

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 464 738**

51 Int. Cl.:

C07D 239/48 (2006.01)

C07D 401/12 (2006.01)

A01N 43/50 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **05.02.2010 E 10706500 (5)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **26.03.2014 EP 2398778**

54 Título: **Aminopirimidinamidas como plaguicidas**

30 Prioridad:

17.02.2009 EP 09152972

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

03.06.2014

73 Titular/es:

**BAYER CROPSCIENCE AG (100.0%)
Alfred-Nobel-Strasse 50
40789 Monheim , DE**

72 Inventor/es:

**MAECHLING, SIMON;
VOERSTE, ARND;
FRANKEN, EVA-MARIA;
BECKER, ANGELA;
GÖRGENS, ULRICH;
ES-SAYED, MAZEN;
HEIL, MARKUS;
HOLMWOOD, GRAHAM;
JANSEN, JOHANNES-RUDOLF;
SCHALLNER, OTTO;
EBBINGHAUS-KINTSCHER, ULRICH;
LÜMMEN, PETER;
CEREZO-GALVEZ, SILVIA;
KUDO, SACHIO;
HASHIHAYATA, TAKASHI;
SHIMOJO, EIICHI;
ICHIHARA, TERUYUKI;
ATAKA, MASASHI y
SHIBUYA, KATSUHIKO**

74 Agente/Representante:

CARPINTERO LÓPEZ, Mario

ES 2 464 738 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

Aminopirimidinamidas como plaguicidas

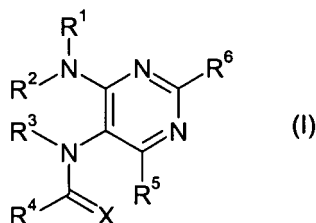
La presente solicitud se refiere a nuevas aminopirimidinamidas, a procedimientos para su preparación y a su uso como plaguicidas y, especialmente, como insecticidas y/o parasiticidas.

5 Los agentes fitoprotectores modernos deben cumplir muchas exigencias, por ejemplo con relación al nivel, la duración y la extensión de su actividad y uso posible. Cumplen un papel importante cuestiones sobre la toxicidad, combinabilidad con otros principios activos o con coadyuvantes de formulación, así como la cuestión del coste que puede representar la síntesis del principio activo. Además, pueden aparecer resistencias. Por todos estos motivos, la búsqueda de nuevos agentes fitoprotectores no se contempla como un asunto concluido y existe la necesidad constante de nuevos
10 compuestos con propiedades mejoradas en comparación con los compuestos conocidos, al menos con relación a aspectos individuales.

En el documento EP 0149200 se describen 2-fenilimidazoles y medicamentos que contienen estos compuestos. El documento EP 1221444 describe compuestos de imidazol condensados y su aplicación farmacéutica. El documento WO 1998/023597 da a conocer 4,5-diaminopirimidinas y un procedimiento para su preparación. Se describen o-
15 fenilendiaminas y sus aplicaciones farmacéuticas en el documento WO 2003/013484. En el documento WO 2004/037823 se dan a conocer compuestos de purina y su aplicación para el tratamiento de enfermedades. Del documento WO 2002/067684 se conocen determinadas piridilpirimidinas como plaguicidas. No obstante, no cumplen con todas las exigencias de forma suficiente.

Era objetivo de la presente invención proporcionar compuestos mediante los cuales se amplíe el espectro de los plaguicidas en diferentes aspectos.
20

El objetivo se logra, así como otros objetivos que no se mencionan explícitamente y que pueden derivarse o deducirse del contexto del presente documento, por medio de compuestos nuevos de fórmula (I),



