, 9 y 10, respectivamente, y todos los sustituyentes para las Fórmulas Ia-If son como se definieron anteriormente para la Fórmula I.

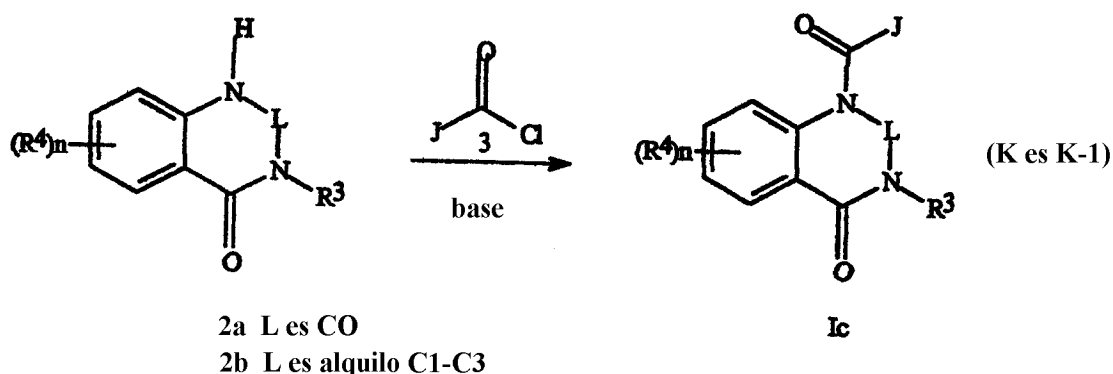
Como se muestra en el Esquema 1, los compuestos de Fórmula I se pueden preparar por la reacción de aril- o heteroarilaminas de Fórmula 2 con cloruros de ácido de Fórmula 3 en presencia de una base para proporcionar un compuesto de Fórmula Ia. La reacción se puede ejecutar en forma pura o en diversos disolventes adecuados, que incluyen tetrahidrofurano, tolueno, cloruro de metileno y cloroformo, con temperaturas óptimas que oscilan desde la temperatura ambiente hasta la temperatura de reflujo del disolvente. Las bases típicas usadas en la reacción incluyen aminas tales como trietilamina y piridina, carbonatos tales como carbonato de potasio y de sodio, e hidruros tales como hidruro de potasio y de sodio. En una etapa posterior, los compuestos de la Fórmula Ia pueden ser convertidos en los compuestos de Fórmula Ib usando diversos reactivos de tiotransferencia estándar, que incluyen pentasulfuro de fósforo y 2,4-disulfuro de (2,4-bis(4-metoxifenil)-1,3-ditia-2,4-difosfetano).

Esquema 1

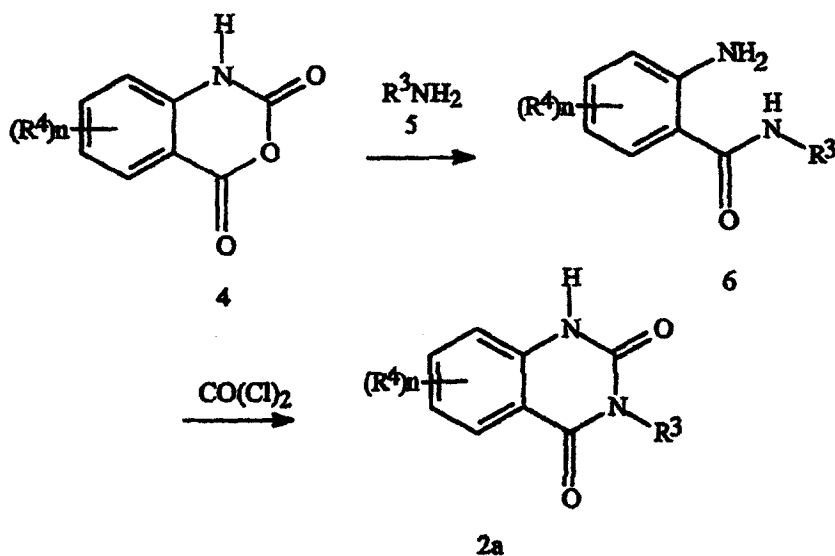


La preparación de compuestos de Fórmula Ic, es decir, compuestos de Fórmula I en donde K es K-1, se bosqueja en el Esquema 2. La reacción de una quinazolinadiona de Fórmula 2a (en donde L es CO) o un derivado de Fórmula 2b (en donde L es alquilo C₁-C₃ opcionalmente sustituido con uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente de R¹³), con un cloruro de ácido de Fórmula 3 proporciona un compuesto de Fórmula Ic. Estos procedimientos también se pueden aplicar para preparar compuestos de Fórmula I en donde K se selecciona de K-2 a K-6.

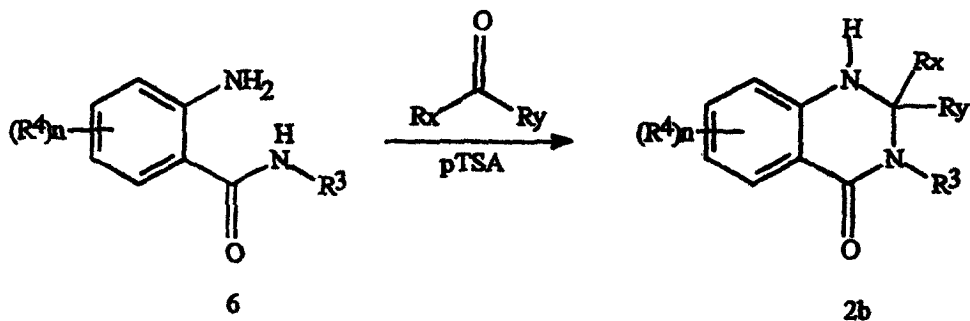
Esquema 2



Como se muestra en el Esquema 3, los compuestos de Fórmula 2a se pueden preparar en dos etapas a partir de anhídridos isatoicos conocidos. En la primera etapa un anhídrido isatoico de Fórmula 4 se hace reaccionar directamente con una amina de Fórmula 5 bien pura o bien en un disolvente adecuado para proporcionar una amida de Fórmula 6. El tratamiento de la amida de Fórmula 6 con fosgeno o un equivalente del fosgeno proporciona la quinazolinadiona de Fórmula 2a.

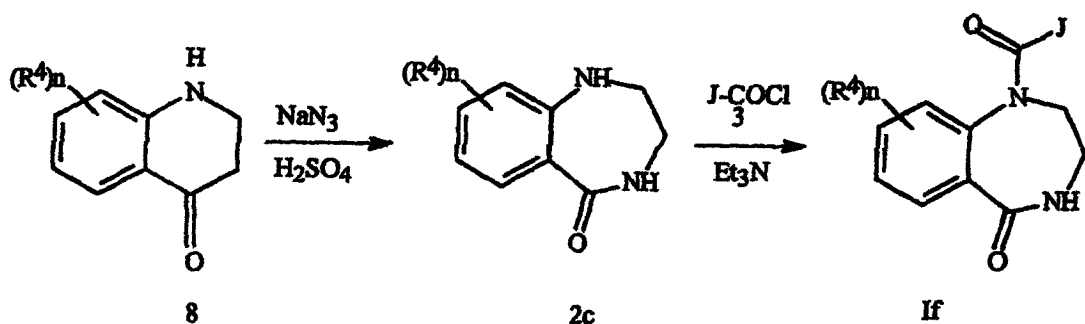
Esquema 3

Como se muestra en el Esquema 4, los compuestos de Fórmula 2b, en donde Rx y Ry son independientemente H y subconjuntos de R¹³, se pueden preparar a partir de los compuestos de Fórmula 6 por reacción con un aldehído o cetona generalmente en presencia de un catalizador ácido tal como ácido p-toluenosulfónico (pTSA). La retirada azeotrópica del agua según se forma, u otros métodos de secado, pueden ser útiles para llevar la reacción hasta la compleción.

Esquema 4

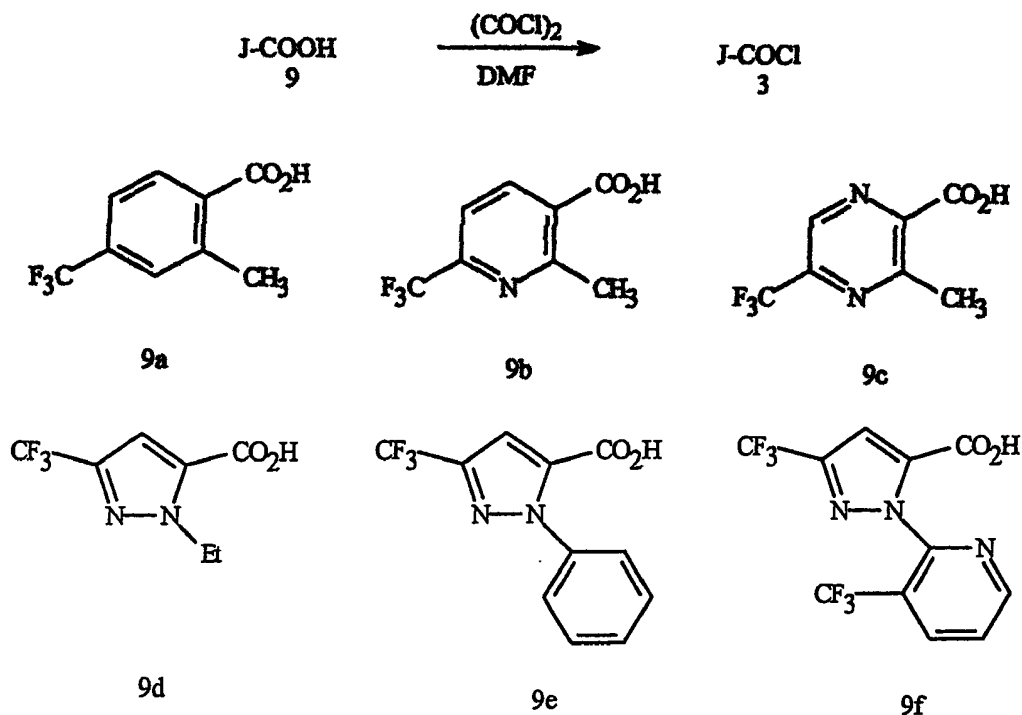
Rx y Ry son independientemente cada uno H, alquilo o arilo

Como se muestra en el Esquema 5, los compuestos de Fórmula 2c se pueden preparar por la reacción de Schmidt a partir de tetrahydroquinolinonas de Fórmula 8 y azida de sodio (J. Het. Chem. 1971, 8, 231-236). La reacción de un compuesto de Fórmula 2c con un cloruro de ácido 3 en presencia de una base tal como trietilamina proporciona un producto de Fórmula If.

Esquema 5

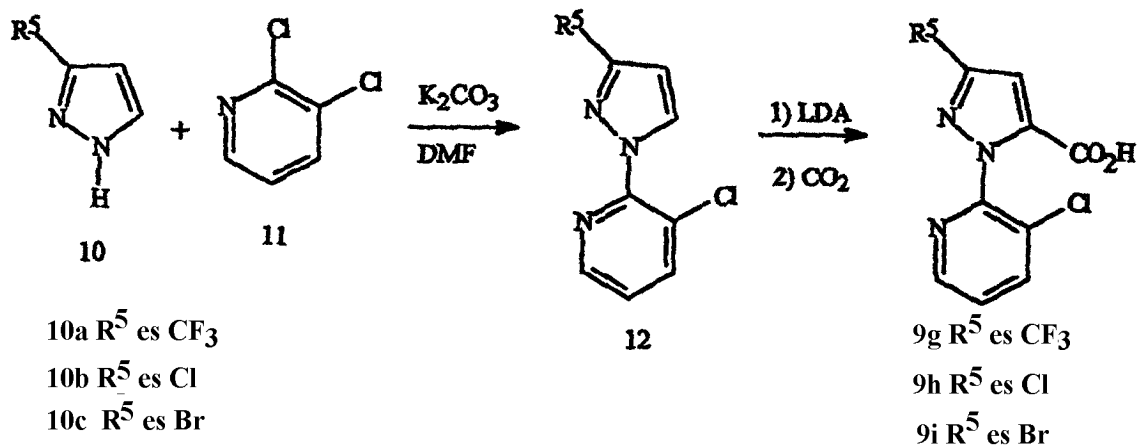
Los cloruros de ácido de la Fórmula 3 están bien documentados en la bibliografía química y se derivan generalmente de los correspondientes ácidos aril- y heteroarilcarboxílicos conocidos de Fórmula 9. Muchos de los ácidos carboxílicos de Fórmula 9 son conocidos en la bibliografía. Se describen procedimientos para la preparación de ácidos preferidos específicos de Fórmula 9a-9f y sus cloruros de ácido derivados en la solicitud de patente internacional WO 01/70671.

Esquema 6



Los ácidos piridilpirazolcarboxílicos de Fórmula 9g-9i son un conjunto específicamente preferido de ácidos de Fórmula 9 (Esquema 7). La reacción de un pirazol de Fórmula 10 con 2,3-dicloropiridina de Fórmula 11 proporciona buenos rendimientos del 1-piridilpirazol de Fórmula 12 con buena especificidad para la regioquímica deseada. La metalación de los compuestos de Fórmula 12 con diisopropilamida de litio (LDA) seguido de inactivación de la sal de litio con dióxido de carbono proporciona los ácidos de pirazol de Fórmula 9g-9i. Se proporcionan detalles adicionales para la síntesis de la Fórmula 9i en el Ejemplo 1.

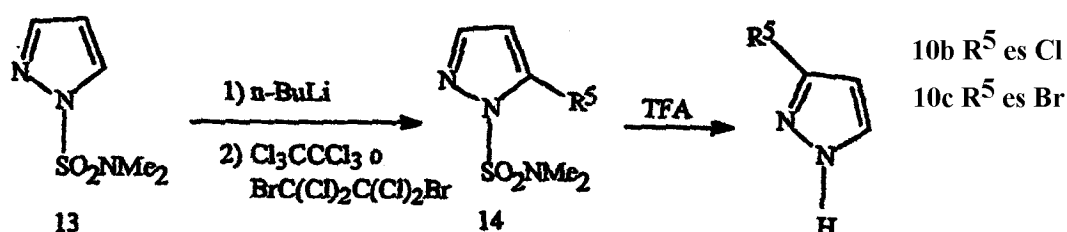
Esquema 7



Los pirazoles de partida de Fórmula 10 son compuestos conocidos o pueden prepararse de acuerdo con métodos conocidos. El pirazol 10a se puede preparar por procedimientos de la bibliografía (J. Fluorine Chem. 1991, 53(1), 61-70). Los pirazoles de las Fórmulas 10b y 10c también se pueden preparar por procedimientos de la bibliografía

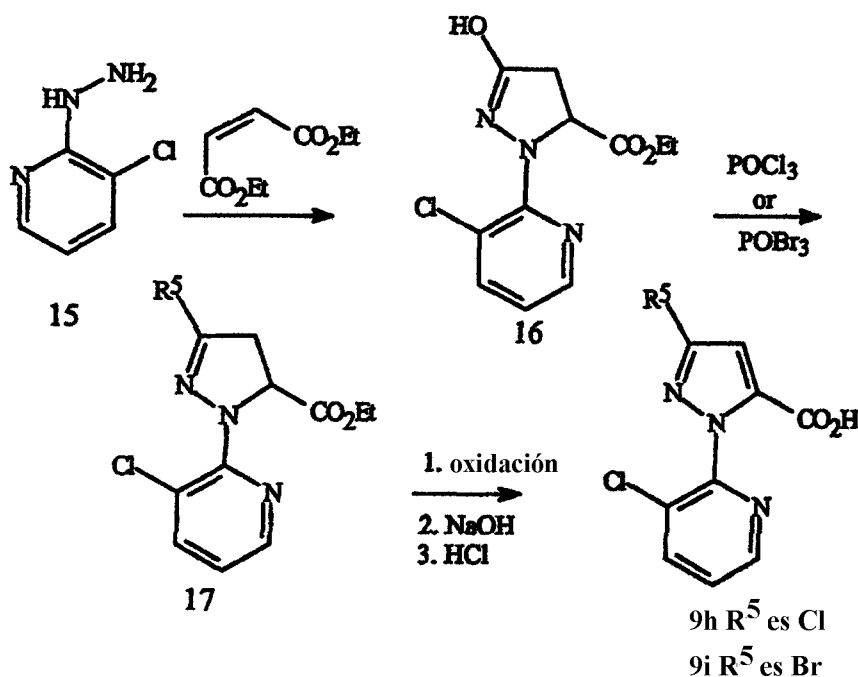
(Chem. Ber. 1966, 99(10), 3350-7). Una alternativa útil para la preparación del compuesto 10b y 10c se representa en el Esquema 8. La metalación del sulfamoilpirazol de Fórmula 13 con n-butil-litio (n-BuLi) seguido de halogenación directa del anión con hexacloroetano o bien 1,2-dibromotetracloroetano proporciona los derivados halogenados de Fórmula 14. La retirada del grupo sulfamoilo con ácido trifluoroacético (TFA) a temperatura ambiente procede limpiamente y en buen rendimiento para proporcionar los pirazoles 10b y 10c respectivamente. Se describen detalles experimentales adicionales para estos procedimientos en el Ejemplo 1.

Esquema 8



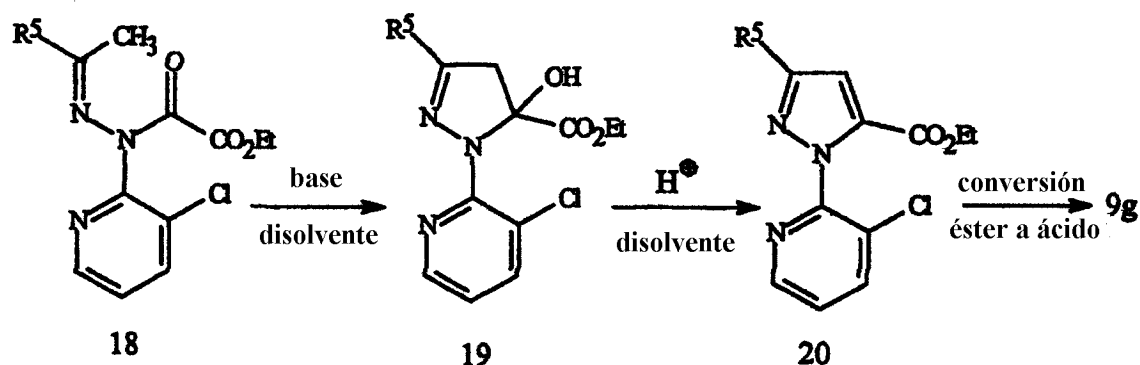
Como una alternativa para el método ilustrado en el Esquema 7, los ácidos pirazolcarboxílicos de la Fórmula 9h y 9i se pueden preparar por el método bosquejado en el Esquema 9. La reacción de la hidrazinopiridina 15 con maleato de dietilo proporciona la pirazolona 16. La cloración o bromación con oxiclورو de fósforo u oxibromuro de fósforo proporciona los haloderivados de Fórmula 17. La oxidación de un compuesto de Fórmula 17 opcionalmente en presencia de ácido para dar un éster de pirazol seguido de la conversión de la función éster en el ácido carboxílico proporciona un compuesto de Fórmula 9h o 9i. El agente de oxidación puede ser peróxido de hidrógeno, peróxidos orgánicos, persulfato de potasio, persulfato de amonio, monopersulfato de potasio (por Ejemplo, Oxone®) o permanganato de potasio.

Esquema 9



Como una alternativa para el método ilustrado en el Esquema 7, los ácidos pirazolcarboxílicos de la Fórmula 9g en donde R^5 es CF_3 también se pueden preparar por el método bosquejado en el Esquema 10.

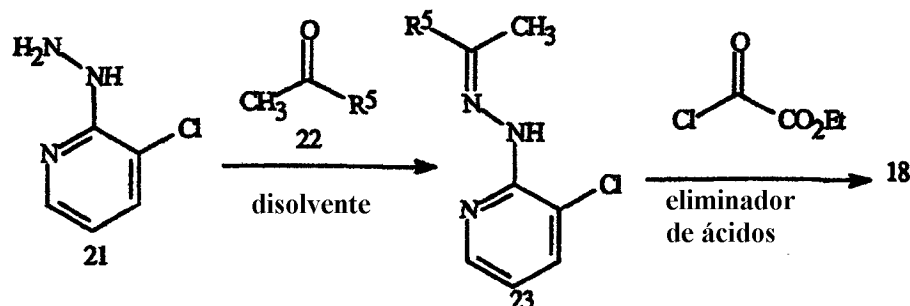
Esquema 10



La reacción de un compuesto de Fórmula 18 con una base adecuada en un disolvente orgánico adecuado proporciona el producto ciclado de Fórmula 19 después de la neutralización con un ácido tal como ácido acético. La base adecuada puede ser, por Ejemplo, hidruro de sodio, *t*-butóxido de potasio, dimsil sodio ($\text{CH}_3\text{S}(\text{O})\text{CH}_2^- \text{Na}^+$), carbonatos o hidróxidos de metales alcalinos (tales como litio, sodio o potasio), fluoruros o hidróxidos de tetraalquil- (tal como metil, etil o butil) amonio, o 2-*terc*-butilimino-2-dietilamino-1,3-dimetil-perhidro-1,3,2-diazafosfonina. El disolvente orgánico adecuado puede ser, por Ejemplo, acetona, acetonitrilo, tetrahidrofurano, diclorometano, dimetilsulfóxido, o *N,N*-dimetilformamida. La deshidratación del compuesto de Fórmula 19 para dar el compuesto de Fórmula 20, seguido de convertir la función éster carboxílico en ácido carboxílico, proporciona los ácidos de Fórmula 9g. La deshidratación se efectúa por tratamiento con una cantidad catalítica de un ácido adecuado tal como ácido sulfúrico.

Los compuestos de la Fórmula 18 se pueden preparar por el método bosquejado en el Esquema 11.

Esquema 11



en donde R^5 es CF_3 .

El tratamiento de un compuesto de hidrazina de la Fórmula 21 con una cetona de la Fórmula 22 en un disolvente tal como agua, metanol o ácido acético da la hidrazona de la Fórmula 23. La reacción de la hidrazona de Fórmula 23 con cloruro de etiloxalilo en un disolvente orgánico adecuado tal como diclorometano o tetrahidrofurano en presencia de un eliminador de ácidos tal como trietilamina proporciona el compuesto de Fórmula 18. Los compuestos de hidrazina de la Fórmula 21 se pueden preparar por métodos estándar, tales como poner en contacto el correspondiente halocompuesto de la Fórmula 11 con hidrazina.

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

diversas reacciones electrofílicas, nucleofílicas, de radicales, organometálicas, de oxidación, y de reducción para añadir sustituyentes o modificar los sustituyentes existentes.

Sin más elaboración, se cree que un experto en la técnica que use la descripción precedente puede utilizar la presente invención hasta su grado más completo. Los siguientes Ejemplos son, por lo tanto, para ser interpretados como meramente ilustrativos. Los porcentajes están en peso excepto para mezclas de disolventes cromatográficos o cuando se indique otra cosa. Las partes y porcentajes para las mezclas de disolventes cromatográficos son en volumen a menos que se indique de otro modo. Los espectros de ^1H NMR se reportan en ppm campo abajo a partir de tetrametilsilano; s es singlete, d es doblete, t es triplete, q es cuarteto, m es multiplete, dd es doblete de dobletes, dt es doblete de tripletes, sa es singlete ancho.

10 Ejemplos

Ejemplo 1

6-Bromo-1-[[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1*H*-pirazol-5-il]carbonil]-8-metil-3-(1-metiletil)-2,4(1*H*,3*H*)-quinazolinadiona

Etapas A: Preparación de 3-bromo-*N,N*-dimetil-1*H*-pirazol-1-sulfonamida

A una disolución de *N*-dimetilsulfamoylpirazol (44,0 g, 0,251 mol) en tetrahidrofurano seco (500 ml) a -78 °C se le añadió gota a gota una solución de *n*-butil-litio (2,5 M en hexano, 105,5 ml, 0,264 mol) mientras se mantenía la temperatura por debajo de -60 °C. Se formó un sólido grueso durante la adición. Tras completarse la adición, la mezcla de reacción se mantuvo durante 15 minutos adicionales, tiempo después del cual se añadió gota a gota una disolución de 1,2-dibromo-tetracloroetano (90 g, 0,276 mol) en tetrahidrofurano (150 ml) mientras se mantenía la temperatura por debajo de -70 °C. La mezcla de reacción se volvió de color naranja claro; la agitación se continuó durante 15 minutos adicionales. El baño a -78 °C se retiró y la reacción se inactivó con agua (600 ml). La mezcla de reacción se extrajo con diclorometano (4x), y los extractos orgánicos se secaron sobre sulfato de magnesio y se concentraron. El producto bruto se purificó adicionalmente por cromatografía en gel de sílice usando diclorometano-hexano (50:50) como eluyente para proporcionar el producto del título como un aceite incoloro transparente (57,04 g).