en la que

25 R¹ representa un resto de la serie alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cianoalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₈ (en particular cicloalquilo C₃-C₆), halocicloalquilo C₃-C₈, cicloalqueno C₃-C₈, halocicloalqueno C₃-C₈, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-haloalquilo C₁-C₆, alquil C₁-C₆-carbonilalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-carbonilalquilo C₁-C₆, alquil C₁-C₆-sulfonilalquilo C₁-C₆, alquil C₁-C₆-sulfinalquilo C₁-C₆, alquil C₁-C₆-sulfonilalquilo C₁-C₆, haloalquil C₁-C₆-sulfonilalquilo C₁-C₆, haloalquil C₁-C₆-sulfinalquilo C₁-C₆, haloalquil C₁-C₆-sulfonilalquilo C₁-C₆, cicloalquil C₃-C₈-alquilo C₁-C₆, cicloalquil C₃-C₈-alquilo-C₁-C₆ halogenado, fenil-alquilo C₁-C₆, que dado el caso está monosustituido o polisustituido, con sustituyentes iguales o diferentes, con halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆-sulfanilo, alquil C₁-C₆-sulfinilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, haloalquil C₁-C₆-sulfanilo, haloalquil C₁-C₆-sulfinilo, haloalquil C₁-C₆-sulfonilo, nitro o ciano; heteroarilo, que dado el caso está monosustituido o polisustituido, con sustituyentes iguales o diferentes, con -OH, -SH, -NH₂, halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆-sulfanilo, alquil C₁-C₆-sulfinilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, haloalquil C₁-C₆-sulfanilo, haloalquil C₁-C₆-sulfinilo, haloalquil C₁-C₆-sulfonilo, mono-alquil C₁-C₆-amino, di-alquil C₁-C₆-amino, nitro o ciano; heteroaril-alquilo C₁-C₆, que dado el caso está monosustituido o polisustituido en la parte heteroaromática, con sustituyentes iguales o diferentes, con -OH, -SH, -NH₂, halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆-sulfanilo, alquil C₁-C₆-sulfinilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, haloalquil C₁-C₆-sulfanilo, haloalquil C₁-C₆-sulfinilo, haloalquil C₁-C₆-sulfonilo, mono-alquil C₁-C₆-amino, di-alquil C₁-C₆-amino, nitro o ciano; heterociclilo, que dado el caso está monosustituido o polisustituido, con sustituyentes iguales o diferentes, con -OH / =O, -SH / =S, -NH₂, halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆-sulfanilo, alquil C₁-C₆-sulfinilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, haloalquil C₁-C₆-sulfanilo, haloalquil C₁-C₆-sulfinilo, haloalquil C₁-C₆-sulfonilo, mono-alquil C₁-C₆-amino, di-alquil C₁-C₆-amino, nitro o ciano; heterociclil-alquilo C₁-C₆, que dado el caso está monosustituido o polisustituido en el heterociclo, con sustituyentes iguales o diferentes, con -OH / =O, -SH / =S, -NH₂, halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆,

alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆-sulfanilo, alquil C₁-C₆-sulfinito, alquil C₁-C₆-sulfonilo, haloalquil C₁-C₆-sulfanilo, haloalquil C₁-C₆-sulfinito, haloalquil C₁-C₆-sulfonilo, mono-alquil C₁-C₆-amino, di-alquil C₁-C₆-amino, nitro o ciano.

5 R² representa un resto de la serie hidrógeno, alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, haloalquilo C₁-C₆, ciano-alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₈ (en particular cicloalquilo C₃-C₆), halocicloalquilo C₃-C₈, cicloalqueno C₃-C₈, halocicloalqueno C₃-C₈, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, alquil C₁-C₆-carbonilalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-carbonilalquilo C₁-C₆, alquil C₁-C₆-sulfanilalquilo C₁-C₆, alquil C₁-C₆-sulfinilalquilo C₁-C₆, alquil C₁-C₆-sulfonilalquilo C₁-C₆, haloalquil C₁-C₆-sulfanilalquilo C₁-C₆, haloalquil C₁-C₆-sulfinilalquilo C₁-C₆, haloalquil C₁-C₆-sulfonilalquilo C₁-C₆, cicloalquil C₃-C₈-alquilo C₁-C₆, fenil- alquilo C₁-C₆, que
10 dado el caso está monosustituido o polisustituido en el anillo de fenilo, con sustituyentes iguales o diferentes, con halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆-sulfanilo, alquil C₁-C₆-sulfinito, alquil C₁-C₆-sulfonilo, haloalquil C₁-C₆-sulfanilo, haloalquil C₁-C₆-sulfinito, haloalquil C₁-C₆-sulfonilo, nitro o ciano; heteroarilo, que dado el caso está monosustituido o polisustituido, con sustituyentes iguales o
15 diferentes, con -OH, -SH, -NH₂, halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆-sulfanilo, alquil C₁-C₆-sulfinito, alquil C₁-C₆-sulfonilo, haloalquil C₁-C₆-sulfanilo, haloalquil C₁-C₆-sulfinito, haloalquil C₁-C₆-sulfonilo, mono-alquil C₁-C₆-amino, di-alquil C₁-C₆-amino, nitro o ciano; heteroaril-alquilo C₁-C₆, que dado el caso está monosustituido o polisustituido en la parte heteroaromática, con sustituyentes iguales o
20 diferentes, con -OH, -SH, -NH₂, halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆-sulfanilo, alquil C₁-C₆-sulfinito, alquil C₁-C₆-sulfonilo, haloalquil C₁-C₆-sulfanilo, haloalquil C₁-C₆-sulfinito, haloalquil C₁-C₆-sulfonilo, mono-alquil C₁-C₆-amino, di-alquil C₁-C₆-amino, nitro o ciano; heterociclilo, que dado el caso está monosustituido o polisustituido, con sustituyentes iguales o diferentes, con -OH / =O, -SH / =S, -NH₂,
25 halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆-sulfanilo, alquil C₁-C₆-sulfinito, alquil C₁-C₆-sulfonilo, haloalquil C₁-C₆-sulfanilo, haloalquil C₁-C₆-sulfinito, haloalquil C₁-C₆-sulfonilo, mono-alquil C₁-C₆-amino, di-alquil C₁-C₆-amino, nitro o ciano y heterocicilil-alquilo C₁-C₆, que dado el caso está monosustituido o polisustituido en el heterociclo, con sustituyentes iguales o diferentes, con -OH / =O, -SH / =S,
-NH₂, halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆-sulfanilo, alquil C₁-C₆-sulfinito, alquil C₁-C₆-sulfonilo, haloalquil C₁-C₆-sulfanilo, haloalquil C₁-C₆-sulfinito, haloalquil C₁-C₆-sulfonilo, mono-alquil C₁-C₆-amino, di-alquil C₁-C₆-amino, nitro o ciano.