^1H NMR (CDCl_3) δ 3,07 (d, 6H), 6,44 (m, 1H), 7,62 (m, 1H).

Etapas B: Preparación de 3-bromopirazol

A ácido trifluoroacético (70 ml) se le añadió lentamente el producto de bromopirazol (57,04 g) de la Etapa A. La mezcla de reacción se agitó a temperatura ambiente durante 30 minutos y después se concentró a presión reducida. El residuo se recogió en hexano, los sólidos insolubles se retiraron por filtración, y el hexano se evaporó para proporcionar el producto bruto como un aceite. El producto en bruto se purificó adicionalmente por cromatografía en gel de sílice usando acetato de etilo/diclorometano (10:90) como eluyente para proporcionar un aceite. El aceite se recogió en diclorometano, se neutralizó con una disolución acuosa de bicarbonato de sodio, se extrajo con diclorometano (3 x), se secó sobre sulfato de magnesio y se concentró para proporcionar el producto del título como un sólido blanco (25,9 g), p.f. 61-64 °C.

^1H NMR (CDCl_3) δ 6,37 (d, 1H), 7,59 (d, 1H), 12,4 (s a, 1H).

Etapas C: Preparación de 2-(3-bromo-1*H*-pirazol-1-il)-3-cloropiridina

A una mezcla de 2,3-dicloropiridina (27,4 g, 185 mol) y 3-cloropirazol (25,4 g, 176 mol) en *N,N*-dimetilformamida seca (88 ml) se le añadió carbonato de potasio (48,6 g, 352 mol) y la mezcla de reacción se calentó a 125 °C durante 18 horas. La mezcla de reacción se enfrió hasta la temperatura ambiente y se vertió en hielo y agua (800 ml). Se formó un precipitado. Los sólidos precipitados se agitaron durante 1,5 h, se filtraron y se lavaron con (2 x 100 ml). La pasta sólida del filtro se recogió en diclorometano y se lavó secuencialmente con agua, ácido clorhídrico 1 N, una disolución acuosa saturada de bicarbonato de sodio y salmuera. Después los extractos orgánicos se secaron sobre sulfato de magnesio y se concentraron para proporcionar 39,9 g de un sólido rosa. El sólido bruto se suspendió en hexano y se agitó vigorosamente durante 1 hora. Los sólidos se filtraron, se lavaron con hexano y se secaron para proporcionar el producto del título como un polvo blanquecino (30,4 g) que se determinó que era > 94% puro por NMR. Este material se usó sin purificación adicional en la Etapa D.

^1H NMR (CDCl_3) δ 6,52 (s, 1H), 7,30 (dd, 1H), 7,92 (d, 1H), 8,05 (s, 1H), 8,43 (d, 1H).

Etapas D: Preparación de ácido 3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1*H*-pirazol-5-carboxílico

A una disolución del producto de pirazol de la Etapa C (30,4 g, 118 mmol) en tetrahidrofurano seco (250 ml) a -76 °C se le añadió gota a gota una disolución de diisopropilamida de litio (118 mmol) en tetrahidrofurano a una velocidad tal para mantener la temperatura por debajo de -71 °C. La mezcla de reacción se agitó durante 15 minutos a -76 °C, y después se burbujeó dióxido de carbono a través de la misma durante 10 minutos, lo que provocó un calentamiento hasta -57 °C. La mezcla de reacción se calentó hasta -20 °C y se inactivó con agua. La mezcla de reacción se concentró y después se recogió en agua (1 l) y éter (500 ml), y después se le añadió una disolución

acuosa de hidróxido de sodio (1 N, 20 ml). Los extractos orgánicos se lavaron con éter y se acidularon con ácido clorhídrico. Los sólidos precipitados se filtraron, se lavaron con agua y se secaron para proporcionar el producto del título como un sólido de color canela (27,7 g). (El producto de otra realización siguiendo un procedimiento similar se funde a 200-201 °C).

5 ^1H NMR (DMSO- d_6) δ 7,25 (s, 1H), 7,68 (dd, 1H), 8,24 (d, 1H), 8,56 (d, 1H).

Etapas E: Preparación de 6-bromo-8-metil-2*H*-3,1-benzoxazina-2,4(1*H*)-diona

10 A una disolución de 8-metil-2*H*-3,1-benzoxazina-2,4(1*H*)-diona, (10,0 g, 56,5 mmol) y yoduro de potasio (0,36 g, 1,8 mmol) en ácido clorosulfónico (12 ml) se añadió bromo (4,6 g, 28,7 mmol), y la reacción se agitó durante una noche a temperatura ambiente. Después la reacción se vertió lentamente sobre agua helada y se neutralizó con polvo de bicarbonato de sodio hasta un pH de 7. Los sólidos se filtraron, se aclararon con agua para proporcionar el compuesto intermedio deseado como un sólido blanco (11,4 g).

^1H NMR (DMSO) δ 2,34 (s, 3H), 7,76 (m, 3H), 7,85 (m, 1H), 11,21 (s, 1H).

Etapas F: Preparación de 2-amino-5-bromo-3-metil-*N*-(1-metiletil)benzamida

15 A una suspensión de la benzoxazinadiona de la Etapa E, (4,0 g, 15,56 mmol) en piridina (20 ml) se añadió isopropilamina (1,2 g, 20,23 mmol) y la reacción se calentó a reflujo durante 2 horas. Después se enfrió la reacción, se concentró a partir de tolueno en un evaporador rotatorio y después se secó a vacío para proporcionar un sólido (5,01 g).

^1H NMR (DMSO) δ 1,29 (d, 6H), 2,15 (s, 3H), 4,25 (m, 1H), 5,75 (m, 1H), 7,24 (m, 1H), 7,27 (m, 1H).

Etapas G: Preparación de 6-bromo-8-metil-metiletil-2,4(1*H*,3*H*)-quinazolinadiona

20 A una disolución de la antranilamida de la Etapa F, (1,11 g, 4,1 mmol) en dioxano (20 ml) se añadió una disolución 2,0 M de fosgeno en tolueno (2,3 ml, 4,6 mmol). La reacción se agitó a temperatura ambiente durante 1 hora, después a reflujo durante 4 horas, y se enfrió hasta la temperatura ambiente. Los sólidos blancos se filtraron y se secaron para proporcionar el compuesto del título (0,89 g). ^1H NMR (DMSO) δ 1,43 (d, 6H), 2,34 (s, 3H), 5,12 (m, 1H), 7,67 (s, 1H), 7,85 (s, 1H).

25 Etapas H: Preparación de 6-bromo-1-[[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1*H*-pirazol-5-il]carbonil]-8-metil-3-(1-metiletil)-2,4(1*H*,3*H*)-quinazolinadiona

30 A una disolución de la quinazolinadiona de la Etapa G (245 mg, 0,825 mmol) en dimetilformamida (5 ml) se añadió hidruro de sodio (dispersión en aceite al 60 %, 36 mg, 0,90 mmol) y se dejó que la reacción se agitara a temperatura ambiente. En un matraz de reacción independiente que contenía una disolución del ácido de pirazol de la Etapa D (500 mg, 1,65 mmol) en diclorometano (10 ml) se añadió cloruro de oxalilo (0,17 ml, 1,95 mmol) y una gota de DMF. Esta mezcla se agitó durante 2 horas, después se concentró y se puso a vacío. El cloruro de ácido se dividió en dos porciones iguales. Una de estas porciones se recogió en 5 ml de DMF y se añadió a la mezcla de reacción de quinazolinadiona/NaH, y la mezcla resultante se agitó a temperatura ambiente durante 3 horas. La reacción se repartió entre acetato de etilo y agua, se lavó dos veces con agua, después con salmuera y se secó sobre sulfato de sodio. El producto bruto se purificó por cromatografía sobre gel de sílice con cloroformo/acetona 99:1 como eluyente para proporcionar el compuesto del título, un compuesto de la presente invención.

35 ^1H NMR (CDCl₃) δ 1,47 (d, 6H), 2,17 (s, 3H), 5,08 (m, 1H), 7,12 (s, 1H), 7,39 (dd, 1H), 7,54 (d, 1H), 7,91 (dd, 1H), 8,17 (d, 1H), 8,34 (dd, 1H).

Ejemplo 2

40 Preparación de 1-[[3-Bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1*H*-pirazol-5-il]carbonil]-2,3-dihidro-8-metil-3-(1-metiletil)-4(1*H*)-quinazolinona

Etapas A: Preparación de 2,3-dihidro-8-metil-3-(1-metiletil)-4(1*H*)-quinazolinona

45 A una disolución de 2-amino-3-metil-*N*-(1-metiletil)benzamida (0,5 g, 2,6 mmol) en etanol (10 ml) se añadió paraformaldehído (78 mg, 2,6 mmol) y ácido *p*-toluenosulfónico (18 mg, 95 μmol) y la mezcla se calentó a reflujo hasta que se volvió transparente (aproximadamente 4 horas). El disolvente se retiró a presión reducida para dar el compuesto del título (95% puro) que se usó sin purificación adicional.

^1H NMR (CDCl₃) δ 7,9-7,8 (d, 1H), 7,2-7,1 (d, 1H), 6,83 (t, 1H), 4,97 (m, 1H), 4,57 (s, 2H), 2,17 (s, 3H), 1,22 (d, 6H).

Etapas B: Preparación de 1-[[3-Bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1*H*-pirazol-5-il]carbonil]-2,3-dihidro-8-metil-3-(1-metiletil)-4(1*H*)-quinazolinona

A una disolución de ácido 3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1*H*-pirazol-5-carboxílico (787 mg, 2,45 mmol) (es decir, el producto del Ejemplo 1, Etapa D) en diclorometano (10 ml) se añadió dimetilformamida (20 µl) y cloruro de oxalilo (235 µl). La mezcla se agitó durante 1 hora, punto en el cual se hubo vuelto transparente. Después de retirar los volátiles a presión reducida, el residuo se disolvió en diclorometano (5 ml) y una mitad de la disolución se añadió a una mezcla del producto de la Etapa A (0,25 g, 1,2 mmol) y piridina (148 µl, 1,8 mmol) en cloruro de metileno (10 ml). Después de agitar a temperatura ambiente durante una noche, se añadió 1,5,7-triazabicyclo[4.4.0]dec-5-eno unido a poliestireno reticulado con 2% de DVB (1 g) (Fluka Chemie AG, número de catálogo 90603) y la mezcla se agitó durante 15 minutos adicionales. Después la mezcla se filtró y se concentró a presión reducida. El residuo resultante se purificó por cromatografía sobre gel de sílice para dar el compuesto del título, un compuesto de la invención, como un sólido blanco (0,18 g).

¹H NMR (CDCl₃) δ 8,3 (m, 1H), 7,9-7,8 (m, 2H), 7,4-7,3 (m, 3H), 6,0-5,9 (s, 1H), 5,9 (d, 1H), 5,0-4,8 (m, 1H), 4,4-4,3 (d, 1H), 2,10 (s, 3H), 1,3-1,1 (m, 6H).

El siguiente Ejemplo 3 ilustra una preparación alternativa de ácido 3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1*H*-pirazol-5-carboxílico, que se puede usar para preparar, por Ejemplo, 6-bromo-1-[[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1*H*-pirazol-5-il]carbonil]-8-metil-3-(1-metiletil)-2,4(1*H*,3*H*)-quinazolinadiona y 1-[[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1*H*-pirazol-5-il]carbonil]-2,3-dihidro-8-metil-3-(1-metiletil)-4(1*H*)-quinazolinona, mediante etapas adicionales ilustradas en el Ejemplo 1 y 2.

Ejemplo 3

Preparación de ácido 3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1*H*-pirazol-5-carboxílico

Etapa A: Preparación de 2-(3-Cloro-2-piridinil)-5-oxo-3-pirazolidinacarboxilato de etilo

Un matraz de 2 l, de cuatro cuellos, equipado con un agitador mecánico, termómetro, embudo de adición, condensador de reflujo y entrada de nitrógeno se cargó con etanol absoluto (250 ml) y una disolución etanólica de etóxido de sodio (21%, 190 ml, 0,504 mol). La mezcla se calentó a reflujo a aproximadamente 83 °C. Después se trató con 3-cloro-2(1*H*)-piridinona hidrazona (68,0 g, 0,474 mol). La mezcla se volvió a calentar a reflujo a lo largo de un periodo de 5 minutos. La suspensión espesa amarilla se trató después gota a gota con maleato de dietilo (88,0 ml, 0,544 mol) a lo largo de un periodo de 5 minutos. La velocidad de reflujo se incrementó notablemente durante la adición. Al final de la adición, todo el material de partida se había disuelto. La disolución anaranjada-roja resultante se mantuvo a reflujo durante 10 minutos. Después de ser enfriada a 65 °C, la mezcla de reacción se trató con ácido acético glacial (50,0 ml, 0,873 mol). Se formó un precipitado. La mezcla se diluyó con agua (650 ml), lo que provocó que el precipitado se disolviera. La disolución anaranjada se enfrió en un baño de hielo. El producto comenzó a precipitar a 28 °C. La suspensión fue mantenida a aproximadamente 2 °C durante 2 horas. El producto se aisló por medio de filtración, se lavó con etanol acuoso (40%, 3 x 50 ml), después se secó al aire sobre el filtro durante alrededor de 1 hora. El compuesto del producto del título se obtuvo en forma de un polvo anaranjado claro muy cristalino (70,3 g, 55% de rendimiento). No se observaron impurezas significativas mediante ¹H NMR.

¹H NMR (DMSO-*d*₆) δ 1,22 (t, 3H), 2,35 (d, 1H), 2,91 (dd, 1H), 4,20 (c, 2H), 4,84 (d, 1H), 7,20 (dd, 1H), 7,92 (d, 1H), 8,27 (d, 1H), 10,18 (s, 1H).

Etapa B: Preparación de 3-Bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-4,5-dihidro-1*H*-pirazol-5-carboxilato de etilo

Un matraz de cuatro cuellos de 1 l equipado con un agitador mecánico, termómetro, condensador de reflujo y entrada de nitrógeno se cargó con acetonitrilo (400 ml), 2-(3-cloro-2-piridinil)-5-oxo-3-pirazolidinacarboxilato de etilo (es decir, el producto de la Etapa A) (50,0 g, 0,185 mol) y oxibromuro de fósforo (34,0 g, 0,119 mol). La suspensión naranja se calentó a reflujo a 83 °C a lo largo de un periodo de 20 minutos. La disolución naranja turbia resultante se mantuvo a reflujo durante 75 minutos, tiempo en el cual se hubo formado un precipitado cristalino, de color canela, denso. El condensador de reflujo se reemplazó por una cabeza de destilación, y se recogió un destilado incoloro, turbio (300 ml). Un segundo matraz de cuatro cuellos de 1 l equipado con un agitador mecánico se cargó con bicarbonato de sodio (45 g, 0,54 mol) y agua (200 ml). La mezcla de reacción concentrada se añadió a la suspensión de bicarbonato de sodio a lo largo de un periodo de 5 minutos. La mezcla de dos fases resultante se agitó vigorosamente durante 5 minutos, tiempo en el cual hubo cesado el desprendimiento de gas. La mezcla se diluyó con diclorometano (200 ml) y después se agitó durante 75 minutos. La mezcla se trató con 5 g de un filtro auxiliar de tierra de diatomeas de Celite® 545 y después se filtró para retirar una sustancia alquitranada, marrón. El filtrado se transfirió a un embudo separatorio. La capa orgánica marrón (400 ml) se separó y después se trató con sulfato de magnesio (15 g) y carbón vegetal activado Darco® G60 (2,0 g). La suspensión resultante se agitó magnéticamente durante 15 minutos y después se filtró para retirar el sulfato de magnesio y el carbón vegetal. El filtrado verde se trató con gel de sílice (3 g) y se agitó durante varios minutos. El gel de sílice azul-verde oscuro se retiró por filtración, y el filtrado se concentró en un evaporador rotatorio. El producto consistió en un aceite ámbar claro (58,6 g, 95% de rendimiento), que cristalizó tras el reposo. La única impureza apreciable observada por ¹H NMR fue 0,3% de acetonitrilo.

¹H NMR (DMSO-*d*₆) δ 1,15 (t, 3H), 3,29 (dd, 1H), 3,60 (dd, 1H), 4,11 (q, 2H), 5,20 (dd, 1H), 6,99 (dd, 1H), 7,84 (d, 1H), 8,12 (d, 1H).

Etapa C: Preparación de 3-Bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-carboxilato de etilo

Un matraz de cuatro cuellos de 1 l equipado con un agitador mecánico, termómetro, condensador de reflujo y entrada de nitrógeno se cargó con 3-cloro-1-(3-cloro-2-piridinil)-4,5-dihidro-1H-pirazol-5-carboxilato de etilo (es decir, el producto de la Etapa B) (40,2 g, 0,121 mol), acetonitrilo (300 ml) y ácido sulfúrico (98%, 13,0 ml, 0,245 mol). La mezcla se autocalentó de 22 a 36 °C tras añadir el ácido sulfúrico. Después de ser agitada durante varios minutos, la mezcla se trató con persulfato de potasio (48,0 g, 0,178 mol). La suspensión se calentó a reflujo a 84 °C durante 2 horas. La suspensión naranja resultante, mientras estaba aún caliente (50-65 °C) se filtró para retirar un precipitado blanco. La pasta del filtro se lavó con acetonitrilo (2 x 50 ml). El filtrado se concentró hasta aproximadamente 200 ml en un evaporador rotatorio. Un segundo matraz de cuatro cuellos de 1 l equipado con un agitador mecánico se cargó con agua (400 ml). La masa de reacción concentrada se añadió al agua a lo largo de un periodo de aproximadamente 5 minutos. El producto se aisló por medio de filtración, se lavó secuencialmente con acetonitrilo acuoso (20%, 100 ml) y agua (75 ml), y después se secó al aire en el filtro durante 1 hora. El producto consistió en un polvo cristalino naranja (36,6 g, 90% de rendimiento). Las únicas impurezas apreciables observadas por ¹H NMR fueron aproximadamente 1% de una sustancia desconocida y 0,5% de acetonitrilo.

¹H NMR (DMSO-*d*₆) δ 1,09 (t, 3H), 4,16 (c, 2H), 7,35 (s, 1H), 7,72 (dd, 1H), 8,39 (d, 1H), 8,59 (d, 1H).

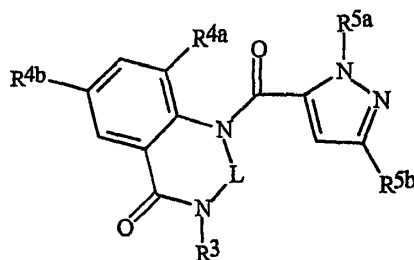
Etapa D: Preparación de ácido 3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-carboxílico

Un matraz de cuatro cuellos de 300 ml equipado con un agitador mecánico, termómetro, condensador de reflujo y entrada de nitrógeno se cargó con 3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-carboxilato de etilo (es decir, el producto de la Etapa C) (98,5% puro, 25,0 g, 0,0756 mol), metanol (75 ml), agua (50 ml), y gránulos de hidróxido de sodio (3,30 g, 0,0825 mol). Tras añadir el hidróxido de sodio la mezcla se autocalentó de 29 a 34 °C, y el material de partida empezó a disolverse. Después de ser agitada durante 90 minutos bajo condiciones ambientales, todo el material de partida se hubo disuelto. La disolución naranja oscura resultante se concentró hasta aproximadamente 90 ml en un evaporador rotatorio. La mezcla de reacción concentrada se diluyó después con agua (160 ml). La disolución acuosa se extrajo con éter (100 ml). Después, la capa acuosa se transfirió a un matraz Erlenmeyer de 500 ml equipado con un agitador magnético. La disolución se trató gota a gota con ácido clorhídrico concentrado (8,50 g, 0,0839 mol) a lo largo de un periodo de aproximadamente 10 minutos. El producto se aisló por medio de filtración, se resuspendió con agua (2 x 40 ml), se lavó tapado una vez con agua (25 ml) y después se secó al aire en el filtro durante 2 horas. El producto consistió en un polvo cristalino de color canela (20,9 g, 91% de rendimiento). Las únicas impurezas apreciables observadas por ¹H NMR fueron aproximadamente 0,8% de una sustancia desconocida y 0,7% de éter.

¹H NMR (DMSO-*d*₆) δ 7,25 (s, 1H), 13,95 (s a, 1H), 8,56 (d, 1H), 8,25 (d, 1H), 7,68 (dd, 1H).

Mediante los procedimientos descritos en este documento, junto con métodos conocidos en la técnica, se pueden preparar los siguientes compuestos de las Tablas 1 a 10. Se usan las siguientes abreviaturas en las Tablas que siguen: *t* es terciario, *s* es secundario, *n* es normal, *i* es iso, *c* es ciclo, Me es metilo, Et es etilo, Pr es propilo, *i*-Pr es isopropilo, Bu es butilo y *t*-Bu es butilo terciario.