30 R³ representa un resto de la serie hidrógeno, alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, haloalquilo C₁-C₆, ciano-alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, halocicloalquilo C₃-C₈, cicloalqueno C₃-C₈, halocicloalqueno C₃-C₈, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, alquil C₁-C₆-carbonilalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-carbonilalquilo C₁-C₆, alquil C₁-C₆-sulfanilalquilo C₁-C₆, alquil C₁-C₆-sulfinilalquilo C₁-C₆, alquil C₁-C₆-sulfonilalquilo C₁-C₆, cicloalquil C₃-C₈-alquilo C₁-C₆, fenilo, que dado el caso está monosustituido o polisustituido, con sustituyentes iguales o diferentes, con -
35 OH, -SH, -NH₂, halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆-sulfanilo, alquil C₁-C₆-sulfinito, alquil C₁-C₆-sulfonilo, mono-alquil C₁-C₆-amino, di-alquil C₁-C₆-amino, nitro o ciano; fenil-alquilo C₁-C₆, que dado el caso está monosustituido o polisustituido en el anillo de fenilo, con sustituyentes iguales o
40 diferentes, con halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, nitro o ciano; heteroarilo, que dado el caso está monosustituido o polisustituido, con sustituyentes iguales o diferentes, con -OH, -SH, -NH₂, halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆-sulfanilo, alquil C₁-C₆-sulfinito, alquil C₁-C₆-sulfonilo, mono-alquil C₁-C₆-amino, di-alquil C₁-C₆-amino, nitro o ciano; heteroaril-alquilo C₁-C₆, que dado el caso está monosustituido o polisustituido en la parte heteroaromática, con sustituyentes iguales o diferentes, con -OH, -
45 SH, -NH₂, halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆-sulfanilo, alquil C₁-C₆-sulfinito, alquil C₁-C₆-sulfonilo, mono-alquil C₁-C₆-amino, di-alquil C₁-C₆-amino, nitro o ciano; heterociclilo, que dado el caso está monosustituido o polisustituido, con sustituyentes iguales o diferentes, con -OH / =O, -SH / =S, -NH₂,
halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆-sulfanilo, alquil C₁-C₆-sulfinito, alquil C₁-C₆-sulfonilo, mono-alquil C₁-C₆-amino, di-alquil C₁-C₆-amino, nitro o ciano y heterocicilil-alquilo C₁-C₆, que dado el caso está monosustituido o polisustituido en el heterociclo, con sustituyentes iguales o diferentes, con -OH / =O,
-SH / =S, -NH₂, halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆-sulfanilo, alquil C₁-C₆-sulfinito, alquil C₁-C₆-sulfonilo, mono-alquil C₁-C₆-amino, di-alquil C₁-C₆-amino, nitro o ciano.