Tabla 1



L es C=O

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
H	Me	H	Me	CF ₃	H	Me	H	Me	OCF ₃	H	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Cl	H	Me	CF ₃	H	Cl	H	Me	OCF ₃	H	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Me	Cl	Me	CF ₃	H	Me	Cl	Me	OCF ₃	H	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Cl	Cl	Me	CF ₃	H	Cl	Cl	Me	OCF ₃	H	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂

L es C=O

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
H	Me	Br	Me	CF ₃	H	Me	Br	Me	OCF ₃	H	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Cl	Br	Me	CF ₃	H	Cl	Br	Me	OCF ₃	H	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Me	H	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	H	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Cl	H	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Me	Br	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Me	H	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	H	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Cl	H	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Me	Br	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Me	H	Me	CF ₃	Et	Me	H	Me	OCF ₃	Et	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Cl	H	Me	CF ₃	Et	Cl	H	Me	OCF ₃	Et	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Me	Cl	Me	CF ₃	Et	Me	Cl	Me	OCF ₃	Et	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Cl	Cl	Me	CF ₃	Et	Cl	Cl	Me	OCF ₃	Et	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Me	Br	Me	CF ₃	Et	Me	Br	Me	OCF ₃	Et	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Cl	Br	Me	CF ₃	Et	Cl	Br	Me	OCF ₃	Et	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Me	H	Me	CF ₃	Me	Me	H	Me	OCF ₃	Me	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	Me	OCF ₃	Me	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Me	Cl	Me	CF ₃	Me	Me	Cl	Me	OCF ₃	Me	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Cl	Cl	Me	CF ₃	Me	Cl	Cl	Me	OCF ₃	Me	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Me	Br	Me	CF ₃	Me	Me	Br	Me	OCF ₃	Me	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Cl	Br	Me	CF ₃	Me	Cl	Br	Me	OCF ₃	Me	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂

ES 2 427 141 T3

L es CH ₂														
R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
H	Me	H	Me	CF ₃	H	Me	H	Me	OCF ₃	H	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Cl	H	Me	CF ₃	H	Cl	H	Me	OCF ₃	H	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Me	Cl	Me	CF ₃	H	Me	Cl	Me	OCF ₃	H	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Cl	Cl	Me	CF ₃	H	Cl	Cl	Me	OCF ₃	H	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Me	Br	Me	CF ₃	H	Me	Br	Me	OCF ₃	H	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Cl	Br	Me	CF ₃	H	Cl	Br	Me	OCF ₃	H	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Me	H	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	H	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Cl	H	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Me	Br	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Me	H	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	H	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Cl	H	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Me	Br	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Me	H	Me	CF ₃	Et	Me	H	Me	OCF ₃	Et	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Cl	H	Me	CF ₃	Et	Cl	H	Me	OCF ₃	Et	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Me	Cl	Me	CF ₃	Et	Me	Cl	Me	OCF ₃	Et	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Cl	Cl	Me	CF ₃	Et	Cl	Cl	Me	OCF ₃	Et	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Me	Br	Me	CF ₃	Et	Me	Br	Me	OCF ₃	Et	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Cl	Br	Me	CF ₃	Et	Cl	Br	Me	OCF ₃	Et	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Me	H	Me	CF ₃	Me	Me	H	Me	OCF ₃	Me	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	Me	OCF ₃	Me	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Me	Cl	Me	CF ₃	Me	Me	Cl	Me	OCF ₃	Me	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂

ES 2 427 141 T3

L es CH₂

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
Me	Cl	Cl	Me	CF ₃	Me	Cl	Cl	Me	OCF ₃	Me	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Me	Br	Me	CF ₃	Me	Me	Br	Me	OCF ₃	Me	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Cl	Br	Me	CF ₃	Me	Cl	Br	Me	OCF ₃	Me	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂

L es CH₂CH₂

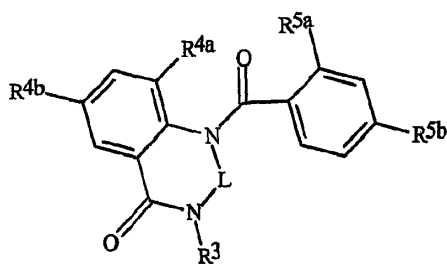
R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
H	Me	H	Me	CF ₃	H	Me	H	Me	OCF ₃	H	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Cl	H	Me	CF ₃	H	Cl	H	Me	OCF ₃	H	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Me	Cl	Me	CF ₃	H	Me	Cl	Me	OCF ₃	H	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Cl	Cl	Me	CF ₃	H	Cl	Cl	Me	OCF ₃	H	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Me	Br	Me	CF ₃	H	Me	Br	Me	OCF ₃	H	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Cl	Br	Me	CF ₃	H	Cl	Br	Me	OCF ₃	H	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Me	H	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	H	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Cl	H	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Me	Br	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Me	H	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	H	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Cl	H	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Me	Br	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Me	H	Me	CF ₃	Et	Me	H	Me	OCF ₃	Et	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Cl	H	Me	CF ₃	Et	Cl	H	Me	OCF ₃	Et	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Me	Cl	Me	CF ₃	Et	Me	Cl	Me	OCF ₃	Et	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂

ES 2 427 141 T3

L es CH₂CH₂

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
Et	Cl	Cl	Me	CF ₃	Et	Cl	Cl	Me	OCF ₃	Et	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Me	Br	Me	CF ₃	Et	Me	Br	Me	OCF ₃	Et	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Cl	Br	Me	CF ₃	Et	Cl	Br	Me	OCF ₃	Et	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Me	H	Me	CF ₃	Me	Me	H	Me	OCF ₃	Me	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	Me	OCF ₃	Me	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Me	Cl	Me	CF ₃	Me	Me	Cl	Me	OCF ₃	Me	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Cl	Cl	Me	CF ₃	Me	Cl	Cl	Me	OCF ₃	Me	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Me	Br	Me	CF ₃	Me	Me	Br	Me	OCF ₃	Me	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Cl	Br	Me	CF ₃	Me	Cl	Br	Me	OCF ₃	Me	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂

Tabla 2



L es C=O

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
H	Me	H	Me	CF ₃	H	Me	H	Me	OCF ₃	H	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Cl	H	Me	CF ₃	H	Cl	H	Me	OCF ₃	H	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Me	Cl	Me	CF ₃	H	Me	Cl	Me	OCF ₃	H	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Cl	Cl	Me	CF ₃	H	Cl	Cl	Me	OCF ₃	H	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Me	Br	Me	CF ₃	H	Me	Br	Me	OCF ₃	H	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Cl	Br	Me	CF ₃	H	Cl	Br	Me	OCF ₃	H	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Me	H	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	H	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Cl	H	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Me	Br	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂

ES 2 427 141 T3

L es C=O

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Me	H	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	H	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Cl	H	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Me	Br	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Me	H	Me	CF ₃	Et	Me	H	Me	OCF ₃	Et	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Cl	H	Me	CF ₃	Et	Cl	H	Me	OCF ₃	Et	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Me	Cl	Me	CF ₃	Et	Me	Cl	Me	OCF ₃	Et	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Cl	Cl	Me	CF ₃	Et	Cl	Cl	Me	OCF ₃	Et	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Me	Br	Me	CF ₃	Et	Me	Br	Me	OCF ₃	Et	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Cl	Br	Me	CF ₃	Et	Cl	Br	Me	OCF ₃	Et	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Me	H	Me	CF ₃	Me	Me	H	Me	OCF ₃	Me	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	Me	OCF ₃	Me	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Me	Cl	Me	CF ₃	Me	Me	Cl	Me	OCF ₃	Me	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Cl	Cl	Me	CF ₃	Me	Cl	Cl	Me	OCF ₃	Me	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Me	Br	Me	CF ₃	Me	Me	Br	Me	OCF ₃	Me	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Cl	Br	Me	CF ₃	Me	Cl	Br	Me	OCF ₃	Me	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂

L es CH₂

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
H	Me	H	Me	CF ₃	H	Me	H	Me	OCF ₃	H	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Cl	H	Me	CF ₃	H	Cl	H	Me	OCF ₃	H	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Me	Cl	Me	CF ₃	H	Me	Cl	Me	OCF ₃	H	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Cl	Cl	Me	CF ₃	H	Cl	Cl	Me	OCF ₃	H	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Me	Br	Me	CF ₃	H	Me	Br	Me	OCF ₃	H	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂

ES 2 427 141 T3

L es CH ₂														
R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
H	Cl	Br	Me	CF ₃	H	Cl	Br	Me	OCF ₃	H	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Me	H	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	H	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Cl	H	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Me	Br	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Me	H	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	H	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Cl	H	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Me	Br	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Me	H	Me	CF ₃	Et	Me	H	Me	OCF ₃	Et	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Cl	H	Me	CF ₃	Et	Cl	H	Me	OCF ₃	Et	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Me	Cl	Me	CF ₃	Et	Me	Cl	Me	OCF ₃	Et	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Cl	Cl	Me	CF ₃	Et	Cl	Cl	Me	OCF ₃	Et	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Me	Br	Me	CF ₃	Et	Me	Br	Me	OCF ₃	Et	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Cl	Br	Me	CF ₃	Et	Cl	Br	Me	OCF ₃	Et	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Me	H	Me	CF ₃	Me	Me	H	Me	OCF ₃	Me	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	Me	OCF ₃	Me	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Me	Cl	Me	CF ₃	Me	Me	Cl	Me	OCF ₃	Me	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Cl	Cl	Me	CF ₃	Me	Cl	Cl	Me	OCF ₃	Me	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Me	Br	Me	CF ₃	Me	Me	Br	Me	OCF ₃	Me	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Cl	Br	Me	CF ₃	Me	Cl	Br	Me	OCF ₃	Me	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂

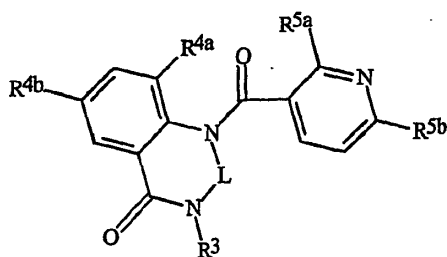
ES 2 427 141 T3

L es CH ₂ CH ₂														
R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
H	Me	H	Me	CF ₃	H	Me	H	Me	OCF ₃	H	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Cl	H	Me	CF ₃	H	Cl	H	Me	OCF ₃	H	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Me	Cl	Me	CF ₃	H	Me	Cl	Me	OCF ₃	H	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Cl	Cl	Me	CF ₃	H	Cl	Cl	Me	OCF ₃	H	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Me	Br	Me	CF ₃	H	Me	Br	Me	OCF ₃	H	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Cl	Br	Me	CF ₃	H	Cl	Br	Me	OCF ₃	H	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Me	H	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	H	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Cl	H	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Me	Br	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Me	H	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	H	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Cl	H	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Me	Br	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Me	H	Me	CF ₃	Et	Me	H	Me	OCF ₃	Et	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Cl	H	Me	CF ₃	Et	Cl	H	Me	OCF ₃	Et	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Me	Cl	Me	CF ₃	Et	Me	Cl	Me	OCF ₃	Et	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Cl	Cl	Me	CF ₃	Et	Cl	Cl	Me	OCF ₃	Et	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Me	Br	Me	CF ₃	Et	Me	Br	Me	OCF ₃	Et	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Cl	Br	Me	CF ₃	Et	Cl	Br	Me	OCF ₃	Et	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Me	H	Me	CF ₃	Me	Me	H	Me	OCF ₃	Me	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	Me	OCF ₃	Me	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂

L es CH₂CH₂

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
Me	Me	Cl	Me	CF ₃	Me	Me	Cl	Me	OCF ₃	Me	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Cl	Cl	Me	CF ₃	Me	Cl	Cl	Me	OCF ₃	Me	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Me	Br	Me	CF ₃	Me	Me	Br	Me	OCF ₃	Me	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Cl	Br	Me	CF ₃	Me	Cl	Br	Me	OCF ₃	Me	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂

Tabla 3



L es C=O

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
H	Me	H	Me	CF ₃	H	Me	H	Me	OCF ₃	H	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Cl	H	Me	CF ₃	H	Cl	H	Me	OCF ₃	H	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Me	Cl	Me	CF ₃	H	Me	Cl	Me	OCF ₃	H	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Cl	Cl	Me	CF ₃	H	Cl	Cl	Me	OCF ₃	H	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Me	Br	Me	CF ₃	H	Me	Br	Me	OCF ₃	H	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Cl	Br	Me	CF ₃	H	Cl	Br	Me	OCF ₃	H	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Me	H	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	H	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Cl	H	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Me	Br	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Me	H	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	H	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Cl	H		CF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂

ES 2 427 141 T3

L es C=O

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Me	Br	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Me	H	Me	CF ₃	Et	Me	H	Me	OCF ₃	Et	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Cl	H	Me	CF ₃	Et	Cl	H	Me	OCF ₃	Et	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Me	Cl	Me	CF ₃	Et	Me	Cl	Me	OCF ₃	Et	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Cl	Cl	Me	CF ₃	Et	Cl	Cl	Me	OCF ₃	Et	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Me	Br	Me	CF ₃	Et	Me	Br	Me	OCF ₃	Et	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Cl	Br	Me	CF ₃	Et	Cl	Br	Me	OCF ₃	Et	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Me	H	Me	CF ₃	Me	Me	H	Me	OCF ₃	Me	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	Me	OCF ₃	Me	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Me	Cl	Me	CF ₃	Me	Me	Cl	Me	OCF ₃	Me	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Cl	Cl	Me	CF ₃	Me	Cl	Cl	Me	OCF ₃	Me	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Me	Br	Me	CF ₃	Me	Me	Br	Me	OCF ₃	Me	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Cl	Br	Me	CF ₃	Me	Cl	Br	Me	OCF ₃	Me	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂

L es CH₂

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
H	Me	H	Me	CF ₃	H	Me	H	Me	OCF ₃	H	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Cl	H	Me	CF ₃	H	Cl	H	Me	OCF ₃	H	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Me	Cl	Me	CF ₃	H	Me	Cl	Me	OCF ₃	H	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Cl	Cl	Me	CF ₃	H	Cl	Cl	Me	OCF ₃	H	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Me	Br	Me	CF ₃	H	Me	Br	Me	OCF ₃	H	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Cl	Br	Me	CF ₃	H	Cl	Br	Me	OCF ₃	H	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Me	H	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	H	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Cl	H	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂

ES 2 427 141 T3

L es CH₂

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Me	Br	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Me	H	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	H	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Cl	H	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Me	Br	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Me	H	Me	CF ₃	Et	Me	H	Me	OCF ₃	Et	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Cl	H	Me	CF ₃	Et	Cl	H	Me	OCF ₃	Et	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Me	Cl	Me	CF ₃	Et	Me	Cl	Me	OCF ₃	Et	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Cl	Cl	Me	CF ₃	Et	Cl	Cl	Me	OCF ₃	Et	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Me	Br	Me	CF ₃	Et	Me	Br	Me	OCF ₃	Et	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Cl	Br	Me	CF ₃	Et	Cl	Br	Me	OCF ₃	Et	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Me	H	Me	CF ₃	Me	Me	H	Me	OCF ₃	Me	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	Me	OCF ₃	Me	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Me	Cl	Me	CF ₃	Me	Me	Cl	Me	OCF ₃	Me	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Cl	Cl	Me	CF ₃	Me	Cl	Cl	Me	OCF ₃	Me	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Me	Br	Me	CF ₃	Me	Me	Br	Me	OCF ₃	Me	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Cl	Br	Me	CF ₃	Me	Cl	Br	Me	OCF ₃	Me	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂

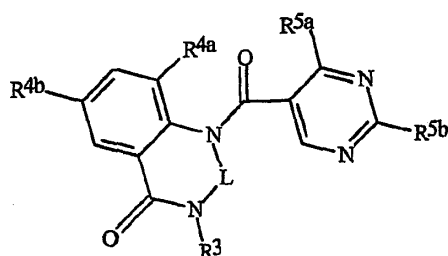
L es CH₂CH₂

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
H	Me	H	Me	CF ₃	H	Me	H	Me	OCF ₃	H	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Cl	H	Me	CF ₃	H	Cl	H	Me	OCF ₃	H	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Me	Cl	Me	CF ₃	H	Me	Cl	Me	OCF ₃	H	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂

ES 2 427 141 T3

L es CH ₂ CH ₂														
R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
H	Cl	Cl	Me	CF ₃	H	Cl	Cl	Me	OCF ₃	H	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Me	Br	Me	CF ₃	H	Me	Br	Me	OCF ₃	H	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Cl	Br	Me	CF ₃	H	Cl	Br	Me	OCF ₃	H	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Me	H	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	H	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Cl	H	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Me	Br	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Me	H	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	H	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Cl	H	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Me	Br	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Me	H	Me	CF ₃	Et	Me	H	Me	OCF ₃	Et	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Cl	H	Me	CF ₃	Et	Cl	H	Me	OCF ₃	Et	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Me	Cl	Me	CF ₃	Et	Me	Cl	Me	OCF ₃	Et	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Cl	Cl	Me	CF ₃	Et	Cl	Cl	Me	OCF ₃	Et	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Me	Br	Me	CF ₃	Et	Me	Br	Me	OCF ₃	Et	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Cl	Br	Me	CF ₃	Et	Cl	Br	Me	OCF ₃	Et	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Me	H	Me	CF ₃	Me	Me	H	Me	OCF ₃	Me	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	Me	OCF ₃	Me	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Me	Cl	Me	CF ₃	Me	Me	Cl	Me	OCF ₃	Me	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Cl	Cl	Me	CF ₃	Me	Cl	Cl	Me	OCF ₃	Me	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Me	Br	Me	CF ₃	Me	Me	Br	Me	OCF ₃	Me	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Cl	Br	Me	CF ₃	Me	Cl	Br	Me	OCF ₃	Me	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂

Tabla 4



L es C=O

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
H	Me	H	Me	CF ₃	H	Me	H	Me	OCF ₃	H	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Cl	H	Me	CF ₃	H	Cl	H	Me	OCF ₃	H	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Me	Cl	Me	CF ₃	H	Me	Cl	Me	OCF ₃	H	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Cl	Cl	Me	CF ₃	H	Cl	Cl	Me	OCF ₃	H	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Me	Br	Me	CF ₃	H	Me	Br	Me	OCF ₃	H	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Cl	Br	Me	CF ₃	H	Cl	Br	Me	OCF ₃	H	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Me	H	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	H	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Cl	H	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Me	Br	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Me	H	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	H	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Cl	H	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Me	Br	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Me	H	Me	CF ₃	Et	Me	H	Me	OCF ₃	Et	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Cl	H	Me	CF ₃	Et	Cl	H	Me	OCF ₃	Et	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Me	Cl	Me	CF ₃	Et	Me	Cl	Me	OCF ₃	Et	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂

ES 2 427 141 T3

L es C=O

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
Et	Cl	Cl	Me	CF ₃	Et	Cl	Cl	Me	OCF ₃	Et	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Me	Br	Me	CF ₃	Et	Me	Br	Me	OCF ₃	Et	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Cl	Br	Me	CF ₃	Et	Cl	Br	Me	OCF ₃	Et	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Me	H	Me	CF ₃	Me	Me	H	Me	OCF ₃	Me	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	Me	OCF ₃	Me	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Me	Cl	Me	CF ₃	Me	Me	Cl	Me	OCF ₃	Me	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Cl	Cl	Me	CF ₃	Me	Cl	Cl	Me	OCF ₃	Me	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Me	Br	Me	CF ₃	Me	Me	Br	Me	OCF ₃	Me	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Cl	Br	Me	CF ₃	Me	Cl	Br	Me	OCF ₃	Me	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂

L es CH₂

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
H	Me	H	Me	CF ₃	H	Me	H	Me	OCF ₃	H	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Cl	H	Me	CF ₃	H	Cl	H	Me	OCF ₃	H	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Me	Cl	Me	CF ₃	H	Me	Cl	Me	OCF ₃	H	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Cl	Cl	Me	CF ₃	H	Cl	Cl	Me	OCF ₃	H	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Me	Br	Me	CF ₃	H	Me	Br	Me	OCF ₃	H	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Cl	Br	Me	CF ₃	H	Cl	Br	Me	OCF ₃	H	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Me	H	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	H	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Cl	H	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Me	Br	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Me	H	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	H	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Cl	H	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂

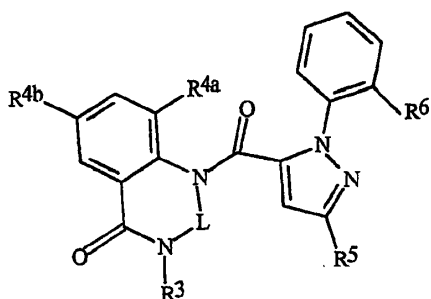
ES 2 427 141 T3

L es CH ₂														
R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Me	Br	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Me	H	Me	CF ₃	Et	Me	H	Me	OCF ₃	Et	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Cl	H	Me	CF ₃	Et	Cl	H	Me	OCF ₃	Et	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Me	Cl	Me	CF ₃	Et	Me	Cl	Me	OCF ₃	Et	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Cl	Cl	Me	CF ₃	Et	Cl	Cl	Me	OCF ₃	Et	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Me	Br	Me	CF ₃	Et	Me	Br	Me	OCF ₃	Et	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Cl	Br	Me	CF ₃	Et	Cl	Br	Me	OCF ₃	Et	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Me	H	Me	CF ₃	Me	Me	H	Me	OCF ₃	Me	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	Me	OCF ₃	Me	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Me	Cl	Me	CF ₃	Me	Me	Cl	Me	OCF ₃	Me	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Cl	Cl	Me	CF ₃	Me	Cl	Cl	Me	OCF ₃	Me	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Me	Br	Me	CF ₃	Me	Me	Br	Me	OCF ₃	Me	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Cl	Br	Me	CF ₃	Me	Cl	Br	Me	OCF ₃	Me	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂

L es CH ₂ CH ₂														
R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
H	Me	H	Me	CF ₃	H	Me	H	Me	OCF ₃	H	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Cl	H	Me	CF ₃	H	Cl	H	Me	OCF ₃	H	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Me	Cl	Me	CF ₃	H	Me	Cl	Me	OCF ₃	H	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Cl	Cl	Me	CF ₃	H	Cl	Cl	Me	OCF ₃	H	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
H	Me	Br	Me	CF ₃	H	Me	Br	Me	OCF ₃	H	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
CH	Cl	Br	Me	CF ₃	H	Cl	Br	Me	OCF ₃	H	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Me	H	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	H	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Cl	H	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂

L es CH ₂ CH ₂														
R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ^{5a}	R ^{5b}
<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Me	Br	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Me	CF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Me	OCF ₃	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Me	H	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	H	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Cl	H	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Me	Br	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Me	CF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Me	OCF ₃	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Me	H	Me	CF ₃	Et	Me	H	Me	OCF ₃	Et	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Cl	H	Me	CF ₃	Et	Cl	H	Me	OCF ₃	Et	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Me	Cl	Me	CF ₃	Et	Me	Cl	Me	OCF ₃	Et	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Cl	Cl	Me	CF ₃	Et	Cl	Cl	Me	OCF ₃	Et	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Me	Br	Me	CF ₃	Et	Me	Br	Me	OCF ₃	Et	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Et	Cl	Br	Me	CF ₃	Et	Cl	Br	Me	OCF ₃	Et	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Me	H	Me	CF ₃	Me	Me	H	Me	OCF ₃	Me	Me	H	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Cl	H	Me	CF ₃	Me	Cl	H	Me	OCF ₃	Me	Cl	H	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Me	Cl	Me	CF ₃	Me	Me	Cl	Me	OCF ₃	Me	Me	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Cl	Cl	Me	CF ₃	Me	Cl	Cl	Me	OCF ₃	Me	Cl	Cl	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Me	Br	Me	CF ₃	Me	Me	Br	Me	OCF ₃	Me	Me	Br	Me	CF(CF ₃) ₂
Me	Cl	Br	Me	CF ₃	Me	Cl	Br	Me	OCF ₃	Me	Cl	Br	Me	CF(CF ₃) ₂

Tabla 5



ES 2 427 141 T3

L es C=O

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶
H	Me	H	CF ₃	Cl	H	Me	H	Cl	Cl	H	Me	H	Br	Cl
H	Cl	H	CF ₃	Cl	H	Cl	H	Cl	Cl	H	Cl	H	Br	Cl
H	Me	Cl	CF ₃	Cl	H	Me	Cl	Cl	Cl	H	Me	Cl	Br	Cl
H	Cl	Cl	CF ₃	Cl	H	Cl	Cl	Cl	Cl	H	Cl	Cl	Br	Cl
H	Me	Br	CF ₃	Cl	H	Me	Br	Cl	Cl	H	Me	Br	Br	Cl
H	Cl	Br	CF ₃	Cl	H	Cl	Br	Cl	Cl	H	Cl	Br	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	H	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	H	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	H	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	H	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	Cl	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	Br	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	Br	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	H	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	H	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	H	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	H	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	Cl	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	Br	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	Br	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Br	Cl
Et	Me	H	CF ₃	Cl	Et	Me	H	Cl	Cl	Et	Me	H	Br	Cl
Et	Cl	H	CF ₃	Cl	Et	Cl	H	Cl	Cl	Et	Cl	H	Br	Cl
Et	Me	Cl	CF ₃	Cl	Et	Me	Cl	Cl	Cl	Et	Me	Cl	Br	Cl
Et	Cl	Cl	CF ₃	Cl	Et	Cl	Cl	Cl	Cl	Et	Cl	Cl	Br	Cl
Et	Me	Br	CF ₃	Cl	Et	Me	Br	Cl	Cl	Et	Me	Br	Br	Cl
Et	Cl	Br	CF ₃	Cl	Et	Cl	Br	Cl	Cl	Et	Cl	Br	Br	Cl
Me	Me	H	CF ₃	Cl	Me	Me	H	Cl	Cl	Me	Me	H	Br	Cl
Me	Cl	H	CF ₃	Cl	Me	Cl	H	Cl	Cl	Me	Cl	H	Br	Cl
Me	Me	Cl	CF ₃	Cl	Me	Me	Cl	Cl	Cl	Me	Me	Cl	Br	Cl

ES 2 427 141 T3

L es C=O

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶
Me	Cl	Cl	CF ₃	Cl	Me	Cl	Cl	Cl	Cl	Me	Cl	Cl	Br	Cl
Me	Me	Br	CF ₃	Cl	Me	Me	Br	Cl	Cl	Me	Me	Br	Br	Cl
Me	Cl	Br	CF ₃	Cl	Me	Cl	Br	Cl	Cl	Me	Cl	Br	Br	Cl

L es CH₂

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶
H	Me	H	CF ₃	Cl	H	Me	H	Cl	Cl	H	Me	H	Br	Cl
H	Cl	H	CF ₃	Cl	H	Cl	H	Cl	Cl	H	Cl	H	Br	Cl
H	Me	Cl	CF ₃	Cl	H	Me	Cl	Cl	Cl	H	Me	Cl	Br	Cl
H	Cl	Cl	CF ₃	Cl	H	Cl	Cl	Cl	Cl	H	Cl	Cl	Br	Cl
H	Me	Br	CF ₃	Cl	H	Me	Br	Cl	Cl	H	Me	Br	Br	Cl
H	Cl	Br	CF ₃	Cl	H	Cl	Br	Cl	Cl	H	Cl	Br	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	H	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	H	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	H	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	H	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	Cl	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	Br	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	Br	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	H	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	H	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	H	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	H	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	Cl	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	Br	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	Br	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Br	Cl
Et	Me	H	CF ₃	Cl	Et	Me	H	Cl	Cl	Et	Me	H	Br	Cl
Et	Cl	H	CF ₃	Cl	Et	Cl	H	Cl	Cl	Et	Cl	H	Br	Cl
Et	Me	Cl	CF ₃	Cl	Et	Me	Cl	Cl	Cl	Et	Me	Cl	Br	Cl

ES 2 427 141 T3

L es CH₂

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶
Et	Cl	Cl	CF ₃	Cl	Et	Cl	Cl	Cl	Cl	Et	Cl	Cl	Br	Cl
Et	Me	Br	CF ₃	Cl	Et	Me	Br	Cl	Cl	Et	Me	Br	Br	Cl
Et	Cl	Br	CF ₃	Cl	Et	Cl	Br	Cl	Cl	Et	Cl	Br	Br	Cl
Me	Me	H	CF ₃	Cl	Me	Me	H	Cl	Cl	Me	Me	H	Br	Cl
Me	Cl	H	CF ₃	Cl	Me	Cl	H	Cl	Cl	Me	Cl	H	Br	Cl
Me	Me	Cl	CF ₃	Cl	Me	Me	Cl	Cl	Cl	Me	Me	Cl	Br	Cl
Me	Cl	Cl	CF ₃	Cl	Me	Cl	Cl	Cl	Cl	Me	Cl	Cl	Br	Cl
Me	Me	Br	CF ₃	Cl	Me	Me	Br	Cl	Cl	Me	Me	Br	Br	Cl
Me	Cl	Br	CF ₃	Cl	Me	Cl	Br	Cl	Cl	Me	Cl	Br	Br	Cl

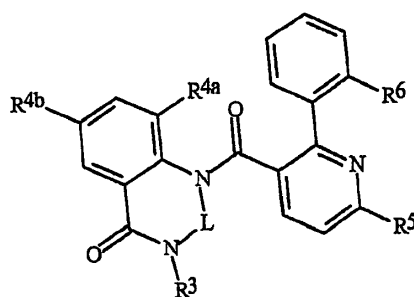
L es CH₂CH₂

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶
H	Me	H	CF ₃	Cl	H	Me	H	Cl	Cl	H	Me	H	Br	Cl
H	Cl	H	CF ₃	Cl	H	Cl	H	Cl	Cl	H	Cl	H	Br	Cl
H	Me	Cl	CF ₃	Cl	H	Me	Cl	Cl	Cl	H	Me	Cl	Br	Cl
H	Cl	Cl	CF ₃	Cl	H	Cl	Cl	Cl	Cl	H	Cl	Cl	Br	Cl
H	Me	Br	CF ₃	Cl	H	Me	Br	Cl	Cl	H	Me	Br	Br	Cl
H	Cl	Br	CF ₃	Cl	H	Cl	Br	Cl	Cl	H	Cl	Br	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	H	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	H	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	H	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	H	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	Cl	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	Br	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	Br	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	H	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	H	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	H	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	H	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	Cl	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Br	Cl

L es CH₂CH₂

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶
<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	Br	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	Br	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Br	Cl
Et	Me	H	CF ₃	Cl	Et	Me	H	Cl	Cl	Et	Me	H	Br	Cl
Et	Cl	H	CF ₃	Cl	Et	Cl	H	Cl	Cl	Et	Cl	H	Br	Cl
Et	Me	Cl	CF ₃	Cl	Et	Me	Cl	Cl	Cl	Et	Me	Cl	Br	Cl
Et	Cl	Cl	CF ₃	Cl	Et	Cl	Cl	Cl	Cl	Et	Cl	Cl	Br	Cl
Et	Me	Br	CF ₃	Cl	Et	Me	Br	Cl	Cl	Et	Me	Br	Br	Cl
Et	Cl	Br	CF ₃	Cl	Et	Cl	Br	Cl	Cl	Et	Cl	Br	Br	Cl
Me	Me	H	CF ₃	Cl	Me	Me	H	Cl	Cl	Me	Me	H	Br	Cl
Me	Cl	H	CF ₃	Cl	Me	Cl	H	Cl	Cl	Me	Cl	H	Br	Cl
Me	Me	Cl	CF ₃	Cl	Me	Me	Cl	Cl	Cl	Me	Me	Cl	Br	Cl
Me	Cl	Cl	CF ₃	Cl	Me	Cl	Cl	Cl	Cl	Me	Cl	Cl	Br	Cl
Me	Me	Br	CF ₃	Cl	Me	Me	Br	Cl	Cl	Me	Me	Br	Br	Cl
Me	Cl	Br	CF ₃	Cl	Me	Cl	Br	Cl	Cl	Me	Cl	Br	Br	Cl

Tabla 6



L es C=O

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶
H	Me	H	CF ₃	Cl	H	Me	H	Cl	Cl	H	Me	H	Br	Cl
H	Cl	H	CF ₃	Cl	H	Cl	H	Cl	Cl	H	Cl	H	Br	Cl
H	Me	Cl	CF ₃	Cl	H	Me	Cl	Cl	Cl	H	Me	Cl	Br	Cl

ES 2 427 141 T3

L es C=O														
R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶
H	Cl	Cl	CF ₃	Cl	H	Cl	Cl	Cl	Cl	H	Cl	Cl	Br	Cl
H	Me	Br	CF ₃	Cl	H	Me	Br	Cl	Cl	H	Me	Br	Br	Cl
H	Cl	Br	CF ₃	Cl	H	Cl	Br	Cl	Cl	H	Cl	Br	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	H	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	H	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	H	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	H	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	Cl	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	Br	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	Br	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	H	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	H	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	H	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	H	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	Cl	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	Br	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	Br	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Br	Cl
Et	Me	H	CF ₃	Cl	Et	Me	H	Cl	Cl	Et	Me	H	Br	Cl
Et	Cl	H	CF ₃	Cl	Et	Cl	H	Cl	Cl	Et	Cl	H	Br	Cl
Et	Me	Cl	CF ₃	Cl	Et	Me	Cl	Cl	Cl	Et	Me	Cl	Br	Cl
Et	Cl	Cl	CF ₃	Cl	Et	Cl	Cl	Cl	Cl	Et	Cl	Cl	Br	Cl
Et	Me	Br	CF ₃	Cl	Et	Me	Br	Cl	Cl	Et	Me	Br	Br	Cl
Et	Cl	Br	CF ₃	Cl	Et	Cl	Br	Cl	Cl	Et	Cl	Br	Br	Cl
Me	Me	H	CF ₃	Cl	Me	Me	H	Cl	Cl	Me	Me	H	Br	Cl
Me	Cl	H	CF ₃	Cl	Me	Cl	H	Cl	Cl	Me	Cl	H	Br	Cl
Me	Me	Cl	CF ₃	Cl	Me	Me	Cl	Cl	Cl	Me	Me	Cl	Br	Cl
Me	Cl	Cl	CF ₃	Cl	Me	Cl	Cl	Cl	Cl	Me	Cl	Cl	Br	Cl
Me	Me	Br	CF ₃	Cl	Me	Me	Br	Cl	Cl	Me	Me	Br	Br	Cl
Me	Cl	Br	CF ₃	Cl	Me	Cl	Br	Cl	Cl	Me	Cl	Br	Br	Cl

L es CH ₂														
R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶
H	Me	H	CF ₃	Cl	H	Me	H	Cl	Cl	H	Me	H	Br	Cl
H	Cl	H	CF ₃	Cl	H	Cl	H	Cl	Cl	H	Cl	H	Br	Cl
H	Me	Cl	CF ₃	Cl	H	Me	Cl	Cl	Cl	H	Me	Cl	Br	Cl
H	Cl	Cl	CF ₃	Cl	H	Cl	Cl	Cl	Cl	H	Cl	Cl	Br	Cl
H	Me	Br	CF ₃	Cl	H	Me	Br	Cl	Cl	H	Me	Br	Br	Cl
H	Cl	Br	CF ₃	Cl	H	Cl	Br	Cl	Cl	H	Cl	Br	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	H	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	H	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	H	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	H	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	Cl	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	Br	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	Br	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	H	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	H	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	H	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	H	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	Cl	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	Br	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	Br	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Br	Cl
Et	Me	H	CF ₃	Cl	Et	Me	H	Cl	Cl	Et	Me	H	Br	Cl
Et	Cl	H	CF ₃	Cl	Et	Cl	H	Cl	Cl	Et	Cl	H	Br	Cl
Et	Me	Cl	CF ₃	Cl	Et	Me	Cl	Cl	Cl	Et	Me	Cl	Br	Cl
Et	Cl	Cl	CF ₃	Cl	Et	Cl	Cl	Cl	Cl	Et	Cl	Cl	Br	Cl
Et	Me	Br	CF ₃	Cl	Et	Me	Br	Cl	Cl	Et	Me	Br	Br	Cl
Et	Cl	Br	CF ₃	Cl	Et	Cl	Br	Cl	Cl	Et	Cl	Br	Br	Cl
Me	Me	H	CF ₃	Cl	Me	Me	H	Cl	Cl	Me	Me	H	Br	Cl
Me	Cl	H	CF ₃	Cl	Me	Cl	H	Cl	Cl	Me	Cl	H	Br	Cl

ES 2 427 141 T3

L es CH₂

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶
Me	Me	Cl	CF ₃	Cl	Me	Me	Cl	Cl	Cl	Me	Me	Cl	Br	Cl
Me	Cl	Cl	CF ₃	Cl	Me	Cl	Cl	Cl	Cl	Me	Cl	Cl	Br	Cl
Me	Me	Br	CF ₃	Cl	Me	Me	Br	Cl	Cl	Me	Me	Br	Br	Cl
Me	Cl	Br	CF ₃	Cl	Me	Cl	Br	Cl	Cl	Me	Cl	Br	Br	Cl

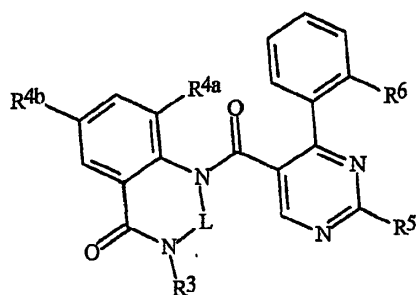
L es CH₂CH₂

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶
H	Me	H	CF ₃	Cl	H	Me	H	Cl	Cl	H	Me	H	Br	Cl
H	Cl	H	CF ₃	Cl	H	Cl	H	Cl	Cl	H	Cl	H	Br	Cl
H	Me	Cl	CF ₃	Cl	H	Me	Cl	Cl	Cl	H	Me	Cl	Br	Cl
H	Cl	Cl	CF ₃	Cl	H	Cl	Cl	Cl	Cl	H	Cl	Cl	Br	Cl
H	Me	Br	CF ₃	Cl	H	Me	Br	Cl	Cl	H	Me	Br	Br	Cl
H	Cl	Br	CF ₃	Cl	H	Cl	Br	Cl	Cl	H	Cl	Br	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	H	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	H	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	H	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	H	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	Cl	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	Br	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	Br	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	H	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	H	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	H	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	H	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	Cl	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	Br	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	Br	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Br	Cl
Et	Me	H	CF ₃	Cl	Et	Me	H	Cl	Cl	Et	Me	H	Br	Cl
Et	Cl	H	CF ₃	Cl	Et	Cl	H	Cl	Cl	Et	Cl	H	Br	Cl

L es CH₂CH₂

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶
Et	Me	Cl	CF ₃	Cl	Et	Me	Cl	Cl	Cl	Et	Me	Cl	Br	Cl
Et	Cl	Cl	CF ₃	Cl	Et	Cl	Cl	Cl	Cl	Et	Cl	Cl	Br	Cl
Et	Me	Br	CF ₃	Cl	Et	Me	Br	Cl	Cl	Et	Me	Br	Br	Cl
Et	Cl	Br	CF ₃	Cl	Et	Cl	Br	Cl	Cl	Et	Cl	Br	Br	Cl
Me	Me	H	CF ₃	Cl	Me	Me	H	Cl	Cl	Me	Me	H	Br	Cl
Me	Cl	H	CF ₃	Cl	Me	Cl	H	Cl	Cl	Me	Cl	H	Br	Cl
Me	Me	Cl	CF ₃	Cl	Me	Me	Cl	Cl	Cl	Me	Me	Cl	Br	Cl
Me	Cl	Cl	CF ₃	Cl	Me	Cl	Cl	Cl	Cl	Me	Cl	Cl	Br	Cl
Me	Me	Br	CF ₃	Cl	Me	Me	Br	Cl	Cl	Me	Me	Br	Br	Cl
Me	Cl	Br	CF ₃	Cl	Me	Cl	Br	Cl	Cl	Nix	Cl	Br	Br	Cl

Tabla 7



L es C=O

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶
H	Me	H	CF ₃	Cl	H	Me	H	Cl	Cl	H	Me	H	Br	Cl
H	Cl	H	CF ₃	Cl	H	Cl	H	Cl	Cl	H	Cl	H	Br	Cl
H	Me	Cl	CF ₃	Cl	H	Me	Cl	Cl	Cl	H	Me	Cl	Br	Cl
H	Cl	Cl	CF ₃	Cl	H	Cl	Cl	Cl	Cl	H	Cl	Cl	Br	Cl
H	Me	Br	CF ₃	Cl	H	Me	Br	Cl	Cl	H	Me	Br	Br	Cl
H	Cl	Br	CF ₃	Cl	H	Cl	Br	Cl	Cl	H	Cl	Br	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	H	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	H	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	H	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	H	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Br	Cl

ES 2 427 141 T3

L es C=O

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶
<i>i</i> -Pr	Me	Cl	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	Br	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	Br	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	H	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	H	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	H	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	H	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	Cl	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	Br	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	Br	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Br	Cl
Et	Me	H	CF ₃	Cl	Et	Me	H	Cl	Cl	Et	Me	H	Br	Cl
Et	Cl	H	CF ₃	Cl	Et	Cl	H	Cl	Cl	Et	Cl	H	Br	Cl
Et	Me	Cl	CF ₃	Cl	Et	Me	Cl	Cl	Cl	Et	Me	Cl	Br	Cl
Et	Cl	Cl	CF ₃	Cl	Et	Cl	Cl	Cl	Cl	Et	Cl	Cl	Br	Cl
Et	Me	Br	CF ₃	Cl	Et	Me	Br	Cl	Cl	Et	Me	Br	Br	Cl
Et	Cl	Br	CF ₃	Cl	Et	Cl	Br	Cl	Cl	Et	Cl	Br	Br	Cl
Me	Me	H	CF ₃	Cl	Me	Me	H	Cl	Cl	Me	Me	H	Br	Cl
Me	Cl	H	CF ₃	Cl	Me	Cl	H	Cl	Cl	Me	Cl	H	Br	Cl
Me	Me	Cl	CF ₃	Cl	Me	Me	Cl	Cl	Cl	Me	Me	Cl	Br	Cl
Me	Cl	Cl	CF ₃	Cl	Me	Cl	Cl	Cl	Cl	Me	Cl	Cl	Br	Cl
Me	Me	Br	CF ₃	Cl	Me	Me	Br	Cl	Cl	Me	Me	Br	Br	Cl
Me	Cl	Br	CF ₃	Cl	Me	Cl	Br	Cl	Cl	Me	Cl	Br	Br	Cl

L es CH₂

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶
H	Me	H	CF ₃	Cl	H	Me	H	Cl	Cl	H	Me	H	Br	Cl
H	Cl	H	CF ₃	Cl	H	Cl	H	Cl	Cl	H	Cl	H	Br	Cl

ES 2 427 141 T3

L es CH ₂														
R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶
H	Me	Cl	CF ₃	Cl	H	Me	Cl	Cl	Cl	H	Me	Cl	Br	Cl
H	Cl	Cl	CF ₃	Cl	H	Cl	Cl	Cl	Cl	H	Cl	Cl	Br	Cl
H	Me	Br	CF ₃	Cl	H	Me	Br	Cl	Cl	H	Me	Br	Br	Cl
H	Cl	Br	CF ₃	Cl	H	Cl	Br	Cl	Cl	H	Cl	Br	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	H	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	H	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	H	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	H	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	Cl	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	Br	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	Br	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	H	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	H	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	H	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	H	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	Cl	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	Br	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	Br	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Br	Cl
Et	Me	H	CF ₃	Cl	Et	Me	H	Cl	Cl	Et	Me	H	Br	Cl
Et	Cl	H	CF ₃	Cl	Et	Cl	H	Cl	Cl	Et	Cl	H	Br	Cl
Et	Me	Cl	CF ₃	Cl	Et	Me	Cl	Cl	Cl	Et	Me	Cl	Br	Cl
Et	Cl	Cl	CF ₃	Cl	Et	Cl	Cl	Cl	Cl	Et	Cl	Cl	Br	Cl
Et	Me	Br	CF ₃	Cl	Et	Me	Br	Cl	Cl	Et	Me	Br	Br	Cl
Et	Cl	Br	CF ₃	Cl	Et	Cl	Br	Cl	Cl	Et	Cl	Br	Br	Cl
Me	Me	H	CF ₃	Cl	Me	Me	H	Cl	Cl	Me	Me	H	Br	Cl
Me	Cl	H	CF ₃	Cl	Me	Cl	H	Cl	Cl	Me	Cl	H	Br	Cl
Me	Me	Cl	CF ₃	Cl	Me	Me	Cl	Cl	Cl	Me	Me	Cl	Br	Cl
Me	Cl	Cl	CF ₃	Cl	Me	Cl	Cl	Cl	Cl	Me	Cl	Cl	Br	Cl
Me	Me	Br	CF ₃	Cl	Me	Me	Br	Cl	Cl	Me	Me	Br	Br	Cl

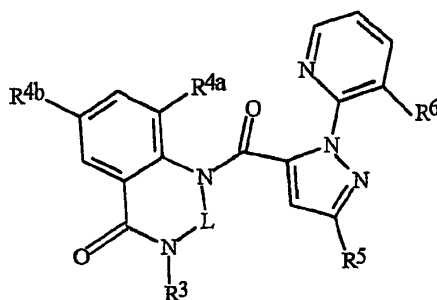
ES 2 427 141 T3

L es CH ₂														
R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶
Me	Cl	Br	CF ₃	Cl	Me	Cl	Br	Cl	Cl	Me	Cl	Br	Br	Cl
L es CH ₂ CH ₂														
R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶
. H	Me	H	CF ₃	Cl	H	Me	H	Cl	Cl	H	Me	H	Br	Cl
H	Cl	H	CF ₃	Cl	H	Cl	H	Cl	Cl	H	Cl	H	Br	Cl
H	Me	Cl	CF ₃	Cl	H	Me	Cl	Cl	Cl	H	Me	Cl	Br	Cl
H	Cl	Cl	CF ₃	Cl	H	Cl	Cl	Cl	Cl	H	Cl	Cl	Br	Cl
H	Me	Br	CF ₃	Cl	H	Me	Br	Cl	Cl	H	Me	Br	Br	Cl
H	Cl	Br	CF ₃	Cl	H	Cl	Br	Cl	Cl	H	Cl	Br	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	H	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	H	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	H	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	H	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	Cl	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	Br	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	Br	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	H	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	H	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	H	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	H	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	Cl	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	Br	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	Br	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Br	Cl
Et	Me	H	CF ₃	Cl	Et	Me	H	Cl	Cl	Et	Me	H	Br	Cl
Et	Cl	H	CF ₃	Cl	Et	Cl	H	Cl	Cl	Et	Cl	H	Br	Cl
Et	Me	Cl	CF ₃	Cl	Et	Me	Cl	Cl	Cl	Et	Me	Cl	Br	Cl
Et	Cl	Cl	CF ₃	Cl	Et	Cl	Cl	Cl	Cl	Et	Cl	Cl	Br	Cl
Et	Me	Br	CF ₃	Cl	Et	Me	Br	Cl	Cl	Et	Me	Br	Br	Cl

L es CH₂CH₂

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶
Et	Cl	Br	CF ₃	Cl	Et	Cl	Br	Cl	Cl	Et	Cl	Br	Br	Cl
Me	Me	H	CF ₃	Cl	Me	Me	H	Cl	Cl	Me	Me	H	Br	Cl
Me	Cl	H	CF ₃	Cl	Me	Cl	H	Cl	Cl	Me	Cl	H	Br	Cl
Me	Me	Cl	CF ₃	Cl	Me	Me	Cl	Cl	Cl	Me	Me	Cl	Br	Cl
Me	Cl	Cl	CF ₃	Cl	Me	Cl	Cl	Cl	Cl	Me	Cl	Cl	Br	Cl
Me	Me	Br	CF ₃	Cl	Me	Me	Br	Cl	Cl	Me	Me	Br	Br	Cl
Me	Cl	Br	CF ₃	Cl	Me	Cl	Br	Cl	Cl	Me	Cl	Br	Br	Cl

Tabla 8



L es C=O

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶
H	Me	H	CF ₃	Cl	H	Me	H	Cl	Cl	H	Me	H	Br	Cl
H	Cl	H	CF ₃	Cl	H	Cl	H	Cl	Cl	H	Cl	H	Br	Cl
H	Me	Cl	CF ₃	Cl	H	Me	Cl	Cl	Cl	H	Me	Cl	Br	Cl
H	Cl	Cl	CF ₃	Cl	H	Cl	Cl	Cl	Cl	H	Cl	Cl	Br	Cl
H	Me	Br	CF ₃	Cl	H	Me	Br	Cl	Cl	H	Me	Br	Br	Cl
H	Cl	Br	CF ₃	Cl	H	Cl	Br	Cl	Cl	H	Cl	Br	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	H	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	H	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	H	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	H	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	Cl	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	Br	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	Br	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Br	Cl

ES 2 427 141 T3

L es C=O

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶
<i>t</i> -Bu	Me	H	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	H	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	H	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	H	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	Cl	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	Br	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	Br	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Br	Cl
Et	Me	H	CF ₃	Cl	Et	Me	H	Cl	Cl	Et	Me	H	Br	Cl
Et	Cl	H	CF ₃	Cl	Et	Cl	H	Cl	Cl	Et	Cl	H	Br	Cl
Et	Me	Cl	CF ₃	Cl	Et	Me	Cl	Cl	Cl	Et	Me	Cl	Br	Cl
Et	Cl	Cl	CF ₃	Cl	Et	Cl	Cl	Cl	Cl	Et	Cl	Cl	Br	Cl
Et	Me	Br	CF ₃	Cl	Et	Me	Br	Cl	Cl	Et	Me	Br	Br	Cl
Et	Cl	Br	CF ₃	Cl	Et	Cl	Br	Cl	Cl	Et	Cl	Br	Br	Cl
Me	Me	H	CF ₃	Cl	Me	Me	H	Cl	Cl	Me	Me	H	Br	Cl
Me	Cl	H	CF ₃	Cl	Me	Cl	H	Cl	Cl	Me	Cl	H	Br	Cl
Me	Me	Cl	CF ₃	Cl	Me	Me	Cl	Cl	Cl	Me	Me	Cl	Br	Cl
Me	Cl	Cl	CF ₃	Cl	Me	Cl	Cl	Cl	Cl	Me	Cl	Cl	Br	Cl
Me	Me	Br	CF ₃	Cl	Me	Me	Br	Cl	Cl	Me	Me	Br	Br	Cl
Me	Cl	Br	CF ₃	Cl	Me	Cl	Br	Cl	Cl	Me	Cl	Br	Br	Cl

L es CH₂

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶
H	Me	H	CF ₃	Cl	H	Me	H	Cl	Cl	H	Me	H	Br	Cl
H	Cl	H	CF ₃	Cl	H	Cl	H	Cl	Cl	H	Cl	H	Br	Cl
H	Me	Cl	CF ₃	Cl	H	Me	Cl	Cl	Cl	H	Me	Cl	Br	Cl
H	Cl	Cl	CF ₃	Cl	H	Cl	Cl	Cl	Cl	H	Cl	Cl	Br	Cl
H	Me	Br	CF ₃	Cl	H	Me	Br	Cl	Cl	H	Me	Br	Br	Cl
H	Cl	Br	CF ₃	Cl	H	Cl	Br	Cl	Cl	H	Cl	Br	Br	Cl