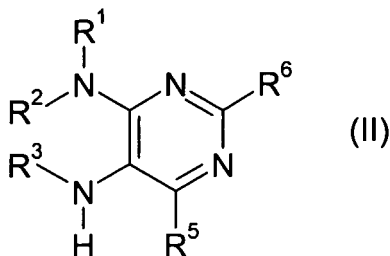
50 R⁴ representa un resto de la serie fenilo, 2-piridilo, 3-piridilo y pirazolilo, que en cada caso, dado el caso, está monosustituido o polisustituido, con sustituyentes iguales o diferentes, con restos de la serie halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₆, alcoxi
55 C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-alcoxi C₁-C₆, COOH, nitro, amino, ciano, alquil C₁-C₆-sulfanilo, alquil C₁-C₆-sulfinito, alquil C₁-C₆-sulfonilo, haloalquil C₁-C₆-sulfanilo, haloalquil C₁-C₆-sulfinito, haloalquil C₁-C₆-sulfonilo, mono-alquil C₁-C₆-amino, di-alquil C₁-C₆-amino, alquil C₁-C₆-aminocarbonilo, cicloalquil C₃-C₆-aminocarbonilo, fenilo (que, a su vez, puede estar sustituido con halógeno) y hetarilalquilo C₁-C₆ (en particular pirazolil-alquilo C₁-C₆ (que, a su vez, puede estar sustituido con halógeno, alquilo C₁-C₆ y haloalquilo C₁-C₆).

60 R⁵ representa un resto de la serie hidrógeno, halógeno, ciano, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, halocicloalquilo C₃-C₈, así como fenilo, 2-piridilo o 3-piridilo, que en cada caso, dado el caso, está monosustituido o polisustituido, con sustituyentes iguales o diferentes, con restos de la serie halógeno, amino, ciano, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆,

alqueno C₂-C₆, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-alcoxi C₁-C₆, nitro, ciano, alquil C₁-C₆-carbonilo, alquil
 C₁-C₆-carbonilamino, cicloalquil C₃-C₆-carbonilamino, alquil C₁-C₆-aminocarbonilo, cicloalquil C₃-C₆-
 5 aminocarbonilo, alcoxi C₁-C₆-carbonilo, aminocarbonilo, alcoxi C₁-C₆-iminoalquilo C₁-C₆, alquil C₁-C₆-sulfanilo,
 alquil C₁-C₆-sulfino, alquil C₁-C₆-sulfonilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo,
 alquil C₁-C₆-sulfonilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo,
 10 alquil C₁-C₆-sulfonilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo,
 alquil C₁-C₆-sulfonilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo,
 alquil C₁-C₆-sulfonilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo,
 alquil C₁-C₆-sulfonilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo,
 15 S(O)(=N-CN), S(O)(=N)R (en el que R representa alquilo C₁-C₆ o haloalquilo C₁-C₆), fenilo, fenilalquilo C₁-C₆,
 fenilalquil C₁-C₆-oxi, feniloxi, pirazolilo (pudiendo estar los grupos fenilo o pirazolilo, a su vez, sustituidos con halógeno,
 alquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, nitro, ciano, alquil C₁-C₆-sulfanilo, alquil C₁-C₆-sulfino,
 alquil C₁-C₆-sulfonilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo,
 20 alquil C₁-C₆-sulfonilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo,
 alquil C₁-C₆-sulfonilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo,
 alquil C₁-C₆-sulfonilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo,
 alquil C₁-C₆-sulfonilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo,
 alquil C₁-C₆-sulfonilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo,
 25 S(O)(=N-CN), S(O)(=N)R (en el que R representa alquilo C₁-C₆ o haloalquilo C₁-C₆), hetariloxi-alquilo C₁-C₆,
 hetariloxi y hetaril-alquilo C₁-C₆ (seleccionándose el resto hetarilo de la serie pirrolilo, imidazolilo, pirazolilo,
 triazolilo, piridilo, pirimidinilo y tetrazolilo y pudiendo estar sustituido, a su vez, con halógeno, ciano, alquilo
 C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, halocicloalquilo C₃-C₈) y pudiendo representar dos sustituyentes
 adyacentes también conjuntamente -OCH₂O-, -OCF₂O- o -OCH₂CH₂O-,
 R⁶ representa un resto de la serie hidrógeno, halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, ciano-alquilo C₁-C₆,
 alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, alquil C₁-C₆-carbonilo, haloalquil C₁-C₆-carbonilo, cicloalquilo C₃-C₈, halocicloalquilo
 C₃-C₈, cicloalquil C₃-C₈-alquilo C₁-C₆, alquil C₁-C₆-sulfanilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, alqueno C₂-C₆, alqueno C₂-
 C₆, alcoxi C₁-C₆-carbonilo, alqueno C₂-C₆-oxicarbonilo, alqueno C₂-C₆-oxicarbonilo, alcoxi C₁-C₆-carbonilalquilo
 C₁-C₆; fenilo, fenil-alquilo C₁-C₆, que en cada caso, dado el caso, está monosustituido o polisustituido en el anillo
 20 de fenilo, con sustituyentes iguales o diferentes, con halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆,
 nitro o ciano; heterocicli-alquilo C₁-C₆, que dado el caso está monosustituido o polisustituido en el heterociclo,
 con sustituyentes iguales o diferentes, con halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, nitro o ciano;
 heteroarilalquilo C₁-C₆, que dado el caso está monosustituido o polisustituido en la parte heteroaromática, con
 sustituyentes iguales o diferentes, con halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, nitro o ciano; o
 25 fenilcarbonilo, que dado el caso está monosustituido o polisustituido en el anillo de fenilo, con sustituyentes
 iguales o diferentes, con halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, nitro o ciano.