ES 2 427 141 T3

L es CH ₂														
R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶
<i>i</i> -Pr	Me	H	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	H	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	H	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	H	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	Cl	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	Br	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	Br	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	H	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	H	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	H	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	H	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	Cl	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	Br	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	Br	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Br	Cl
Et	Me	H	CF ₃	Cl	Et	Me	H	Cl	Cl	Et	Me	H	Br	Cl
Et	Cl	H	CF ₃	Cl	Et	Cl	H	Cl	Cl	Et	Cl	H	Br	Cl
Et	Me	Cl	CF ₃	Cl	Et	Me	Cl	Cl	Cl	Et	Me	Cl	Br	Cl
Et	Cl	Cl	CF ₃	Cl	Et	Cl	Cl	Cl	Cl	Et	Cl	Cl	Br	Cl
Et	Me	Br	CF ₃	Cl	Et	Me	Br	Cl	Cl	Et	Me	Br	Br	Cl
Et	Cl	Br	CF ₃	Cl	Et	Cl	Br	Cl	Cl	Et	Cl	Br	Br	Cl
Me	Me	H	CF ₃	Cl	Me	Me	H	Cl	Cl	Me	Me	H	Br	Cl
Me	Cl	H	CF ₃	Cl	Me	Cl	H	Cl	Cl	Me	Cl	H	Br	Cl
Me	Me	Cl	CF ₃	Cl	Me	Me	Cl	Cl	Cl	Me	Me	Cl	Br	Cl
Me	Cl	Cl	CF ₃	Cl	Me	Cl	Cl	Cl	Cl	Me	Cl	Cl	Br	Cl
Me	Me	Br	CF ₃	Cl	Me	Me	Br	Cl	Cl	Me	Me	Br	Br	Cl
Me	Cl	Br	CF ₃	Cl	Me	Cl	Br	Cl	Cl	Me	Cl	Br	Br	Cl
H	Me	CN	CF ₃	Cl	H	Me	CN	Cl	Cl	H	Me	CN	Br	Cl
Me	Me	CN	CF ₃	Cl	Me	Me	CN	Cl	Cl	Me	Me	CN	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	CN	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	CN	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	CN	Br	Cl

ES 2 427 141 T3

L es CH₂

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶
H	Me	CN	CF ₃	F	H	Me	CN	Cl	F	H	Me	CN	Br	F
Me	Me	CN	CF ₃	F	Me	Me	CN	Cl	F	Me	Me	CN	Br	F
<i>i</i> -Pr	Me	CN	CF ₃	F	<i>i</i> -Pr	Me	CN	Cl	F	<i>i</i> -Pr	Me	CN	Br	F
H	Br	F	CF ₃	Cl	H	Br	F	Cl	Cl	H	Br	F	Br	Cl
Me	Br	F	CF ₃	Cl	Me	Br	F	Cl	Cl	Me	Br	F	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Br	F	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	F	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Br	F	Br	Cl
H	Br	F	CF ₃	F	H	Br	F	Cl	F	H	Br	F	Br	F
Me	Br	F	CF ₃	F	Me	Br	F	Cl	F	Me	Br	F	Br	F
<i>i</i> -Pr	Br	F	CF ₃	F	<i>i</i> -Pr	Br	F	Cl	F	<i>i</i> -Pr	Br	F	Br	F

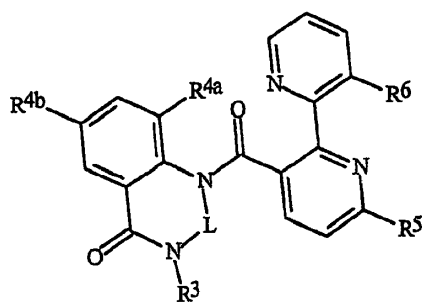
L es CH₂CH₂

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶
H	Me	H	CF ₃	Cl	H	Me	H	Cl	Cl	H	Me	H	Br	Cl
H	Cl	H	CF ₃	Cl	H	Cl	H	Cl	Cl	H	Cl	H	Br	Cl
H	Me	Cl	CF ₃	Cl	H	Me	Cl	Cl	Cl	H	Me	Cl	Br	Cl
H	Cl	Cl	CF ₃	Cl	H	Cl	Cl	Cl	Cl	H	Cl	Cl	Br	Cl
H	Me	Br	CF ₃	Cl	H	Me	Br	Cl	Cl	H	Me	Br	Br	Cl
H	Cl	Br	CF ₃	Cl	H	Cl	Br	Cl	Cl	H	Cl	Br	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	H	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	H	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	H	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	H	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	Cl	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	Br	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	Br	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	H	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	H	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	H	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	H	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	Cl	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Br	Cl

L es CH₂CH₂

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶
<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	Br	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	Br	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Br	Cl
Et	Me	H	CF ₃	Cl	Et	Me	H	Cl	Cl	Et	Me	H	Br	Cl
Et	Cl	H	CF ₃	Cl	Et	Cl	H	Cl	Cl	Et	Cl	H	Br	Cl
Et	Me	Cl	CF ₃	Cl	Et	Me	Cl	Cl	Cl	Et	Me	Cl	Br	Cl
Et	Cl	Cl	CF ₃	Cl	Et	Cl	Cl	Cl	Cl	Et	Cl	Cl	Br	Cl
Et	Me	Br	CF ₃	Cl	Et	Me	Br	Cl	Cl	Et	Me	Br	Br	Cl
Et	Cl	Br	CF ₃	Cl	Et	Cl	Br	Cl	Cl	Et	Cl	Br	Br	Cl
Me	Me	H	CF ₃	Cl	Me	Me	H	Cl	Cl	Me	Me	H	Br	Cl
Me	Cl	H	CF ₃	Cl	Me	Cl	H	Cl	Cl	Me	Cl	H	Br	Cl
Me	Me	Cl	CF ₃	Cl	Me	Me	Cl	Cl	Cl	Me	Me	Cl	Br	Cl
Me	Cl	Cl	CF ₃	Cl	Me	Cl	Cl	Cl	Cl	Me	Cl	Cl	Br	Cl
Me	Me	Br	CF ₃	Cl	Me	Me	Br	Cl	Cl	Me	Me	Br	Br	Cl
Me	Cl	Br	CF ₃	Cl	Me	Cl	Br	Cl	Cl	Me	Cl	Br	Br	Cl

Tabla 9



L es C=O

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶
H	Me	H	CF ₃	Cl	H	Me	H	Cl	Cl	H	Me	H	Br	Cl
H	Cl	H	CF ₃	Cl	H	Cl	H	Cl	Cl	H	Cl	H	Br	Cl
H	Me	Cl	CF ₃	Cl	H	Me	Cl	Cl	Cl	H	Me	Cl	Br	Cl

ES 2 427 141 T3

L es C=O

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶
H	Cl	Cl	CF ₃	Cl	H	Cl	Cl	Cl	Cl	H	Cl	Cl	Br	Cl
H	Me	Br	CF ₃	Cl	H	Me	Br	Cl	Cl	H	Me	Br	Br	Cl
H	Cl	Br	CF ₃	Cl	H	Cl	Br	Cl	Cl	H	Cl	Br	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	H	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	H	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	H	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	H	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	Cl	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	Br	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	Br	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	H	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	H	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	H	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	H	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	Cl	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	Br	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	Br	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Br	Cl
Et	Me	H	CF ₃	Cl	Et	Me	H	Cl	Cl	Et	Me	H	Br	Cl
Et	Cl	H	CF ₃	Cl	Et	Cl	H	Cl	Cl	Et	Cl	H	Br	Cl
Et	Me	Cl	CF ₃	Cl	Et	Me	Cl	Cl	Cl	Et	Me	Cl	Br	Cl
Et	Cl	Cl	CF ₃	Cl	Et	Cl	Cl	Cl	Cl	Et	Cl	Cl	Br	Cl
Et	Me	Br	CF ₃	Cl	Et	Me	Br	Cl	Cl	Et	Me	Br	Br	Cl
Et	Cl	Br	CF ₃	Cl	Et	Cl	Br	Cl	Cl	Et	Cl	Br	Br	Cl
Me	Me	H	CF ₃	Cl	Me	Me	H	Cl	Cl	Me	Me	H	Br	Cl
Me	Cl	H	CF ₃	Cl	Me	Cl	H	Cl	Cl	Me	Cl	H	Br	Cl
Me	Me	Cl	CF ₃	Cl	Me	Me	Cl	Cl	Cl	Me	Me	Cl	Br	Cl
Me	Cl	Cl	CF ₃	Cl	Me	Cl	Cl	Cl	Cl	Me	Cl	Cl	Br	Cl
Me	Me	Br	CF ₃	Cl	Me	Me	Br	Cl	Cl	Me	Me	Br	Br	Cl
Me	Cl	Br	CF ₃	Cl	Me	Cl	Br	Cl	Cl	Me	Cl	Br	Br	Cl

L es CH ₂														
R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶
H	Me	H	CF ₃	Cl	H	Me	H	Cl	Cl	H	Me	H	Br	Cl
H	Cl	H	CF ₃	Cl	H	Cl	H	Cl	Cl	H	Cl	H	Br	Cl
H	Me	Cl	CF ₃	Cl	H	Me	Cl	Cl	Cl	H	Me	Cl	Br	Cl
H	Cl	Cl	CF ₃	Cl	H	Cl	Cl	Cl	Cl	H	Cl	Cl	Br	Cl
H	Me	Br	CF ₃	Cl	H	Me	Br	Cl	Cl	H	Me	Br	Br	Cl
H	Cl	Br	CF ₃	Cl	H	Cl	Br	Cl	Cl	H	Cl	Br	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	H	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	H	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	H	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	H	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	Cl	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	Br	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	Br	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	H	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	H	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	H	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	H	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	Cl	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	Br	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	Br	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Br	Cl
Et	Me	H	CF ₃	Cl	Et	Me	H	Cl	Cl	Et	Me	H	Br	Cl
Et	Cl	H	CF ₃	Cl	Et	Cl	H	Cl	Cl	Et	Cl	H	Br	Cl
Et	Me	Cl	CF ₃	Cl	Et	Me	Cl	Cl	Cl	Et	Me	Cl	Br	Cl
Et	Cl	Cl	CF ₃	Cl	Et	Cl	Cl	Cl	Cl	Et	Cl	Cl	Br	Cl
Et	Me	Br	CF ₃	Cl	Et	Me	Br	Cl	Cl	Et	Me	Br	Br	Cl
Et	Cl	Br	CF ₃	Cl	Et	Cl	Br	Cl	Cl	Et	Cl	Br	Br	Cl
Me	Me	H	CF ₃	Cl	Me	Me	H	Cl	Cl	Me	Me	H	Br	Cl
Me	Cl	H	CF ₃	Cl	Me	Cl	H	Cl	Cl	Me	Cl	H	Br	Cl

ES 2 427 141 T3

L es CH₂

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶
Me	Me	Cl	CF ₃	Cl	Me	Me	Cl	Cl	Cl	Me	Me	Cl	Br	Cl
Me	Cl	Cl	CF ₃	Cl	Me	Cl	Cl	Cl	Cl	Me	Cl	Cl	Br	Cl
Me	Me	Br	CF ₃	Cl	Me	Me	Br	Cl	Cl	Me	Me	Br	Br	Cl
Me	Cl	Br	CF ₃	Cl	Me	Cl	Br	Cl	Cl	Me	Cl	Br	Br	Cl

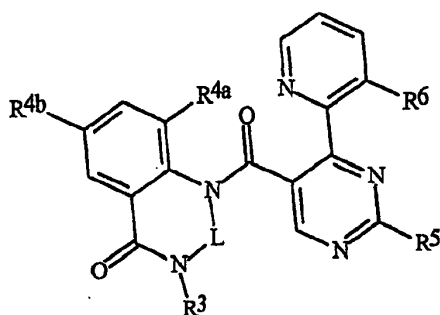
L es CH₂CH₂

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶
H	Me	H	CF ₃	Cl	H	Me	H	Cl	Cl	H	Me	H	Br	Cl
H	Cl	H	CF ₃	Cl	H	Cl	H	Cl	Cl	H	Cl	H	Br	Cl
H	Me	Cl	CF ₃	Cl	H	Me	Cl	Cl	Cl	H	Me	Cl	Br	Cl
H	Cl	Cl	CF ₃	Cl	H	Cl	Cl	Cl	Cl	H	Cl	Cl	Br	Cl
H	Me	Br	CF ₃	Cl	H	Me	Br	Cl	Cl	H	Me	Br	Br	Cl
H	Cl	Br	CF ₃	Cl	H	Cl	Br	Cl	Cl	H	Cl	Br	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	H	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	H	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	H	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	H	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	Cl	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	Br	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	Br	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	H	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	H	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	H	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	H	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	Cl	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	Br	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	Br	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Br	Cl
Et	Me	H	CF ₃	Cl	Et	Me	H	Cl	Cl	Et	Me	H	Br	Cl
Et	Cl	H	CF ₃	Cl	Et	Cl	H	Cl	Cl	Et	Cl	H	Br	Cl

L es CH₂CH₂

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶
Et	Me	Cl	CF ₃	Cl	Et	Me	Cl	Cl	Cl	Et	Me	Cl	Br	Cl
Et	Cl	Cl	CF ₃	Cl	Et	Cl	Cl	Cl	Cl	Et	Cl	Cl	Br	Cl
Et	Me	Br	CF ₃	Cl	Et	Me	Br	Cl	Cl	Et	Me	Br	Br	Cl
Et	Cl	Br	CF ₃	Cl	Et	Cl	Br	Cl	Cl	Et	Cl	Br	Br	Cl
Me	Me	H	CF ₃	Cl	Me	Me	H	Cl	Cl	Me	Me	H	Br	Cl
Me	Cl	H	CF ₃	Cl	Me	Cl	H	Cl	Cl	Me	Cl	H	Br	Cl
Me	Me	Cl	CF ₃	Cl	Me	Me	Cl	Cl	Cl	Me	Me	Cl	Br	Cl
Me	Cl	Cl	CF ₃	Cl	Me	Cl	Cl	Cl	Cl	Me	Cl	Cl	Br	Cl
Me	Me	Br	CF ₃	Cl	Me	Me	Br	Cl	Cl	Me	Me	Br	Br	Cl
Me	Cl	Br	CF ₃	Cl	Me	Cl	Br	Cl	Cl	Me	Cl	Br	Br	Cl

Tabla 10



L es C=O

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶
H	Me	H	CF ₃	Cl	H	Me	H	Cl	Cl	H	Me	H	Br	Cl
H	Cl	H	CF ₃	Cl	H	Cl	H	Cl	Cl	H	Cl	H	Br	Cl
H	Me	Cl	CF ₃	Cl	H	Me	Cl	Cl	Cl	H	Me	Cl	Br	Cl
H	Cl	Cl	CF ₃	Cl	H	Cl	Cl	Cl	Cl	H	Cl	Cl	Br	Cl
H	Me	Br	CF ₃	Cl	H	Me	Br	Cl	Cl	H	Me	Br	Br	Cl
H	Cl	Br	CF ₃	Cl	H	Cl	Br	Cl	Cl	H	Cl	Br	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	H	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	H	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	H	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	H	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Br	Cl

L es C=O

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶
<i>i</i> -Pr	Me	Cl	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	Br	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	Br	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	H	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	H	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	H	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	H	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	Cl	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	Br	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	Br	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Br	Cl
Et	Me	H	CF ₃	Cl	Et	Me	H	Cl	Cl	Et	Me	H	Br	Cl
Et	Cl	H	CF ₃	Cl	Et	Cl	H	Cl	Cl	Et	Cl	H	Br	Cl
Et	Me	Cl	CF ₃	Cl	Et	Me	Cl	Cl	Cl	Et	Me	Cl	Br	Cl
Et	Cl	Cl	CF ₃	Cl	Et	Cl	Cl	Cl	Cl	Et	Cl	Cl	Br	Cl
Et	Me	Br	CF ₃	Cl	Et	Me	Br	Cl	Cl	Et	Me	Br	Br	Cl
Et	Cl	Br	CF ₃	Cl	Et	Cl	Br	Cl	Cl	Et	Cl	Br	Br	Cl
Me	Me	H	CF ₃	Cl	Me	Me	H	Cl	Cl	Me	Me	H	Br	Cl
Me	Cl	H	CF ₃	Cl	Me	Cl	H	Cl	Cl	Me	Cl	H	Br	Cl
Me	Me	Cl	CF ₃	Cl	Me	Me	Cl	Cl	Cl	Me	Me	Cl	Br	Cl
Me	Cl	Cl	CF ₃	Cl	Me	Cl	Cl	Cl	Cl	Me	Cl	Cl	Br	Cl
Me	Me	Br	CF ₃	Cl	Me	Me	Br	Cl	Cl	Me	Me	Br	Br	Cl
Me	Cl	Br	CF ₃	Cl	Me	Cl	Br	Cl	Cl	Me	Cl	Br	Br	Cl

L es CH₂

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶
H	Me	H	CF ₃	Cl	H	Me	H	Cl	Cl	H	Me	H	Br	Cl
H	Cl	H	CF ₃	Cl	H	Cl	H	Cl	Cl	H	Cl	H	Br	Cl
H	Me	Cl	CF ₃	Cl	H	Me	Cl	Cl	Cl	H	Me	Cl	Br	Cl

ES 2 427 141 T3

					L es CH ₂									
R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶
H	Cl	Cl	CF ₃	Cl	H	Cl	Cl	Cl	Cl	H	Cl	Cl	Br	Cl
H	Me	Br	CF ₃	Cl	H	Me	Br	Cl	Cl	H	Me	Br	Br	Cl
H	Cl	Br	CF ₃	Cl	H	Cl	Br	Cl	Cl	H	Cl	Br	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	H	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	H	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	H	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	H	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	Cl	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	Br	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	Br	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	H	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	H	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	H	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	H	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	Cl	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	Br	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	Br	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Br	Cl
Et	Me	H	CF ₃	Cl	Et	Me	H	Cl	Cl	Et	Me	H	Br	Cl
Et	Cl	H	CF ₃	Cl	Et	Cl	H	Cl	Cl	Et	Cl	H	Br	Cl
Et	Me	Cl	CF ₃	Cl	Et	Me	Cl	Cl	Cl	Et	Me	Cl	Br	Cl
Et	Cl	Cl	CF ₃	Cl	Et	Cl	Cl	Cl	Cl	Et	Cl	Cl	Br	Cl
Et	Me	Br	CF ₃	Cl	Et	Me	Br	Cl	Cl	Et	Me	Br	Br	Cl
Et	Cl	Br	CF ₃	Cl	Et	Cl	Br	Cl	Cl	Et	Cl	Br	Br	Cl
Me	Me	H	CF ₃	Cl	Me	Me	H	Cl	Cl	Me	Me	H	Br	Cl
Me	Cl	H	CF ₃	Cl	Me	Cl	H	Cl	Cl	Me	Cl	H	Br	Cl
Me	Me	Cl	CF ₃	Cl	Me	Me	Cl	Cl	Cl	Me	Me	Cl	Br	Cl
Me	Cl	Cl	CF ₃	Cl	Me	Cl	Cl	Cl	Cl	Me	Cl	Cl	Br	Cl
Me	Me	Br	CF ₃	Cl	Me	Me	Br	Cl	Cl	Me	Me	Br	Br	Cl
Me	Cl	Br	CF ₃	Cl	Me	Cl	Br	Cl	Cl	Me	Cl	Br	Br	Cl

L es CH ₂ CH ₂														
R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶
H	Me	H	CF ₃	Cl	H	Me	H	Cl	Cl	H	Me	H	Br	Cl
H	Cl	H	CF ₃	Cl	H	Cl	H	Cl	Cl	H	Cl	H	Br	Cl
H	Me	Cl	CF ₃	Cl	H	Me	Cl	Cl	Cl	H	Me	Cl	Br	Cl
H	Cl	Cl	CF ₃	Cl	H	Cl	Cl	Cl	Cl	H	Cl	Cl	Br	Cl
H	Me	Br	CF ₃	Cl	H	Me	Br	Cl	Cl	H	Me	Br	Br	Cl
H	Cl	Br	CF ₃	Cl	H	Cl	Br	Cl	Cl	H	Cl	Br	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	H	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	H	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	H	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	H	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	H	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	Cl	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Me	Br	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Br	Cl
<i>i</i> -Pr	Cl	Br	CF ₃	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Cl	Cl	<i>i</i> -Pr	Cl	Br	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	H	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	H	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	H	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	H	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	H	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	Cl	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Cl	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Cl	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Me	Br	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Me	Br	Br	Cl
<i>t</i> -Bu	Cl	Br	CF ₃	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Cl	Cl	<i>t</i> -Bu	Cl	Br	Br	Cl
Et	Me	H	CF ₃	Cl	Et	Me	H	Cl	Cl	Et	Me	H	Br	Cl
Et	Cl	H	CF ₃	Cl	Et	Cl	H	Cl	Cl	Et	Cl	H	Br	Cl
Et	Me	Cl	CF ₃	Cl	Et	Me	Cl	Cl	Cl	Et	Me	Cl	Br	Cl
Et	Cl	Cl	CF ₃	Cl	Et	Cl	Cl	Cl	Cl	Et	Cl	Cl	Br	Cl
Et	Me	Br	CF ₃	Cl	Et	Me	Br	Cl	Cl	Et	Me	Br	Br	Cl
Et	Cl	Br	CF ₃	Cl	Et	Cl	Br	Cl	Cl	Et	Cl	Br	Br	Cl
Me	Me	H	CF ₃	Cl	Me	Me	H	Cl	Cl	Me	Me	H	Br	Cl
Me	Cl	H	CF ₃	Cl	Me	Cl	H	Cl	Cl	Me	Cl	H	Br	Cl

L es CH₂CH₂

R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ⁶
Me	Me	Cl	CF ₃	Cl	Me	Me	Cl	Cl	Cl	Me	Me	Cl	Br	Cl
Me	Cl	Cl	CF ₃	Cl	Me	Cl	Cl	Cl	Cl	Me	Cl	Cl	Br	Cl
Me	Me	Br	CF ₃	Cl	Me	Me	Br	Cl	Cl	Me	Me	Br	Br	Cl
Me	Cl	Br	CF ₃	Cl	Me	Cl	Br	Cl	Cl	Me	Cl	Br	Br	Cl

Formulación/Utilidad

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

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

Porcentaje en Peso		
	<u>Ingrediente Activo</u>	<u>Diluyente</u> Tensioactivo
Gránulos, Comprimidos y Polvos Dispersables en Agua o Solubles en Agua.	5-90	0-94 1-15
Suspensiones, Emulsiones, Soluciones (incluyendo Concentrados Emulsionables)	5-50	40-95 0-15
Polvos Finos	1-25	70-99 0-5
Gránulos y Aglomerados	0,01-99	5-99,99 0-15
Composiciones a Alta Concentración	90-99	0-10 0-2

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

Los tensioactivos incluyen, por Ejemplo, alcoholes polietoxilados, alquilfenoles polietoxilados, ésteres de ácidos grasos de sorbitán polietoxilados, dialquilsulfosuccinatos, alquilsulfatos, alquilbencenosulfonatos, organosiliconas, N,N-dialquiltauratos, sulfonatos de lignina, condensados de naftaleno sulfonato y formaldehído, policarboxilatos y copolímeros de bloques de polioxietileno/polioxipropileno. Los diluyentes sólidos incluyen, por Ejemplo, arcillas tales como bentonita, montmorilonita, atapulgita y caolín, almidón, azúcar, sílice, talco, tierras diatomeas, urea, carbonato

de calcio, carbonato y bicarbonato sódico, y sulfato sódico. Los diluyentes líquidos incluyen, por Ejemplo, agua, N,N-dimetilformamida, dimetilsulfóxido, N-alquilpirrolidona, etilenglicol, polipropilenglicol, parafinas, alquilbencenos, alquilnaftalenos, aceites de oliva, ricino, linaza, tungsteno, sésamo, maíz, cacahuete, semilla de algodón, semilla de soja, colza y coco, ésteres de ácidos grasos, cetonas tales como ciclohexanona, 2-heptanona, isoforona y 4-hidroxi-4-metil-2-pentanona, y alcoholes tales como metanol, ciclohexanol, decanol y alcohol tetrahidrofurfúrico.

Las disoluciones, que incluyen los concentrados emulsionables, se pueden preparar por simple mezcla de los ingredientes. Los polvos finos y polvos normales pueden prepararse por mezclado y, habitualmente, por molido en un molinillo de martillo o molinillo de energía de fluidos. Las suspensiones se preparan habitualmente por molido húmedo; véase, por Ejemplo, la patente de EE.UU. 3.060.084. Los gránulos y aglomerados pueden prepararse por pulverización del material activo sobre vehículos granulares preformados o por técnicas de aglomeración. Véase Browning, "Agglomeration", Chemical Engineering, 4 de diciembre de 1967, págs. 147-48, Perry's Chemical Engineer's Handbook, 4ª Ed., McGraw-Hill, New York, 1963, páginas 8-57 y siguientes, y la Publicación PCT WO 91/13546. Los aglomerados pueden prepararse como se describe en la patente de EE.UU. 4.172.714. Los gránulos dispersables en agua y solubles en agua se pueden preparar como se enseña en las patentes de EE.UU. 4.144.050, 3.920.442 y la patente alemana DE 3.246.493. Los comprimidos se pueden preparar como se enseña en las patentes de EE.UU. 5.180.587, 5.232.701 y 5.208.030. Las películas se pueden preparar como se enseña en la patente británica GB 2.095.558 y la patente de EE.UU. 3.299.566.

Para más información relativa a la técnica de formulación véanse, T. S. Woods, "The Formulator's Toolbox - Product Forms for Modern Agriculture" in Pesticide Chemistry and Bioscience, The Food-Environment Challenge, T. Brooks and T. R. Roberts, Eds., Proceedings of the 9th International Congress on Pesticide Chemistry, The Royal Society of Chemistry, Cambridge, 1999, páginas 120-133. Véanse también la patente de EE.UU. 3.235.361, Col. 6, línea 16 a Col. 7, línea 19 y Ejemplos 10-41; patente de EE.UU. 3.309.192, Col. 5, línea 43 a Col. 7, línea 62 y Ejemplos 8, 12, 15, 39, 41, 52, 53, 58, 132, 138-140, 162-164, 166, 167 y 169-182; patente de EE.UU. 2.891.855, Col. 3, línea 66 a Col. 5, línea 17 y Ejemplos 1-4; Klingman, Weed Control as a Science, John Wiley and Sons, Inc., Nueva York, 1961, páginas 81-96; y Hance *et al.*, Weed Control Handbook, 8ª Ed., Blackwell Scientific Publications, Oxford, 1989.

En los siguientes Ejemplos, todos los porcentajes están en peso y todas las formulaciones se preparan por las rutas convencionales. Los números de compuesto se refieren a los compuestos de la Tabla de Índice A.

Ejemplo A

Polvo Humectable

Compuesto 1	65,0%
Dodecilfenol polietilenglicol éter	2,0%
Ligninsulfonato sódico	4,0%
Silicoaluminato sódico	6,0%
Montmorillonita (calcinada)	23,0%.

Ejemplo B

Gránulo

Compuesto 1	10,0%
Gránulos de attapulgita (bajo contenido en materia volátil, 0,71/0,30 mm; Tamices U.S.S. N° 25-50)	90,0%.

Ejemplo C

Aglomerado Extruido

Compuesto 1	25,0%
-------------	-------

Ejemplo CAglomerado Extruido

Sulfato sódico anhidro	10,0%
Ligninsulfonato de calcio en bruto	5,0%
Alquilnaftalenosulfonato sódico	1,0%
Bentonita de calcio/magnesio	59,0%.

Ejemplo DConcentrado Emulsionable

Compuesto 1	20,0%
Mezcla de sulfonatos de aceites solubles y éteres polioxietilénicos	10,0%
Isoforona	70,0%.

Ejemplo EGránulo

Compuesto 1	0,5%
Celulosa	2,5%
Lactosa	4,0%
Harina de maíz	93,0%.

- 5 Los compuestos de esta invención se caracterizan por patrones metabólicos y/o residuales en suelo favorables y muestran actividad en el control de un espectro de plagas agronómicas y no agronómicas de invertebrados. (En el contexto de esta descripción, "control de plagas de invertebrados" significa inhibición del desarrollo de plagas de invertebrados (incluyendo la mortalidad) lo que causa una reducción significativa de la alimentación u otras lesiones o daños causados por la plaga; las expresiones relacionadas se definen de manera análoga.) Como se ha definido en esta descripción, la expresión "plaga de invertebrados" incluye artrópodos, gasterópodos y nematodos de importancia económica como plagas. El término "artrópodo" incluye insectos, ácaros, arañas, escorpiones, ciempiés, milpiés, cochinillas y sinfílicos. El término "gasterópodo" incluye caracoles, babosas y otros estilomatóforos. El término "nematodo" incluye todos los helmintos, tales como: gusanos redondos, gusanos del corazón y nematodos fitófagos (Nematoda), duelas (Tematoda), acantocéfalos y tenias (Cestoda). Los expertos en la materia reconocerán que no todos los compuestos son igualmente eficaces contra todas las plagas. Los compuestos de esta invención muestran actividad contra plagas agronómicas y no agronómicas económicamente importantes. El término "agronómico" se refiere a la producción de cultivos de campo tales como cultivos para alimentación o para la obtención de fibras e incluyen el desarrollo de cultivos de cereales (por Ejemplo, trigo, avena, cebada, centeno, arroz, maíz), soja, cultivos de hortalizas (por Ejemplo, lechuga, coles, tomates, judías), patatas, batatas, uvas, algodón y frutales (por Ejemplo, frutales de pepita, frutales de hueso y cítricos). La expresión "no agronómico" se refiere a otras plagas o aplicaciones hortícolas (por Ejemplo, plantas forestales, de invernadero o de vivero u ornamentales que no crecen en el campo), relacionadas con la salud pública (humana) y de los animales, estructuras domésticas y comerciales, dentro de las casas y en productos almacenados. Debido al espectro de control de las plagas de invertebrados y a la importancia económica, son realizaciones preferidas de la invención la protección (frente al daño o lesiones producidas por plagas de invertebrados) de cultivos agronómicos de algodón, 10 maíz, soja, arroz, cultivos hortícolas, patata, batata, uvas y árboles frutales por medio del control de las plagas de invertebrados. Las plagas agronómicas o no agronómicas incluyen larvas del orden Lepidóptera tales como orugas, noctuidos, orugas agrimensoras y heliotinas de la familia Noctuidae (por Ejemplo, gusano troceador del maíz 25

(*Spodoptera fugiperda* J. E. Smith), gusano soldado (*Spodoptera exigua* Hübner), notuido ypsilon (*Agrotis ipsilon* Hufnagel), gusano falso medidor (*Trichoplusia ni* Hübner), gusano de la cápsula (*Heliothis virescens* Fabricius)); perforadores, barrenadores, gusanos del césped, gusanos de coníferas, gusanos de coles y polillas de la familia Piralidae (por Ejemplo, perforador del maíz europeo (*Ostrinia nubilalis* Hübner), gusano de la naranja navel (*Amyelois transitella* Walker), oruga de la raíz del maíz (*Crambus caliginosellus* Clemens), gusano peludo del césped (*Herpetogramma licarsialis* Walker)); enrolladores de hojas, gusanos de los brotes, gusanos de las semillas y gusanos de las frutas de la familia Tortricidae (por Ejemplo, polilla de la manzana (*Cydia pomonella* Linnaeus), polilla del racimo (*Endopiza viteana* Clemens), polilla oriental (*Grapholita molesta* Busck)); y muchos otros lepidópteros importantes desde el punto de vista económico (por Ejemplo, polilla de la col (*Plutella xylostella* Linnaeus), gusano rosado (*Pectinophora gossypiella* Saunders), polilla gitana (*Lymantria dispar* Linnaeus)); ninfas y adultos del orden Blattodea incluyendo cucarachas de las familias Blattellidae y Blattidae (por Ejemplo, cucaracha oriental (*Blatta orientalis* Linnaeus), cucaracha asiática (*Blatella asahinai* Mizukubo), cucaracha alemana (*Blattella germanica* Linnaeus), cucaracha de banda marrón (*Supella longipalpa* Fabricius), cucaracha americana (*Periplaneta americana* Linnaeus), cucaracha de color castaño (*Periplaneta brunnea* Burmeister), cucaracha de Madeira (*Leucophaea maderae* Fabricius)); larvas y adultos que se alimentan de las hojas del orden Coleoptera incluyendo gorgojos de las familias Anthribidae, Bruchidae y Curculionidae (por Ejemplo, gorgojo del algodón (*Anthonomus grandis* Boheman), gorgojo acuático del arroz (*Lissorhoptrus oryzophilus* Kuschel), gorgojo del trigo (*Sitophilus granarius* Linnaeus), gorgojo del arroz (*Sitophilus oryzae* Linnaeus)); escarabajos pulga, escarabajos del pepino, gusanos de raíces, escarabajos de las hojas, escarabajos de la patata, y barrenadores de hojas de la familia Chrysomelidae (por Ejemplo, escarabajo de la patata de Colorado (*Leptinotarsa decemlineata* Say), gusano de la raíz del maíz del oeste (*Diabrotica virgifera virgifera* LeConte)); abejorros y otros escarabajos de la familia Scarabaeidae (por Ejemplo, escarabajo japonés (*Popillia japonica* Newman) y abejorro europeo (*Rhizotrogus majalis* Razoumowsky)); escarabajos de las alfombras de la familia Dermestidae; gusanos alambre de la familia Elateridae; escarabajos de la corteza de la familia Scolytidae y escarabajos de la harina de la familia Tenebrionidae. Además incluye: adultos y larvas del orden Dermaptera incluyendo tijeretas de la familia Forficulidae (por Ejemplo, tijereta europea (*Forficula auricularia* Linnaeus), tijereta negra (*Chelisoches morio* Fabricius)); adultos y ninfas de los órdenes Hemiptera y Homoptera tales como chinches de plantas de la familia Miridae, cícadas de la familia Cicadidae, saltahojas (por Ejemplo, *Empoasca* spp.) de la familia Cicadellidae, chicharritas de las familias Fulgoroidea y Delphacidae, membrácidos de la familia Membracidae, psílidos de la familia Psyllidae, moscas blancas de la familia Aleyrodidae, áfidos de la familia Aphididae, filoxeras de la familia Phylloxeridae, piojos harinosos de la familia Pseudococcidae, cochinillas de las familias Coccidae, Diaspididae y Margarodidae, chinches de encaje de la familia Tingidae, chinches hediondas de la familia Pentatomidae, chinche de los pastos (por Ejemplo, *Blissus* spp.) y otras chinches que se alimentan de semillas de la familia Lygaeidae, chinches escupidoras de la familia Cercopidae, chinche de la calabaza de la familia Coreidae y chinches rojas y tintoreras del algodón de la familia Pirrhocoridae. Se incluyen también adultos y larvas del orden Acari (ácaros) tales como ácaros araña y ácaros rojos de la familia Tetranychidae (por Ejemplo, ácaro rojo europeo (*Panonychus ulmi* Koch), ácaro araña de dos manchas (*Tetranychus urticae* Koch), ácaro McDaniel (*Tetranychus mcdanieli* McGregor)), ácaros planos de la familia Tenuipalpidae (por Ejemplo, ácaro plano de los cítricos (*Brevipalpus lewisi* McGregor)), ácaros de la herrumbre y de las yemas de la familia Eriophyidae y ácaros de alimentación foliar y ácaros importantes en la salud humana y animal, es decir, ácaros del polvo de la familia Epidermoptidae, ácaros foliculares de la familia Demodicidae, ácaros de los cereales de la familia Glycyphagidae, garrapatas del orden Ixodidae (por Ejemplo, garrapata del venado (*Ixodes scapularis* Say), garrapata paralizante australiana (*Ixodes holociclus* Neumann), garrapata americana del perro (*Dermacentor variabilis* Say), garrapata estrella solitaria (*Amblyomma americanum* Linnaeus) y aradores de la sarna y ácaros que provocan prurito de las familias Psoroptidae, Pyemotidae y Sarcoptidae; adultos e inmaduros del orden Orthoptera incluyendo saltamontes, langostas y grillos (por Ejemplo, saltamontes migratorios (por Ejemplo, *Melanoplus sanguinipes* Fabricius, *M. differentialis* Thomas), saltamontes americanos (por Ejemplo, *Schistocerca americana* Drury), langosta del desierto (*Schistocerca gregaria* Forskal), langosta migratoria (*Locusta migratoria* Linnaeus), grillo doméstico (*Acheta domesticus* Linnaeus), grillo cebollino (*Gryllotalpa* spp.)); adultos y ejemplares inmaduros del orden Diptera que incluyen barrenadores de hojas, quironómidos, moscas de la fruta (Tephritidae), moscas frit (por Ejemplo, *Oscinella frit* Linnaeus), larvas de tierra, moscas domésticas (por Ejemplo, *Musca domestica* Linnaeus), moscas domésticas menores (por Ejemplo, *Fannia canicularis* Linnaeus, *F. femoralis* Stein), moscas de los establos (por Ejemplo, *Stomoxys calcitrans* Linnaeus), moscas de la cara, mosca del cuerno, moscas azules de la carne (por Ejemplo, *Chrysomya* spp., *Phormia* spp.), y otras plagas de moscas muscoides, moscas del venado (por Ejemplo, *Tabanus* spp.), estros (por Ejemplo, *Gastrophilus* spp., *Oestrus* spp.), larvas que afectan al ganado (por Ejemplo, *Hypoderma* spp.), tábanos (por Ejemplo, *Chrysops* spp.), melófagos (por Ejemplo, *Melophagus ovinus* Linnaeus) y otros Brachycera, mosquitos (por Ejemplo, *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Culex* spp.), moscas negras (por Ejemplo, *Prosimulium* spp., *Simulium* spp.), quironómidos mordedores, moscas de la arena, sciarida, y otros Nematocera; adultos e inmaduros del orden Thysanoptera incluyendo trips de la cebolla (*Thrips tabaci* Lindeman) y otros trips que se alimentan de las hojas; plagas de insectos del orden Hymenoptera incluyendo hormigas (por Ejemplo, hormiga roja carpintera (*Camponotus ferrugineus* Fabricius), hormiga negra carpintera (*Camponotus pennsylvanicus* De Geer), hormiga faraón (*Monomorium pharaonis* Linnaeus), hormiga pequeña de fuego (*Wasmannia auropunctata* Roger), hormiga de fuego (*Solenopsis geminata* Fabricius), hormiga de fuego roja importada (*Solenopsis invicta* Buren), hormiga argentina (*Iridomyrmex humilis* Mayr), hormiga loca (*Paratrechina longicornis* Latreille), hormiga del pavimento (*Tetramorium caespitum* Linnaeus), hormiga del maizal (*Lasius alienus* Förster), hormigas olorosas domésticas (*Tapinoma sessile* Say)), abejas (incluyendo abejas carpintero), avispones, véspulas y avispas; plagas de insectos del orden Isoptera

incluyendo la termita subterránea oriental (*Reticulitermes flavipes* Kollar), termita subterránea occidental (*Reticulitermes hesperus* Banks), termita subterránea de Formosa (*Coptotermes formosanus* Shiraki), termita de la madera seca de la India Oriental (*Incisitermes immigrans* Snyder) y otras termitas de importancia económica; plagas de insectos del orden Thysanura tales como pececillo de plata (*Lepisma saccharina* Linnaeus) e insecto de fuego (*Thermobia domestica* Packard); plagas de insectos del orden Mallophaga y que incluyen el piojo de la cabeza (*Pediculus humanus capitis* De Geer), piojo del cuerpo (*Pediculus humanus humanus* Linnaeus), piojo del cuerpo del pollo (*Menacanthus stramineus* Nitsch), piojo mordedor del perro (*Trichodectes canis* De Geer), piojo del plumón (*Goniocotes gallinae* De Geer), piojo del cuerpo de la oveja (*Bovicola ovis* Schrank), piojo del ganado de hocico corto (*Haematopinus eurysternus* Nitzsch), piojo del ganado de hocico largo (*Linognathus vituli* Linnaeus) y otros piojos parásitos chupadores y mordedores que atacan al ser humano y a los animales; plagas de insectos del orden Siphonoptera que incluyen la pulga de la rata oriental (*Xenopsylla cheopis* Rothschild), pulga del gato (*Ctenocephalides felis* Bouche), pulga del perro (*Ctenocephalides canis* Curtis), pulga de la gallina (*Ceratophyllus gallinae* Schrank), pulga pegajosa (*Echidnophaga gallinacea* Westwood), pulga humana (*Pulex irritans* Linnaeus) y otras pulgas que afectan a los mamíferos y a las aves. Otras plagas de artrópodos contempladas incluyen: arañas del orden Araneae tales como la araña solitaria marrón (*Loxosceles reclusa* Gertsch & Mulaik) y la viuda negra (*Latrodectus mactans* Fabricius), y ciempiés del orden Scutigermorfa tales como ciempiés de las casas (*Scutigera coleoptrata* Linnaeus). La actividad también incluye miembros de las clases Nematoda, Cestoda, Trematoda, y Acanthocephala que incluyen miembros económicamente importantes de los órdenes Strongylida, Ascaridida, oxiurida, Rhabditida, Spirurida, y Enoplida tales como, pero no limitados a, plagas agrícolas económicamente importantes (es decir, nematodos de los nudos de la raíz del género *Meloidogyne*, nematodos de los prados del género *Pratylenchus*, nematodos atronadores de las raíces del género *Trichodorus*, etc.) y plagas para la salud animal y humana (es decir, todos los trematodos, tenias, y ascárides económicamente importantes, tales como *Strongylus vulgaris* en caballos, *Toxocara canis* en perros, *Haemonchus contortus* en ovejas, *Dirofilaria immitis* Leidy en perros, *Anoplocephala perfoliata* en caballos, *Fasciola hepatica* Linnaeus en rumiantes, etc.).

Los compuestos de la invención muestran particularmente gran actividad contra plagas del orden Lepidoptera (p. ej., *Alabama argillacea* Hübner (gusano de la hoja del maíz), *Archips argyrospila* Walker (enrollador de las hojas frutales), *A. rosana* Linnaeus (enrollador de las hojas europeo) y otras especies de *Archips*, *Chilo suppressalis* Walker (perforador del tallo del arroz), *Cnaphalocrosis medinalis* Guenee (enrollador de las hojas del arroz), *Crambus caliginosellus* Clemens (oruga de la raíz del maíz), *Crambus teterrellus* Zincken (oruga del césped), *Cydia pomonella* Linnaeus (polilla de la manzana), *Earias insulana* Boisduval (oruga espinosa del algodón), *Earias vittella* Fabricius (gusano moteado), *Helicoverpa armigera* Hübner (oruga americana), *Helicoverpa zea* Boddie (gusano del maíz), *Heliothis virescens* Fabricius (gusano del tabaco), *Herpetogramma licarsisalis* Walker (gusano del césped), *Lobesia botrana* Denis & Schiffermüller (polilla de los racimos de uvas), *Pectinophora gossypiella* Saunders (gusano rosa), *Philocnistis citrella* Stainton (minador de las hojas de los cítricos), *Pieris brassicae* Linnaeus (mariposa de la col), *Pieris rapae* Linnaeus (blanquita de la col), *Plutella xilostella* Linnaeus (polilla de dorso de diamante), *Spodoptera exigua* Hübner (oruga militar de la remolacha), *Spodoptera litura* Fabricius (gusano gris del tabaco, oruga del racimo), *Spodoptera frugiperda* J. E. Smith (oruga militar tardía maíz), *Trichoplusia ni* Hübner (gusano medidor de la col) y *Tuta absoluta* Meyrick (minador de las hojas del tomate)). Los compuestos de la invención también tienen actividad comercialmente significativa sobre miembros del orden Homoptera, que incluyen: *Acyrtosiphon pisum* Harris (pulgón del guisante), *Aphis craccivora* Koch (pulgón del caupí), *Aphis fabae* Scopoli (pulgón de la judía negra), *Aphis gossypii* Glover (pulgón del algodón, pulgón del melón), *Aphis pomi* De Geer (pulgón de la manzana), *Aphis spiraeicola* Patch (pulgón de la spirea), *Aulacorthum solani* Kaltenbach (pulgón del ciruelo), *Chaetosiphon fragaefolii* Cockerell (pulgón de la fresa), *Diuraphis noxia* Kurdjumov/Mordvilko (pulgón ruso del trigo), *Dysaphis plantaginea* Paaserini (pulgón ceniza del manzano), *Eriosoma lanigerum* Hausmann (pulgón lanigero del manzano), *Hyalopterus pruni* Geoffroy (pulgón harinoso del ciruelo), *Lipaphis erysimi* Kaltenbach (pulgón del nabo), *Metopolophium dirrhodum* Walker (pulgón del cereal), *Macrosiphum euphorbiae* Thomas (pulgón de la patata), *Myzus persicae* Sulzer (pulgón del melocotonero, pulgón verde del melocotón), *Nasonovia ribisnigri* Mosley (pulgón de la lechuga), *Pemphigus* spp. (pulgón de raíces y pulgón de agallas), *Rhopalosiphum maidis* Fitch (pulgón de la hoja de maíz), *Rhopalosiphum padi* Linnaeus (pulgón verde de la avena), *Schizaphis graminum* Rondani (pulgón verde), *Sitobion avenae* Fabricius (pulgón inglés del grano), *Therioaphis maculata* Buckton (pulgón moteado de la alfalfa), *Toxoptera aurantii* Boyer de Fonscolombe (pulgón negro de los cítricos), y *Toxoptera citricida* Kirkaldy (pulgón marrón de los cítricos); *Adelges* spp. (adélgidos); *Phylloxera devastatrix* Pergande (pecan phylloxera); *Bemisia tabaci* Gennadius (mosca blanca del tabaco, mosca del boniato), *Bemisia argentifolii* Bellows & Perring (mosca blanca de las hojas plaetadas), *Dialeurodes citri* Ashmead (mosca blanca de los cítricos) y *Trialeurodes vaporariorum* Westwood (mosca blanca de los invernaderos); *Empoasca fabae* Harris (chicharra de la patata), *Laodelphax striatellus* Fallen (saltapuntas marrón más pequeño), *Macrolestes quadrilineatus* Forbes (chicharra del áster), *Nephotettix cincticeps* Uhler (chicharra verde), *Nephotettix nigropictus* Stål (chicharra del arroz), *Nilaparvata lugens* Stål (saltapuntas marrón), *Peregrinus maidis* Ashmead (saltapuntas del maíz), *Sogatella furcifera* Horvath (saltapuntas de dorso blanco), *Sogatodes orizicola* Muir (delfácido del arroz), *Typhlocyba pomaria* McAtee, chicharra blanca de la manzana, *Erythroneura* spp. (chicharras de la uva); *Magicidada septendecim* Linnaeus (cicada periódica); *Icerya purchasi* Maskell (cochinilla algodonosa), *Quadraspidiotus perniciosus* Comstock (cochinilla de San José), *Planococcus citri* Rizzo (cochinilla harinosa de los cítricos); *Pseudococcus* spp. (otro complejo de cochinilla harinosa); *Cacopsylla pyricola* Foerster (psylla de la pera), *Trioza diospyri* Ashmead (psylla del caqui). Estos compuestos también tienen actividad sobre miembros del orden Hemiptera que incluyen: *Acrosternum hilare* Say

(chinche fétida verde), *Anasa tristis* De Geer (insecto de la calabaza), *Blissus leucopterus* leucopterus Say (insecto chinche), *Corythuca gossypii* Fabricius (chinche de encaje del algodón), *Cyrtopeltis modesta* Distant (chinche del tomate), *Dysdercus suturellus* Herrich-Schäffer (chinche tintadora del algodón), *Euchistus servus* Say (chinche fétida marrón), *Euchistus variolarius* Palisot de Beauvois (chinche fétida de una mota), *Graptosthetus* spp. (complejo de chinches de semillas), *Leptoglossus corculi* Say (chinche del piñón de patas imitador de hojas), *Lygus lineolaris* Palisot de Beauvois (chinche opaca de las plantas), *Nezara viridula* Linnaeus (chinche fétida verde del sur), *Oebalus pugnax* Fabricius (chinche fétida del arroz), *Oncopeltus fasciatus* Dallas (chinche grande del algodón), *Pseudatomoscelis seriatus* Reuter (pulga del algodón). Otros órdenes de insectos controlados por los compuestos de la invención incluyen Thysanoptera (por Ejemplo, *Frankliniella occidentalis* Pergande (trip occidental de las flores), *Scirtotrips citri* Moulton (trips de los cítricos), *Sericotrips variabilis* Beach (trips de la soja) y *Thrips tabaci* Lindeman (trip de la cebolla); y el orden Coleoptera (por Ejemplo, *Leptinotarsa decemlineata* Say (escarabajo de la patata de colorado), *Epilachna varivestis* Mulsant (escarabajo del frijol) y gusanos alambre del género *Agriotes*, *Athous* o *Limoni*).