X representa oxígeno o azufre.

Se ha descubierto también que se pueden preparar compuestos de la fórmula (I) (procedimiento 1) haciendo reaccionar compuestos de la fórmula (II)



30 en la que

R¹, R², R³, R⁵ y R⁶ tienen los significados indicados anteriormente, con un compuesto de la fórmula (III)

R⁴ CXHal (III)

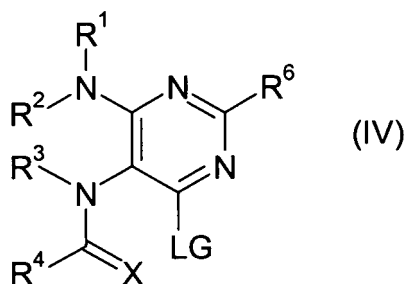
en la que

35 X tiene el significado indicado anteriormente y

Hal representa halógeno, en particular cloro,

en presencia de un diluyente y en presencia de una base.

Se pueden preparar compuestos de la fórmula (I) (procedimiento 2) haciendo reaccionar compuestos de la fórmula (IV)

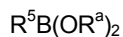


en la que

R^1 , R^2 , R^3 , R^5 y R^6 tienen los significados indicados anteriormente y

LG representa cloro, bromo, yodo o alquilsulfonilo,

5 con ácidos borónicos o ésteres de ácidos borónicos de la fórmula (V)



en la que

R^5 tiene los significados indicados anteriormente y

R^a representa hidrógeno o alquilo (en particular alquilo C_1-C_4),

10 en presencia de un diluyente, de un catalizador de paladio y de una base (reacción de Suzuki).

Finalmente, se ha descubierto que los nuevos compuestos de la fórmula (I) poseen propiedades biológicas notables y son adecuados, sobre todo, para combatir parásitos animales, en particular insectos, arácnidos y nematodos presentes en agricultura, en silvicultura, en protección de productos y materiales, así como en el sector de la higiene.

15 Los compuestos de la fórmula (I) pueden presentarse, dado el caso, en función del tipo de sustituyentes tales como isómeros geométricos y/o con actividad óptica o como mezclas de los isómeros correspondientes o en diversas formas tautómeras en composiciones diferentes. La invención se refiere, por lo tanto, a isómeros puros y también a mezclas de isómeros.

20 Los compuestos de la fórmula (I) pueden presentarse, dado el caso, en formas polimorfas diferentes o como mezcla de distintas formas polimorfas. Tanto los polimorfos puros como también las mezclas de polimorfos son objeto de la presente invención y pueden usarse según la invención.

Los compuestos según la invención se definen, en general, por medio de la fórmula (I).

Sustituyentes o intervalos preferentes de los restos indicados de las fórmulas mencionadas anteriormente y en adelante se exponen a continuación.

25 R^1 representa preferentemente un resto de la serie alquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_8 (en particular cicloalquilo C_3-C_6), halocicloalquilo C_3-C_8 , cicloalquenilo C_3-C_8 , alcoxi C_1-C_6 -alquilo C_1-C_6 , alquil C_1-C_6 -sulfanilalquilo C_1-C_6 , alquil C_1-C_6 -carbonilalquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 -carbonilalquilo C_1-C_6 , cicloalquil C_3-C_8 -alquilo C_1-C_6 , cicloalquil C_3-C_8 -alquilo- C_1-C_6 halogenado, fenil-alquilo C_1-C_6 , que dado el caso está monosustituido o polisustituido en el anillo de fenilo, con sustituyentes iguales o diferentes, con halógeno, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , nitro o ciano; heteroarilo, que dado el caso está monosustituido o polisustituido, con sustituyentes iguales o diferentes, con -OH, -SH, -NH₂, halógeno, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , alquil C_1-C_6 -sulfanilo, alquil C_1-C_6 -sulfinilo, alquil C_1-C_6 -sulfonilo, mono-alquil C_1-C_6 -amino, di-alquil C_1-C_6 -amino, nitro o ciano; heteroaril-alquilo C_1-C_6 , que dado el caso está monosustituido o polisustituido en la parte heteroaromática, con sustituyentes iguales o diferentes, con -OH, -SH, -NH₂, halógeno, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , alquil C_1-C_6 -sulfanilo, alquil C_1-C_6 -sulfinilo, alquil C_1-C_6 -sulfonilo, mono-alquil C_1-C_6 -amino, di-alquil C_1-C_6 -amino, nitro o ciano; heterociclil-alquilo C_1-C_6 , que dado el caso está monosustituido o polisustituido en el heterociclo, con sustituyentes iguales o diferentes, con -OH / =O, -SH / =S, -NH₂, halógeno, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , alquil C_1-C_6 -sulfanilo, alquil C_1-C_6 -sulfinilo, alquil C_1-C_6 -sulfonilo, mono-alquil C_1-C_6 -amino, di-alquil C_1-C_6 -amino, nitro o ciano.