Los compuestos de esta invención se pueden mezclar también con uno o más de otros compuestos o agentes biológicamente activos que incluyen insecticidas, fungicidas, nematocidas, bactericidas, acaricidas, reguladores del crecimiento tales como estimulantes del enraizamiento, quimioesterilizantes, productos semioquímicos, repelentes, atrayentes, feromonas, estimulantes del apetito, otros compuestos biológicamente activos o bacterias entomopatógenas, virus u hongos para formar un pesticida multicomponente que proporciona un espectro incluso más amplio de utilidad agrícola. De esta forma, las composiciones de la presente invención pueden comprender además una cantidad biológicamente eficaz de al menos un compuesto o agente biológicamente activo adicional. Ejemplos de dichos compuestos o agentes biológicamente activos con los que pueden formularse los compuestos de esta invención son: insecticidas tales como abamectina, acefato, acetamiprid, avermectina, azadiractina, azinfos-metilo, bifentrina, binfenazato, buprofezina, carbofurano, clorfenapir, clorfluazuron, clorpirifos, clorpirifos-metilo, cromafenozida, clotianidina, ciflutrin, beta-ciflutrin, cihalotrin, lambda-cihalotrin, cipermetrin, ciromazina, deltametrin, diafenthiuron, diazinon, diflubenzuron, dimetoato, diofenolan, emamectina, endosulfan, esfenvalerato, etiprol, fenotcarb, fenoxicarb, fenpropatrin, fenproximato, fenvalerato, fipronilo, flonicamid, flucitrinato, tau-fluvalinato, flufenoxuron, fonofos, halofenozida, hexaflumuron, imidacloprid, indoxacarb, isofenfos, lufenuron, malation, metaldehído, metamidofos, metidation, metomilo, metopreno, metoxiclor, monocrotofos, metoxifenoza, nitiazina, novaluron, oxamil, paration, paration-metilo, permetrin, forato, fosalone, fosmet, fosfamidon, pirimicarb, profenofos, pimetozina, piridililo, piriproxifen, rotenona, spinosad, sulprofos, tebufenozida, teflubenzuron, teflutrin, terbufos, tetraclorvinfos, tiacloprid, tiametoxam, tiodicarb, tiosultap-sodio, tralometrin, triclorfon y triflumuron; fungicidas tales como acibenzolar, azoxistrobin, benomilo, blastidicid-S, mezcla de Bordeaux (sulfato de cobre tribásico), bromuconazol, carpropamid, captan, carbendazim, cloroneb, clorotalonil, oxiclورو de cobre, sales de cobre, ciflufenamid, cimoxanil, ciproconazol, ciprodinil, (S)-3,5-dicloro-N-(3-cloro-1-etil-1-metil-2-oxopropil)-4-metilbenzamida (RH 7281), diclocimet (S-2900), diclomezina, dicloran, difenoconazol, (S)-3,5-dihidro-5-metil-2-(metiltio)-5-fenil-3-(fenilamino)-4H-imidazol-4-ona (RP 407213), dimetomorf, dimoxistrobin, diniconazol, diniconazol-M, dodine, edifenfos, epoxiconazol, famoxadona, fenamidona, fenarimol, fenbuconazol, fencaramid (SZX0722), fenciclonil, fenpropidin, fenpropimorf, fentin acetato, fentin hidróxido, fluazinam, fludioxonil, flumetover (RPA 403397), fluquinconazol, flusilazol, flutolanil, flutriafol, folpet, fosetil-aluminio, furalaxil, furametapir (S-82658), hexaconazol, ipconazol, iprobenfos, iprodiona, isoprotiolano, kasugamicina, kresoxim-metilo, mancozeb, maneb, metfenoxam, mepronil, metalaxil, metconazol, metominostrobil/fenominostrobil (SSF-126), miclobutanil, neo-asozin (metanoarsonato férrico), oxadixil, penconazol, pencicuron, probenazol, procloraz, propamocarb, propiconazol, pirifenox, piraclostrobil, pirimetanil, piroquilon, quinoxifen, espiroamina, azufre, tebuconazol, tetraconazol, tiabendazol, tifluzamida, tiofanato-metilo, tiram, tiadinil, triadimefon, triadimenol, triciclazol, trifloxistrobin, triticonazol, validamicina y vinclozolin; nematocidas tales como aldicarb, oxamil y fenamifos; bactericidas tales como estreptomycin; acaricidas tales como amitraz, quinometionato, clorobencilato, cihexatina, dicofol, dienoclor, etoxazol, fenazaquina, óxido de fenbutatino, fenpropatrina, fenpiroximato, hexitiazox, propargita, piridabeno y tebufenpirad; y agentes biológicos tales como *Bacillus thuringiensis* que incluyen las ssp. *aizawai* y *kurstaki*, la endotoxina delta de *Bacillus thuringiensis*, baculovirus, y bacterias entomopatógenas, virus y hongos.

Una referencia general para estos protectores agrícolas es The Pesticide Manual, 12ª Edición, C. D. S. Tomlin, Ed., British Crop Protection Council, Farnham, Surrey, R.U., 2000.

Los insecticidas y acaricidas preferidos para mezclar con compuestos de esta invención incluyen piretroides tales como cipermetrina, cihalotrina, ciflutrina, beta-ciflutrina, esfenvalerato, fenvalerato y tralometrina; carbamatos tales como fenotcarb, metomil, oxamil y tiodicarb; neonicotinoides tales como clotianidil, imidacloprid y tiacloprid; bloqueantes de los canales de sodio neuronales tales como indoxacarb; lactonas macrocíclicas insecticidas tales como espinosad, abamectina, avermectina y emamectina; antagonistas del ácido γ -aminobutírico (GABA) tales como endosulfan, etiprol y fipronil; ureas insecticidas tales como flufenoxuron y triflumuron; miméticos de hormonas juveniles tales como diofenolan y piriproxifen; pimetozina; y amitraz. Los agentes biológicos preferidos para mezclar con compuestos de esta invención incluyen *Bacillus thuringiensis* y la endotoxina delta de *Bacillus thuringiensis* así como insecticidas víricos que se dan de forma natural y modificados genéticamente que incluyen miembros de la familia *Baculoviridae* así como hongos entomófagos.

Las mezclas más preferidas incluyen una mezcla de un compuesto de esta invención con cihalotrina; una mezcla de un compuesto de esta invención con beta-ciflutrina; una mezcla de un compuesto de esta invención con

esfenvalerato; una mezcla de un compuesto de esta invención con metomilo; una mezcla de un compuesto de esta invención con imidacloprida; una mezcla de un compuesto de esta invención con tiacloprida; una mezcla de un compuesto de esta invención con indoxacarb; una mezcla de un compuesto de esta invención con abamectina; una mezcla de un compuesto de esta invención con endosulfano; una mezcla de un compuesto de esta invención con etiprol; una mezcla de un compuesto de esta invención con fipronil; una mezcla de un compuesto de esta invención con flufenoxurón; una mezcla de un compuesto de esta invención con piriproxifeno; una mezcla de un compuesto de esta invención con pimetrozina; una mezcla de un compuesto de esta invención con amitraz; una mezcla de un compuesto de esta invención con *Bacillus thuringiensis* y una mezcla de un compuesto de esta invención con la endotoxina delta de *Bacillus thuringiensis*.

En ciertos casos, serán particularmente ventajosas para el tratamiento de la resistencia las combinaciones con otros compuestos o agentes para el control de plagas de invertebrados que tengan un espectro de control similar, pero diferente modo de acción. Por lo tanto, las composiciones de la presente invención pueden comprender además una cantidad biológicamente eficaz de al menos un compuesto o agente adicional de control de plagas de invertebrados que tenga un espectro de control similar, pero un modo de acción diferente. La puesta en contacto de una planta modificada genéticamente para expresar un compuesto de protección de plantas (por Ejemplo, una proteína) o el locus de la planta con una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto de la invención también puede proporcionar un mayor espectro de protección de las plantas y puede ser ventajoso para el tratamiento de la resistencia.

Las plagas de invertebrados se controlan en aplicaciones agronómicas y no agronómicas aplicando uno o más de los compuestos de esta invención, en una cantidad eficaz, en el medio de las plagas que incluye el lugar agronómico o no agronómico de infestación, en el área a proteger, o directamente en las plagas a controlar. Por lo tanto, la presente invención comprende además un método para el control de invertebrados en aplicaciones agronómicas y/o no agronómicas, que comprende poner en contacto los invertebrados o su medio con una cantidad biológicamente eficaz de uno o más de los compuestos de la invención, o con una composición que comprende al menos uno de estos compuestos o una composición que comprende al menos uno de estos compuestos y una cantidad eficaz de al menos un compuesto o agente biológicamente activo adicional.

Un método de contacto preferido es por pulverización. Como alternativa, una composición granular que comprende un compuesto de la invención puede aplicarse al follaje de las plantas o al suelo. Los compuestos de esta invención se suministran también de forma eficaz a través de la captación de la planta, poniendo en contacto la planta con una composición que comprende un compuesto de esta invención aplicado como un rociado de una formulación líquida en el terreno, de una formulación granular en el terreno, un tratamiento en una caja de vivero o una inmersión de los trasplantes. Los compuestos son también eficaces por aplicación tópica de una composición que comprende un compuesto de esta invención en el lugar de infestación. Otros métodos de contacto incluyen la aplicación de un compuesto o una composición de la invención mediante pulverizaciones directas y residuales, pulverizaciones aéreas, geles, recubrimientos de semillas, microencapsulaciones, captaciones sistémicas, cebos, marcadores, píldoras gruesas, nebulizadores térmicos, fumigadores, aerosoles, pulverizaciones y muchos otros.

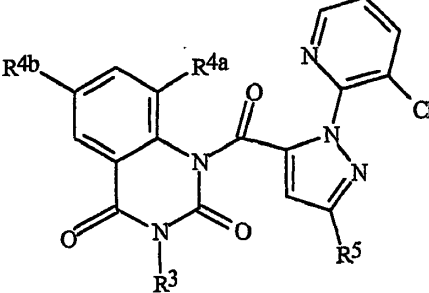
Los compuestos de esta invención se pueden incorporar en cebos que consumen los invertebrados o dentro de dispositivos tales como trampas y similares. Los gránulos o cebos que comprenden entre 0,01-5% de ingrediente activo, 0,05-10% de uno o más agentes que retienen la humedad y 40-99% de harina vegetal son eficaces para combatir insectos del sustrato en proporciones de aplicación muy bajas, particularmente a dosis de ingrediente activo que son letales por ingestión en lugar de por contacto directo.

Los compuestos de esta invención se pueden aplicar en su estado puro, pero la aplicación más frecuente será la de una formulación que comprende uno o más compuestos con vehículos, diluyentes y tensioactivos adecuados y posiblemente en combinación con un alimento dependiendo del uso final contemplado. Un método de aplicación preferido implica pulverizar una dispersión acuosa o una solución en aceite refinado de los compuestos. Las combinaciones con aceites de pulverización, concentraciones con aceite de pulverización, esparcidores, adyuvantes, otros disolventes y agentes sinérgicos tales como butóxido de piperonilo, a menudo mejoran la eficacia del compuesto.

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

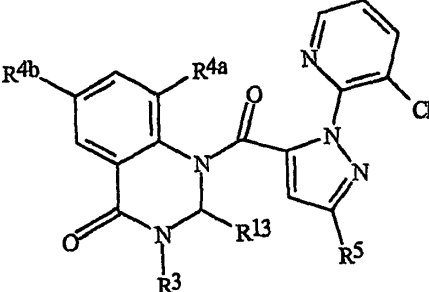
- 5 Los siguientes Ensayos de los Ejemplos Biológicos de la Invención demuestran la eficacia de los métodos de la invención para proteger a las plantas de plagas de invertebrados específicas. "La eficacia de control" representa la inhibición del desarrollo de invertebrados (incluyendo la mortalidad) que reduce significativamente la alimentación. Sin embargo, la protección de control de plagas producida por los compuestos no se limita a estas especies. Véanse las Tablas de Índices A-D para las descripciones de los compuestos. Se usan las siguientes abreviaturas en las Tablas Índice que siguen: *t* es terciario, *n* es normal, *i* es iso, *s* es secundario, *c* es ciclo, Me es metilo, Et es etilo, Pr es propilo y Bu es butilo; de manera correspondiente *i*-Pr es isopropilo, *s*-Bu es butilo secundario, etc. La abreviatura "Ej." representa "Ejemplo" y es seguida de un número que indica en qué Ejemplo se prepara el compuesto.

TABLA DE ÍNDICE A

					
Compuesto	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	p.f. (°C)
1	<i>i</i> -Pr	Me	H	CF ₃	*
2	Me	Me	Br	CF ₃	*
3	<i>i</i> -Pr	Me	Br	CF ₃	*
4	<i>t</i> -Bu	Me	Br	CF ₃	*
5	Me	Me	Br	Br	*
6 (Ej. 1)	<i>i</i> -Pr	Me	Br	Br	*
*Véase la Tabla de Índice D para los datos de ¹ H NMR					

10

TABLA DE ÍNDICE B

						
Compuesto	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	R ¹³	p.f. (°C)
7 (Ej. 2)	<i>i</i> -Pr	Me	H	Br	H	*
8	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Cl	H	192-194

ES 2 427 141 T3

9	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	Br	H	207-208
10	<i>i</i> -Pr	Cl	Cl	CF ₃	H	167-168
11	Me	Cl	Cl	Cl	H	173-178
12	Me	Cl	Cl	Br	H	200-202
13	Me	Cl	Cl	CF ₃	H	157-158
14	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Cl	H	219-220
15	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	Br	H	228-231
16	<i>i</i> -Pr	Me	Cl	CF ₃	H	213-214
17	Me	Me	Cl	Cl	H	238-240
18	Me	Me	Cl	Br	H	254-255
19	Me	Me	Cl	CF ₃	H	207-208
20	<i>i</i> -Pr	Me	H	Cl	CO ₂ H	143-190
21	Me	Cl	Cl	Cl	CO ₂ H	*
22	Cl	Cl	Cl	Cl	3-piridilo	135-156
23	Cl	Cl	Cl	Cl	2-imidazolilo	*
24	Cl	Cl	Cl	Cl	4-imidazolilo	*
25	Me	Cl	Cl	Cl	CO ₂ Et	*
26	Me	Cl	Cl	Cl	CH ₂ CO ₂ Me	*
27	Me	Cl	Cl	Cl	4-(CO ₂ Me)Ph	178-232
28	H	Cl	Cl	Cl	H	181-192
29	H	Cl	Cl	CF ₃	H	162-177

*Véase la Tabla de Índice D para los datos de ¹H NMR

TABLA DE ÍNDICE C

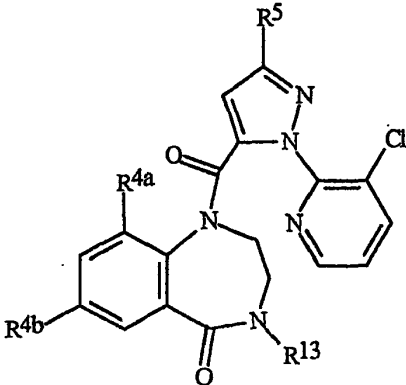
					
Compuesto	R ³	R ^{4a}	R ^{4b}	R ⁵	p.f. (°C)
30	H	Cl	Cl	Cl	*
31	H	Cl	Cl	CF ₃	*
*Véase la Tabla de Índice D para los datos de ¹ H NMR					

TABLA DE ÍNDICE D

Comp. N°	Datos de ¹ H NMR (solución de CDCl ₃ a menos que se indique lo contrario) ^a
1	DMSO- <i>d</i> ₆ 8,6-8,5 (dd, 1H), 8,4 (dd, 1H), 8,29 (s, 1H), 8,0 (d, 1H), 7,8 (dd, 1H), 7,6 (d, 1H), 7,4-7,3 (t, 1H), 5,0 (m, 1H), 2,08 (s, 3H), 1,41 (d, 6H).
2	8,41 (dd, 1H), 8,21 (d, 1H), 7,96 (dd, 1H), 7,58 (d, 1H), 7,45 (dd, 1H), 7,38 (s, 1H), 3,40 (s, 3H), 2,16 (s, 3H).
3	8,36 (dd, 1H), 8,17 (d, 1H), 7,94 (dd, 1H), 7,56 (d, 1H), 7,42 (dd, 1H), 7,37 (s, 1H), 5,08 (m, 1H), 2,16 (s, 3H), 1,46 (d, 6H).
4	8,44 (dd, 1H), 8,02 (d, 1H), 7,95 (dd, 1H), 7,52 (d, 1H), 7,45 (dd, 1H), 7,28 (s, 1H), 2,11 (s, 3H), 1,64 (s, 9H).
5	8,39 (dd, 1H), 8,20 (d, 1H), 7,93 (dd, 1H), 7,57 (d, 1H), 7,41 (dd, 1H), 7,12 (s, 1H), 3,40 (s, 3H), 2,16 (s, 3H).
6	8,34 (dd, 1H), 8,17 (d, 1H), 7,91 (dd, 1H), 7,54 (d, 1H), 7,39 (dd, 1H), 7,12 (s, 1H), 5,08 (m, 1H), 2,17 (s, 3H), 1,47 (d, 6H).
7	8,3 (m,1H), 7,9-7,8 (m,2H), 7,4-7,3 (m,3H), 6,0-5,9 (s,1H), 5,9 (d,1H), 5,0-4,8 (m,1H), 4,4-4,3 (d,1H), 2,10 (s,3H), 1,3-1,1 (m,6H)
21	DMSO- <i>d</i> ₆ 8,50 (dd, 1H), 8,21 (d, 1H), 7,87-7,75 (m, 2H), 7,61 (ddd, 1H), 5,83 (s a, 1H), 3,01 (s, 3H)
23	DMSO- <i>d</i> ₆ 8,38 (d, 1H), 8,22 (s a, 1H), 7,9-7,7 (m ancho, 2H), 7,58 (t, 1H), 7,16-7,05 (m, 2H), 6,83 (s a, 1H), 3,15 (s a, 3H)
Comp. N°	Datos de ¹ H NMR (solución de CDCl ₃ a menos que se indique lo contrario) ^a
24	DMSO- <i>d</i> ₆ 8,48 (s, 1H), 8,24 (d, 1H), 7,87-7,77 (m, 2H), 7,70 (s, 1H), 7,61 (m, 1H), 7,01 (s, 2H), 6,90 (s,

Comp. N°	Datos de ^1H NMR (solución de CDCl_3 a menos que se indique lo contrario) ^a
	1H), 3,18 (s a, 3H)
25	DMSO- d_6 8,4-8,2 (b, 2H), 8,1-7,8 (b, 2H), 7,55 (b, 1H), 7,2-7,1 (m, 2H), 6,8-6,6 (b, 1H), 4,3-3,9 (b, 2H), 3,11 (s, 3H), 1,2-0,9 (b, 3H)
26	DMSO- d_6 8,30 (d, 1H), 8,20 (s a, 1H), 7,98 (s a, 1H), 7,82 (s a, 1H), 7,55 (t, 1H), 7,41 (s a, 1H), 6,08 (s a, 1H), 3,60 (b, 2H), 3,04 (s, 3H)
30	DMSO- d_6 8,27 (dd, 1H), 8,09 (s 1H), 8,07 (dd 1H), 7,70 (dd, 1H), 7,44 (dd, 1H), 7,17 (s,1H), 4,44 (t, 2H), 3,99 (t, 2H)
31	DMSO- d_6 8,24 (dd, 1H), 8,03 (dd 1H), 7,88 (s, 1H), 7,66 (s, 1H), 7,45 (s, 1H), 7,40 (s, 1H), 4,33 (t, 2H), 3,91 (t, 2H)
Los espectros de ^1H NMR se informan en ppm de campo bajo el de tetrametilsilano; Los acoplamientos están nombrados como (s)-singlete, (d)-doblete, (t)-tripleto, (q)-cuartete, (m)-multiplete, (dd)-doblete de dobletes, (dt)-doblete de tripletes, (s a)-singlete ancho.	

Ejemplos BIOLÓGICOS DE LA INVENCION

PRUEBA A

5 Para evaluar el control de la polilla de dorso de diamante (*Plutella xilostella*) la unidad de ensayo consistía en un pequeño recipiente abierto con una planta de rábano de 12-14 días en su interior. Esta planta se infestó previamente con 10-15 larvas recién nacidas en un trozo de material de alimentación de insectos mediante el uso de un muestreador de núcleo para retirar un trozo de una lámina de material de alimentación de insectos endurecida que tenía muchas larvas creciendo sobre ella y la transferencia del trozo que contiene las larvas y el material de alimentación a la unidad de ensayo. Las larvas se trasladaron a las plantas de ensayo cuando se secó el trozo de material de alimentación.

15 Los compuestos de ensayo se formularon usando una solución que contenía 10% de acetona, 90% de agua y 300 ppm de tensioactivo no iónico X-77® Spreader Lo-Foam Formula que contenía alquilarilpolioxietileno, ácidos grasos libres, glicoles e isopropanol (Loveland Industries, Inc.). Los compuestos formulados se aplicaron en 1 ml de líquido a través de una boquilla atomizadora SUJ2 con un cuerpo normal 1/8 JJ (Spraying Systems Co.) colocado 1,27 cm (0,5 pulgadas) por encima de la parte superior de cada unidad de ensayo. Se pulverizaron 50 ppm de todos los compuestos experimentales de este estudio y se repitió la aplicación tres veces. Después de la pulverización del compuesto de prueba formulado, cada unidad de ensayo se dejó secar durante 1 hora y después se puso encima una tapa negra de vigilancia. Las unidades de ensayo se mantuvieron durante 6 días en una cámara de crecimiento a 25°C y 70% de humedad relativa. Después se evaluó visualmente el daño producido por la alimentación de la planta.

20 De los compuestos probados, los siguientes mostraron niveles excelentes de protección de la planta (20% o menos de daño por alimentación): 1, 2, 3, 5, 7, 8, 9, 10, 11, 12, 13, 14, 15, 16, 17, 18, 19, 22, 23, 24, 26, 28 y 29.

PRUEBA B

25 Para evaluar el control de la oruga militar tardía (*Spodoptera frugiperda*), la unidad de ensayo consistió en un pequeño recipiente abierto con una planta de cereal (maíz) de 4-5 días de edad en su interior. Esta planta se había preinfestado con 10-15 larvas de 1 día de edad en una parte de la dieta del insecto mediante el uso de un muestreador como se ha descrito en la Prueba A.

30 Se formularon los compuestos de ensayo y se pulverizaron 50 ppm como se describió para la Prueba A. Las aplicaciones se repitieron tres veces. Después de la pulverización, las unidades de ensayo se mantuvieron en una cámara de crecimiento y después se evaluaron visualmente como se describe en la Prueba A.

De los compuestos probados, los siguientes mostraron niveles excelentes de protección de la planta (20% o menos de daño por alimentación): 5, 7, 8, 9, 10, 11, 12, 13, 14, 15, 16, 17, 18, 19, 23, 24; 28 y 29.

PRUEBA C

35 Para evaluar el control del gusano de los brotes del tabaco (*Heliothis virescens*), la unidad de ensayo consistía en un pequeño recipiente abierto con una planta de algodón de 6-7 días de edad en su interior. Esta planta se había

preinfestado con 8 larvas de 2 días de edad en una pieza de material de alimentación de insecto mediante el uso de un muestreador como se ha descrito en la Prueba A.

5 Se formularon los compuestos de ensayo y se pulverizaron 50 ppm como se describió para la Prueba A. Las aplicaciones se repitieron tres veces. Después de la pulverización, las unidades de ensayo se mantuvieron en una cámara de crecimiento y después se evaluaron visualmente como se describe en la Prueba A.

De los compuestos probados, los siguientes mostraron niveles excelentes de protección de la planta (20% o menos de daño por alimentación): 1, 2, 5, 7, 8, 9, 10, 11, 12, 13, 14, 15, 16, 17, 18, 19, 21, 23 y 24.

PRUEBA D

10 Para evaluar el control del gusano verde cogollero (*Spodoptera exigua*) la unidad de ensayo consistió en un pequeño recipiente abierto con una planta de maíz de 4-5 días de edad en el interior. Esta planta se había preinfestado con 10-15 larvas de 1 día de edad en un trozo de material de alimentación de insecto mediante el uso de un muestreador como se ha descrito en la Prueba A.

15 Se formularon los compuestos de ensayo y se pulverizaron 50 ppm como se describió para la Prueba A. Las aplicaciones se repitieron tres veces. Después de la pulverización, las unidades de ensayo se mantuvieron en una cámara de crecimiento y después se evaluaron visualmente como se describe en la Prueba A.