40 R^2 representa preferentemente un resto de la serie hidrógeno, alquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_8 (en particular cicloalquilo C_3-C_6), halocicloalquilo C_3-C_8 , cicloalquenilo C_3-C_8 , alcoxi C_1-C_6 -alquilo C_1-C_6 , alquil C_1-C_6 -carbonilalquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 -carbonilalquilo C_1-C_6 , fenil-alquilo C_1-

5 C₆, que dado el caso está monosustituido o polisustituido en el anillo de fenilo, con sustituyentes iguales o diferentes, con halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, nitro o ciano; heteroarilo, que dado el caso está monosustituido o polisustituido, con sustituyentes iguales o diferentes, con -OH, -SH, -NH₂, halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆-sulfanilo, alquil C₁-C₆-sulfinilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, mono-alquil C₁-C₆-amino, di-alquil C₁-C₆-amino, nitro o ciano; heteroaril-alquilo C₁-C₆, que dado el caso está monosustituido o polisustituido en la parte heteroaromática, con sustituyentes iguales o diferentes, con -OH, -SH, -NH₂, halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆-sulfanilo, alquil C₁-C₆-sulfinilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, mono-alquil C₁-C₆-amino, di-alquil C₁-C₆-amino, nitro o ciano; heterocicli-alquilo C₁-C₆, que dado el caso está monosustituido o polisustituido en el heterociclo, con sustituyentes iguales o diferentes, con -OH / =O, -SH / =S, -NH₂, halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆-sulfanilo, alquil C₁-C₆-sulfinilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, mono-alquil C₁-C₆-amino, di-alquil C₁-C₆-amino, nitro o ciano.

15 R³ representa preferentemente un resto de la serie hidrógeno, alquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₈ (en particular cicloalquilo C₃-C₆), halocicloalquilo C₃-C₈, cicloalqueno C₃-C₈, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, alquil C₁-C₆-carbonilalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-carbonilalquilo C₁-C₆, fenil-alquilo C₁-C₆, que dado el caso está monosustituido o polisustituido en el anillo de fenilo, con sustituyentes iguales o diferentes, con halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, nitro o ciano; heteroarilo, que dado el caso está monosustituido o polisustituido, con sustituyentes iguales o diferentes, con -OH, -SH, -NH₂, halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆-sulfanilo, alquil C₁-C₆-sulfinilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, mono-alquil C₁-C₆-amino, di-alquil C₁-C₆-amino, nitro o ciano; heteroaril-alquilo C₁-C₆, que dado el caso está monosustituido o polisustituido en la parte heteroaromática, con sustituyentes iguales o diferentes, con -OH, -SH, -NH₂, halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆-sulfanilo, alquil C₁-C₆-sulfinilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, mono-alquil C₁-C₆-amino, di-alquil C₁-C₆-amino, nitro o ciano; heterocicli-alquilo C₁-C₆, que dado el caso está monosustituido o polisustituido en el heterociclo, con sustituyentes iguales o diferentes, con -OH / =O, -SH / =S, -NH₂, halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆-sulfanilo, alquil C₁-C₆-sulfinilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, mono-alquil C₁-C₆-amino, di-alquil C₁-C₆-amino, nitro o ciano.

30 R⁴ representa preferentemente, 3-piridilo y pirazolilo, que en cada caso, dado el caso, está monosustituido o polisustituido, con sustituyentes iguales o diferentes, con restos de la serie halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-alcoxi C₁-C₆, COOH, nitro, amino, mono-alquil C₁-C₆-amino, di-alquil C₁-C₆-amino, alquil C₁-C₆-aminocarbonilo y cicloalquil C₃-C₆-aminocarbonilo.

R⁴ también representa preferentemente pirazolilo, que dado el caso está sustituido con halógeno o alquilo C₁-C₆, fenilo (que a su vez pueden estar sustituido con halógeno) o con pirazolilmetilo (que a su vez puede estar sustituido con haloalquilo C₁-C₆).