De los compuestos probados, los siguientes mostraron niveles excelentes de protección de la planta (20% o menos de daño por alimentación): 2, 5, 7, 8, 9, 10, 11, 12, 13, 14, 15, 16, 17, 18, 19, 23 y 24.

PRUEBA E

20 Para evaluar el control del áfido verde del melocotonero (*Myzus persicae*) a través de medios de contacto y/o sistémicos, la unidad de ensayo consistió en un pequeño envase abierto con una planta de rábano de 12-15 días de edad en el interior. Ésta se infestó previamente colocando en una hoja de la planta de ensayo 30-40 áfidos en un trozo de hoja extirpada de una planta de cultivo (método del corte de hoja). Las larvas se movieron al resto de la planta cuando el trozo de hoja se secó. Después de la preinfestación, se cubrió el suelo de la unidad de ensayo con una capa de arena.

25 Los compuestos de ensayo se formularon usando una solución que contenía 10% de acetona, 90% de agua y 300 ppm de tensioactivo no iónico X-77® Spreader Lo-Foam Formula que contenía alquilarilpolioxietileno, ácidos grasos libres, glicoles e isopropanol (Loveland Industries, Inc.). Los compuestos formulados se aplicaron en 1 ml de líquido a través de una boquilla atomizadora SUJ2 con un cuerpo normal 1/8 JJ (Spraying Systems Co.) colocado 1,27 cm (0,5 pulgadas) por encima de la parte superior de cada unidad de ensayo. Todos los compuestos experimentales de este estudio se pulverizaron a 250 ppm y se repitió la aplicación tres veces. Después de la pulverización del compuesto de prueba formulado, cada unidad de ensayo se dejó secar durante 1 hora y después se puso encima una tapa negra de vigilancia. Se mantuvieron las unidades de ensayo durante 6 días en una cámara de crecimiento a 19-21°C y 50-70% de humedad relativa. Se evaluó entonces visualmente la mortalidad de insectos en cada unidad de ensayo. De los compuestos probados, los siguientes dieron como resultado al menos 80% de mortalidad: 8, 9, 11, 12, 13, 19, 28 y 29.

PRUEBA F

40 Para evaluar el control del áfido del melón alodonero (*Aphis gossypii*) a través de medios de contacto y/o sistémicos, la unidad de ensayo consistió en un pequeño recipiente abierto con una planta de algodón de 6-7 días en el interior. Esta se preinfestó con 30-40 pulgones en un trozo de hoja conforme al método del corte de hoja descrito para la Prueba E, y se cubrió el suelo de la unidad de ensayo con una capa de arena.

Se formularon los compuestos de prueba y se pulverizaron 250 ppm como se describió para la Prueba E. Las aplicaciones se repitieron tres veces. Después de la pulverización, las unidades de ensayo se mantuvieron en una cámara de crecimiento y entonces se estimó visualmente como se describió para la Prueba E.

45 De los compuestos probados, los siguientes dieron como resultado al menos 80% de mortalidad: 8, 9, 11, 12, 13, 15, 16, 19 y 29.

PRUEBA G

50 Para evaluar el control del saltahoja (*Peregrinus maidis*) por de medios de contacto y/o sistémicos, la unidad de ensayo consistió en un pequeño recipiente abierto con una planta de maíz de 3-4 días (semilla) en el interior. Se añadió arena blanca en la parte de arriba del suelo antes de la aplicación. Los compuestos de ensayo se formularon y pulverizaron a 50 ppm, y se replicó tres veces según se describe para la Prueba E. Después de la pulverización, las unidades de ensayo se dejaron secar durante 1 hora antes de que fueran post-infestados con aproximadamente 10-20 ninfas (de 18 a 20 días) regándolas en la arena con un salero. Se colocó una tapa negra, de vigilancia en la parte superior del cilindro. Se mantuvieron las unidades de ensayo durante 6 días en una cámara de crecimiento a 19-21°C y 50-70% de humedad relativa. Se evaluó entonces visualmente la mortalidad de insectos en cada unidad

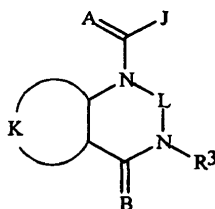
de ensayo. De los compuestos probados, los siguientes dieron como resultado al menos 80% de mortalidad: 12 y 13.

PRUEBA H

- 5 Para evaluar el control del saltahoja de la patata (*Empoasca fabae* Harris) por medios de contacto y/o sistémicos, la unidad de ensayo consistió en un pequeño recipiente abierto con una planta de judías Longio de 5-6 días (con las hojas primarias brotadas) en el interior. Se añadió arena blanca en la parte de arriba del suelo y se extirpó una de las hojas primarias antes de la aplicación. Se formularon los compuestos de prueba y se pulverizaron 250 ppm, y se repitió tres veces la aplicación como se describió para la Prueba E. Después de la pulverización, se dejaron secar las unidades de ensayo durante 1 hora antes de post-infestarlas con 5 saltahoja de la patata (adultos de 18 a 21 días).
- 10 Se colocó una tapa negra, de vigilancia en la parte superior del cilindro. Se mantuvieron las unidades de ensayo durante 6 días en una cámara de crecimiento a 19-21°C y 50-70% de humedad relativa. Se evaluó entonces visualmente la mortalidad de insectos en cada unidad de ensayo. De los compuestos probados, los siguientes dieron como resultado al menos 80% de mortalidad: 8, 9, 10, 11, 12, 13, 15, 16, 19, 24 y 29.

REIVINDICACIONES

1. Un compuesto seleccionado de la Fórmula I, que incluye todos los isómeros geométricos y estereoisómeros, N-óxidos, y sales agrícolamente adecuadas de los mismos,



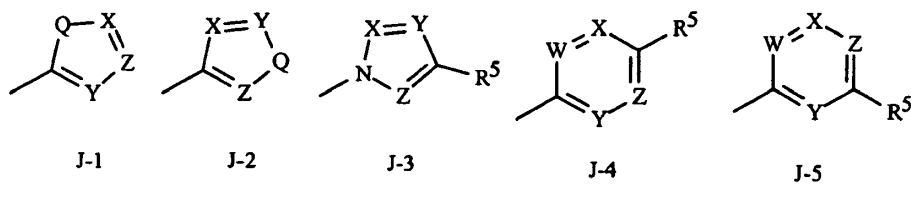
I

5 en la que

A y B son los dos O;

J es un anillo de fenilo que está opcionalmente sustituido con 1 a 4 sustituyentes seleccionados independientemente de R⁵; o

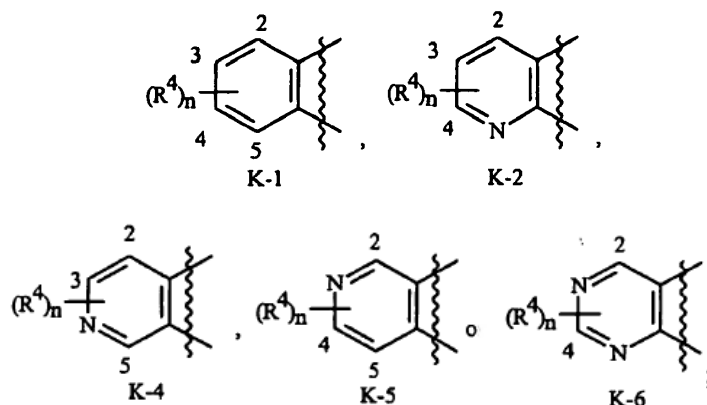
10 J es un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros seleccionado del grupo que consiste en J-1, J-2, J-3, J-4 y J-5, cada J opcionalmente sustituido con 1 a 3 sustituyentes seleccionados independientemente de R⁵



Q es O, S, NH o NR⁵;

W, X, Y y Z son independientemente N, CH o CR⁵, con la condición de que en J-4 y J-5 al menos uno de W, X, Y o Z sea N;

15 K es, junto con los dos átomos de carbono enlazantes contiguos, un anillo de fenilo condensado, un piridinilo condensado o un pirimidinilo condensado seleccionado del grupo que consiste en K-1, K-2, K-4, K-5 y K-6, cada uno sustituido con 1 grupo R⁴ en la posición 2 y opcionalmente sustituido con 0 a 3 sustituyentes adicionales seleccionados independientemente de R⁴



L es un enlace directo; o una cadena enlazante de 1 a 3 miembros seleccionada de carbono, nitrógeno, oxígeno y azufre, que incluye opcionalmente uno o dos miembros de cadena como C(=E), SO o S(O)₂, y sustituida opcionalmente con uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente de R¹³;

E es O, S o NR⁸;

- R^3 es H; G; alquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , cada uno opcionalmente sustituido con 1 a 5 sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste en G, halógeno, CN, NO_2 , hidroxilo, alcoxi C_1-C_4 , haloalcoxi C_1-C_4 , alquil(C_1-C_4)tio, alquil(C_1-C_4)sulfino, alquil(C_1-C_4)sulfonilo, alcoxi(C_2-C_6)carbonilo, alquil(C_2-C_6)carbonilo, trialquil(C_3-C_6)sililo, fenilo, fenoxi y anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, cada uno fenilo, fenoxi y anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros opcionalmente sustituido con uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente de R^6 ; o fenilo opcionalmente sustituido con 1 a 3 sustituyentes seleccionados independientemente de R^6 ;
- G es un anillo carbocíclico o heterocíclico no aromático de 5 o 6 miembros, que incluye opcionalmente uno o dos miembros de anillo seleccionados del grupo que consiste en $C(=O)$, SO y $S(O)_2$ y opcionalmente sustituido con 1 a 4 sustituyentes seleccionados independientemente de R^{12} ;
- el grupo R^4 unido al anillo K en la posición 2 es alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , halógeno, CN, NO_2 , alcoxi C_1-C_4 , haloalcoxi C_1-C_4 , alquil(C_1-C_4)tio, alquil(C_1-C_4)sulfino, alquil(C_1-C_4)sulfonilo, haloalquil(C_1-C_4)tio, haloalquil(C_1-C_4)sulfino o haloalquil(C_1-C_4)sulfonilo;
- cada R^4 adicional es independientemente alquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , haloalquenilo C_2-C_6 , haloalquinilo C_2-C_6 , halocicloalquilo C_3-C_6 , halógeno, CN, NO_2 , hidroxilo, alcoxi C_1-C_4 , haloalcoxi C_1-C_4 , alquil(C_1-C_4)tio, alquil(C_1-C_4)sulfino, alquil(C_1-C_4)sulfonilo, haloalquil(C_1-C_4)tio, haloalquil(C_1-C_4)sulfino, haloalquil(C_1-C_4)sulfonilo, alquil(C_1-C_4)amino, dialquil(C_2-C_8)amino, cicloalquil(C_3-C_6)amino, alcoxialquilo C_1-C_4 , hidroxialquilo C_1-C_4 , $C(O)R^{10}$, CO_2R^{10} , $C(O)NR^{10}R^{11}$, $NR^{10}R^{11}$, $N(R^{11})CO_2R^{10}$ o trialquil(C_3-C_6)sililo; o
- cada R^4 adicional es independientemente un fenilo, bencilo, fenoxi o un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, cada anillo opcionalmente sustituido con uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente de R^6 ;
- cada R^5 es independientemente halógeno, alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , CN, NO_2 , haloalcoxi C_1-C_4 , alquil(C_1-C_4)tio, alquil(C_1-C_4)sulfino, alquil(C_1-C_4)sulfonilo, haloalquil(C_1-C_4)tio, haloalquil(C_1-C_4)sulfino, haloalquil(C_1-C_4)sulfonilo o alcoxi(C_2-C_4)carbonilo; o
- cada R^5 es independientemente un anillo fenilo o un anillo heteroaromático de 5 ó 6 miembros, cada anillo opcionalmente sustituido con uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente entre R^6 ; o
- cuando J denota fenilo opcionalmente sustituido, R^5 puede denotar también alcoxi C_1-C_4 , o dos grupos R^5 cuando están unidos a átomos de carbono adyacentes pueden ser tomados juntos como $-OCF_2O-$, $-CF_2CF_2O-$ o $-OCF_2CF_2O-$;
- cada R^6 es independientemente alquilo C_1-C_4 , alquenilo C_2-C_4 , alquinilo C_2-C_4 , cicloalquilo C_3-C_6 , haloalquilo C_1-C_4 , haloalquenilo C_2-C_4 , haloalquinilo C_2-C_4 , halocicloalquilo C_3-C_6 , halógeno, CN, NO_2 , hidroxilo, alcoxi C_1-C_4 , haloalcoxi C_1-C_4 , alquil(C_1-C_4)tio, alquil(C_1-C_4)sulfino, alquil(C_1-C_4)sulfonilo, haloalquil(C_1-C_4)tio, haloalquil(C_1-C_4)sulfino, haloalquil(C_1-C_4)sulfonilo, alquil(C_1-C_4)amino, dialquil(C_2-C_8)amino, cicloalquil(C_3-C_6)amino, alquil(C_3-C_6)cicloalquilamino, alquil(C_2-C_4)carbonilo, alcoxi(C_2-C_6)carbonilo, alquil(C_2-C_6)aminocarbonilo, dialquil(C_3-C_8)aminocarbonilo o trialquil(C_3-C_6)sililo;
- R^8 es H; alquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 o cicloalquilo C_3-C_6 , cada uno opcionalmente sustituido con 1 a 5 sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste en halógeno, CN, NO_2 , hidroxilo, alcoxi C_1-C_4 , haloalcoxi C_1-C_4 , alquil(C_1-C_4)tio, alquil(C_1-C_4)sulfino, alquil(C_1-C_4)sulfonilo, alcoxi(C_2-C_6)carbonilo, alquil(C_2-C_6)carbonilo, trialquil(C_3-C_6)sililo, un anillo de fenilo y un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, cada anillo opcionalmente sustituido con uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente de R^6 ; CN; NO_2 ; alcoxi(C_2-C_6)carbonilo; alquil(C_1-C_4)sulfonilo; o fenilo o fenilsulfonilo opcionalmente sustituido con 1 a 3 sustituyentes seleccionados independientemente de R^6 ;
- cada R^{10} es independientemente H, alquilo C_1-C_4 o haloalquilo C_1-C_4 ;
- cada R^{11} es independientemente H o alquilo C_1-C_4 ;
- cada R^{12} es independientemente alquilo C_1-C_2 , halógeno, CN, NO_2 o alcoxi C_1-C_2 ;
- cada R^{13} es independientemente alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , halógeno, CN, COOH, alcoxi C_1-C_4 , haloalcoxi C_1-C_4 , alcoxi(C_2-C_6)carbonilo, alcoxi(C_2-C_6)carbonilalquilo; o
- cada R^{13} es un fenilo o un anillo heteroaromático de 5 o 6 miembros, cada anillo opcionalmente sustituido con uno a tres sustituyentes seleccionados independientemente de R^6 ; y n es 1, 2, 3 o 4.
2. Un compuesto según la reivindicación 1, en donde
- R^3 es alquilo C_1-C_4 opcionalmente sustituido con 1 a 5 sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste en halógeno, CN, OCH_3 y $S(O)_pCH_3$;

el grupo R^4 unido al anillo K en la posición 2 es CH_3 , CF_3 , OCF_3 , $OCHF_2$, $S(O)_pCF_3$, $S(O)_pCHF_2$, CN o halógeno;

un segundo R^4 opcional es F , Cl , Br , I , CN o CF_3 ;

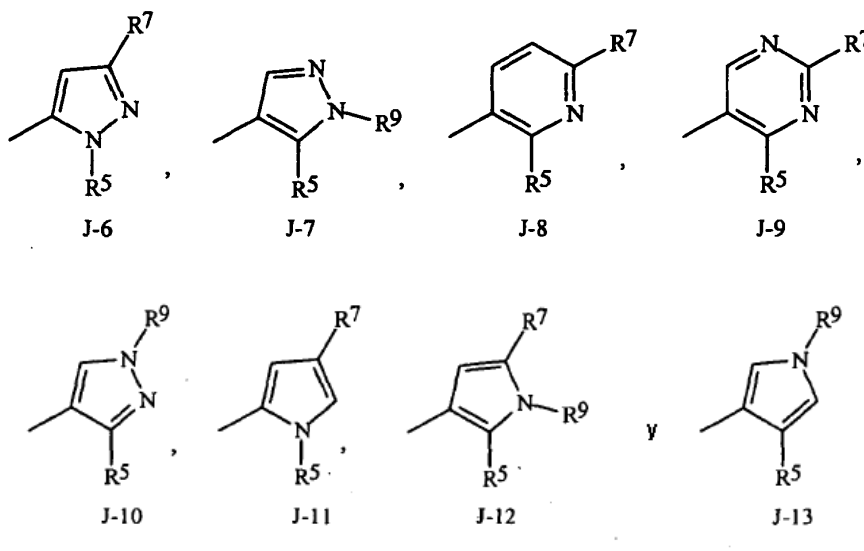
cada R^5 es independientemente halógeno, metilo, CF_3 , OCF_3 , $OCHF_2$, $S(O)_pCF_3$, $S(O)_pCHF_2$, OCH_2CF_3 , OCF_2CHF_2 , $S(O)_pCH_2CF_3$ o $S(O)_pCF_2CHF_2$; o un anillo fenilo, pirazol, imidazol, triazol, piridina o pirimidina, cada anillo opcionalmente sustituido con 1 a 3 sustituyentes seleccionados independientemente de alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , halógeno y CN ; y

p es 0, 1 ó 2.

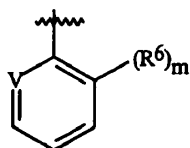
3. Un compuesto de la reivindicación 2 en donde R^3 es alquilo C_1-C_4 ;

4. Un compuesto según la reivindicación 1, en donde

10 J se selecciona del grupo que consiste en



R^5 es alquilo C_1-C_4 , haloalquilo C_1-C_4 , o



15 V es N , CH , CF , CCl , CBr o Cl ;

R^6 es alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , haloalquilo C_1-C_4 , halógeno, CN , alcoxi C_1-C_4 , haloalcoxi C_1-C_4 o haloalquil(C_1-C_4)tio;

R^7 es H , alquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , haloalquilo C_1-C_4 , halógeno, CN , alcoxi C_1-C_4 , haloalcoxi C_1-C_4 o haloalquil(C_1-C_4)tio;

20 R^9 es H , alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alqueno C_3-C_6 , haloalqueno C_3-C_6 , alquino C_3-C_6 o haloalquino C_3-C_6 ; con la condición de que R^7 y R^9 no sean los dos H ; y m es 0 o 1.

5. Un compuesto según la reivindicación 4, en donde V es N .

6. Un compuesto según la reivindicación 4, en donde V es CH , CF , CCl o CBr .

7. Un compuesto según la reivindicación 5 o la reivindicación 6, en donde

25 R^3 es H ; o alquilo C_1-C_4 opcionalmente sustituido con 1 a 5 sustituyentes seleccionados independientemente del grupo que consiste en halógeno, CN , OCH_3 y $S(O)_pCH_3$;

el grupo R^4 unido al anillo K en la posición 2 es CH_3 , CF_3 , OCF_3 , $OCHF_2$, $S(O)_pCF_3$, $S(O)_pCHF_2$, CN o halógeno;

un segundo R⁴ opcional es F, Cl, Br, I, CN o CF₃;

R⁶ es H, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, halógeno o CN;

R⁷ es H, CH₃, CF₃, OCHF₂, OCH₂CF₃ o halógeno; y

p es 0, 1 ó 2.

- 5 8. Un compuesto según la reivindicación 7, en donde R³ es H o alquilo C₁-C₄; y el grupo R⁴ unido a la posición 2 es CH₃, Cl, Br o I.
9. Un compuesto según la reivindicación 8, en donde J es J-6; R⁶ es halógeno; y R⁷ es halógeno o CF₃.
10. Un compuesto según la reivindicación 9, en donde V es N; R³ es H, metilo, etilo, isopropilo o butilo terciario; y R⁷ es Br, Cl o CF₃.
- 10 11. Un compuesto según la reivindicación 8, en donde J es J-7; R⁶ es halógeno; y R⁹ es CF₃, CHF₂, CH₂CF₃ o CF₂CHF₂.
12. Un compuesto según la reivindicación 8, en donde J es J-8; R⁶ es halógeno; y R⁷ es halógeno o CF₃.
13. Un compuesto según la reivindicación 8, en donde J es J-9; R⁶ es halógeno; y R⁷ es CF₃.
14. Un compuesto según la reivindicación 8, en donde J es J-10; R⁶ es halógeno; y R⁹ es CF₃, CHF₂, CH₂CF₃ o CF₂CHF₂.
- 15 15. Un compuesto según la reivindicación 8, en donde J es J-11; R⁶ es halógeno; y R⁷ es halógeno o CF₃.
16. Un compuesto según la reivindicación 8, en donde J es J-12; R⁶ es halógeno; R⁷ es H, halógeno o CF₃; y R⁹ es H, CF₃, CHF₂, CH₂CF₃ o CF₂CHF₂.
17. Un compuesto según la reivindicación 8, en donde J es J-13; R⁶ es halógeno; R⁷ es H, halógeno o CF₃; y R⁹ es H, CF₃, CHF₂, CH₂CF₃ o CF₂CHF₂.
- 20 18. El compuesto de la reivindicación 9, que se selecciona del grupo:
6-Bromo-1-[[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]carbonil]-8-metil-3-(1-metiletil)-2,4(1H,3H)-quinazolinadiona,
6-Bromo-1-[[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-il]carbonil]-3,8-dimetil-2,4(1H,3H)-quinazolinadiona,
25 6-Bromo-1-[[3-bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]carbonil]-3,8-dimetil-2,4(1H,3H)-quinazolinadiona,
1-[[3-Bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]carbonil]-2,3-dihidro-8-metil-3-(1-metiletil)-4(1H)-quinazolinona,
6,8-Dicloro-1-[[3-cloro-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]carbonil]-2,3-dihidro-3-(1-metiletil)-4(1H)-quinazolinona,
1-[[3-Bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]carbonil]-6,8-dicloro-2,3-dihidro-3-(1-metiletil)-4(1H)-quinazolinona,
6,8-Dicloro-1-[[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-il]carbonil]-2,3-dihidro-3-metil-4(1H)-quinazolinona,
30 6-Cloro-1-[[3-cloro-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]carbonil]-2,3-dihidro-8-metil-3-(1-metiletil)-4(1H)-quinazolinona,
1-[[3-Bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]carbonil]-6-cloro-2,3-dihidro-8-metil-3-(1-metiletil)-4(1H)-quinazolinona,
35 6,8-Dicloro-1-[[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-il]carbonil]-2,3-dihidro-3-(1-metiletil)-4(1H)-quinazolinona,
6,8-Dicloro-1-[[3-cloro-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]carbonil]-2,3-dihidro-3-metil-4(1H)-quinazolinona,
1-[[3-Bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]carbonil]-6,8-dicloro-2,3-dihidro-3-metil-4(1H)-quinazolinona,
6-Cloro-1-[[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-5-il]carbonil]-2,3-dihidro-8-metil-3-(1-metiletil)-4(1H)-quinazolinona,
40 6-Cloro-1-[[3-cloro-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]carbonil]-2,3-dihidro-3,8-dimetil-4(1H)-quinazolinona,
1-[[3-Bromo-1-(3-cloro-2-piridinil)-1H-pirazol-5-il]carbonil]-6-cloro-2,3-dihidro-3,8-dimetil-4(1H)-quinazolinona,

6-Cloro-1-[[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-5-il]carbonil]-2,3-dihidro-3,8-dimetil-4(1*H*)-quinazolinona,
6,8-Dicloro-1-[[1-(3-cloro-2-piridinil)-3-(trifluorometil)-1*H*-pirazol-5-il]carbonil]-2,3-dihidro-4(1*H*)-quinazolinona y
6,8-Dicloro-1-[[3-cloro-1-(3-cloro-2-piridinil)-1*H*-pirazol-5-il]carbonil]-2,3-dihidro-4(1*H*)-quinazolinona.

5 19. Una composición para controlar una plaga de invertebrados, que comprende una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 1 a 18 y al menos un componente adicional seleccionado del grupo que consiste en un tensioactivo, un diluyente sólido y un diluyente líquido.

20. Un método para controlar una plaga de invertebrados, que comprende poner en contacto la plaga de invertebrados o su medio con una cantidad biológicamente eficaz de un compuesto de cualquiera de las reivindicaciones 1 a 18.