35 R⁵ representa preferentemente fenilo, 2-piridilo o 3-piridilo (en particular fenilo), que en cada caso, dado el caso, está monosustituido o polisustituido, con sustituyentes iguales o diferentes, con restos de la serie halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-alcoxi C₁-C₆, nitro, amino, ciano, monoalquil C₁-C₆-amino, dialquil C₁-C₆-amino, alquil C₁-C₆-sulfanilo, alquil C₁-C₆-sulfinilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, haloalquil C₁-C₆-sulfanilo, haloalquil C₁-C₆-sulfinilo, haloalquil C₁-C₆-sulfonilo, hetariloxi-alquilo C₁-C₆, hetariloxi y hetaril-alquilo C₁-C₆, seleccionándose el resto hetarilo de la serie pirrolilo, imidazolilo, pirazolilo, triazolilo, piridilo, pirimidinilo y tetrazolilo y pudiendo estar sustituido, a su vez, con halógeno, ciano, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, halocicloalquilo C₃-C₈.

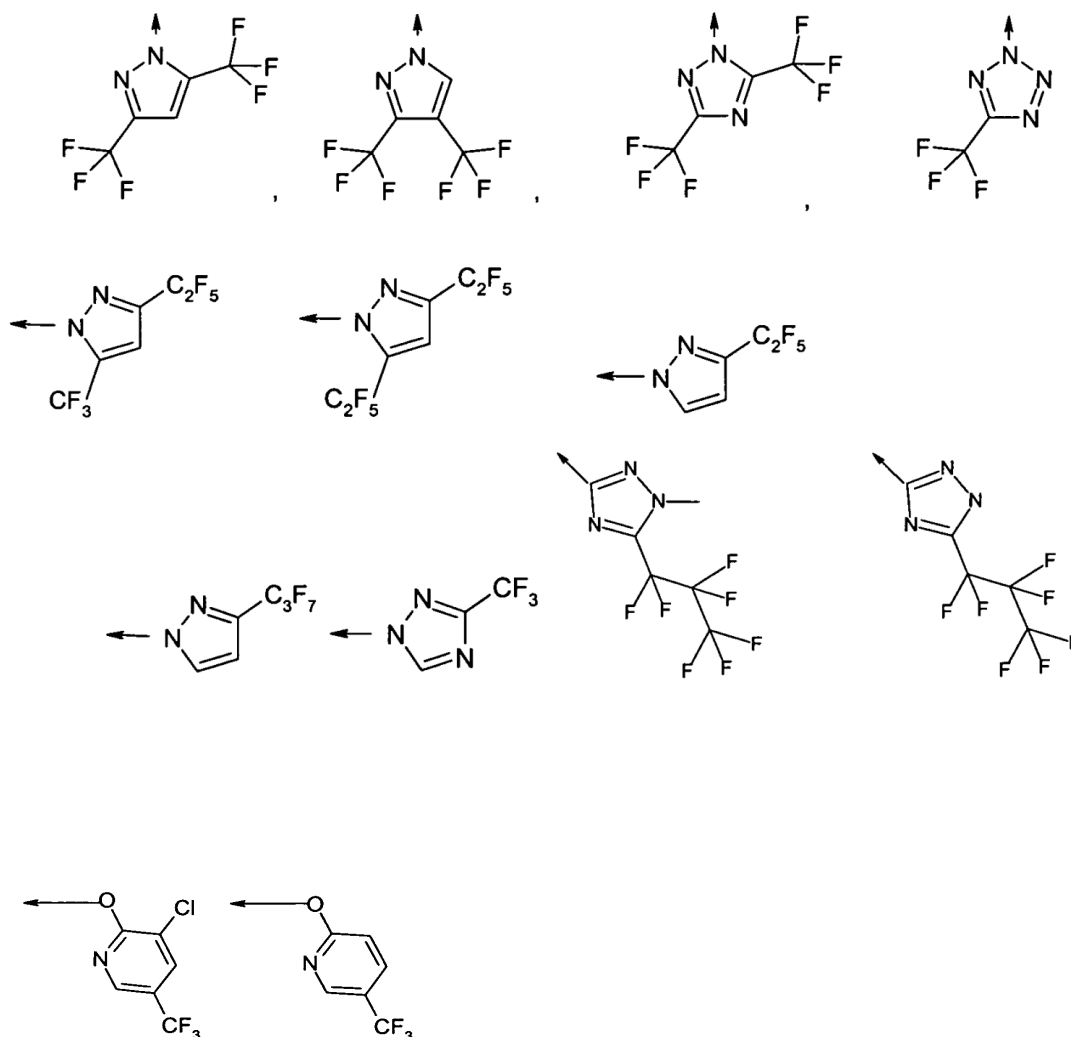
R⁵ representa preferentemente hidrógeno, halógeno, alquilo C₁-C₄ y cicloalquilo C₃-C₆.

45 R⁶ representa preferentemente un resto de la serie hidrógeno, halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, alquil C₁-C₆-carbonilo, haloalquil C₁-C₆-carbonilo, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₆, alquil C₁-C₆-sulfanilo, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, alcoxi C₁-C₆-carbonilo, alqueno C₂-C₆-oxicarbonilo, alquil C₁-C₆-oxicarbonilo, alcoxi C₁-C₆-carbonilalquilo C₁-C₆; fenilo, fenil-alquilo C₁-C₆, que en cada caso, dado el caso, está monosustituido o polisustituido en el anillo de fenilo, con sustituyentes iguales o diferentes, con halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, nitro o ciano; heterocicli-alquilo C₁-C₆, que dado el caso está monosustituido o polisustituido en el heterociclo, con sustituyentes iguales o diferentes, con halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, nitro o ciano; y fenilcarbonilo, que dado el caso está monosustituido o polisustituido en el anillo de fenilo, con sustituyentes iguales o diferentes, con halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, nitro o ciano.

X representa preferentemente oxígeno o azufre.

55 R¹ representa de modo particularmente preferente un resto de la serie alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alqueno C₂-C₆, alquino C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, alquil C₁-C₆-sulfanilalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-carbonilalquilo C₁-C₆ y cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₆ y cicloalquil C₃-C₆-alquilo-C₁-C₆ halogenado, en particular ciclopropilo.

- R² representa de modo particularmente preferente hidrógeno,
- R³ representa de modo particularmente preferente hidrógeno,
- 5 R⁴ representa de modo particularmente preferente, 3-piridilo que, dado el caso, está monosustituido o polisustituido con restos de la serie halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆-aminocarbonilo y cicloalquil C₃-C₆-aminocarbonilo.
- 10 R⁴ también representa de modo particularmente preferente pirazolilo (preferentemente 3-pirazolilo), que dado el caso está sustituido con halógeno (preferentemente F, Cl, Br) y alquilo C₁-C₆ (preferentemente metilo, etilo y propilo), fenilo (que a su vez pueden estar sustituido con halógeno) o con pirazolilmetilo (que a su vez puede estar sustituido con haloalquilo C₁-C₆, en particular alquilo C₁-C₆ fluorado).
- 15 R⁵ representa de modo particularmente preferente un resto de la serie fenilo, 2-piridilo o 3-piridilo (en particular fenilo), que en cada caso, dado el caso, está monosustituido o polisustituido, con sustituyentes iguales o diferentes, con al menos un resto de la serie halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, nitro, ciano, alquil C₁-C₆-sulfanilo, alquil C₁-C₆-sulfinilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, haloalquil C₁-C₆-sulfanilo, haloalquil C₁-C₆-sulfinilo, haloalquil C₁-C₆-sulfonilo, hetariloxi-alquilo C₁-C₆, hetariloxi y hetaril-alquilo C₁-C₆, seleccionándose el resto hetarilo de la serie pirrolilo, imidazolilo, pirazolilo, triazolilo, piridilo, pirimidinilo y tetrazolilo y pudiendo estar sustituido, a su vez, con sustituyentes de la serie de halógeno, ciano, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, halocicloalquilo C₃-C₈.
- 20 R⁵ también representa de modo particularmente preferente un resto de la serie hidrógeno, halógeno, alquilo C₁-C₄ y cicloalquilo C₃-C₆.
- R⁶ representa de modo particularmente preferente un resto de la serie hidrógeno, halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alquil C₁-C₆-sulfanilo y fenilo, que puede estar sustituido con halógeno.
- X representa de modo particularmente preferente oxígeno.
- 25 R¹ representa de modo destacado un resto de la serie CH₃, CH₂CH₃, CH(CH₃)₂, ciclopropilo, halociclopropilo, C(CH₃)₃, CH(CH₃)CH₂SCH₃, CH₂CH₂CH₃, CH(CH₃)CH₂CH₃, CH₂CF₃, CHCH₃CF₃, CH(CH₃)ciclopropilo y de modo particularmente destacado ciclopropilo.
- R² representa de modo destacado hidrógeno.
- R³ representa de modo destacado hidrógeno.
- 30 R⁴ representa de modo destacado 3-piridilo, que está sustituido en la posición 2 con un sustituyente de la serie F, Cl, Br, metilo, etilo, CF₃, CH₂CF₃, CHFCH₃, CHF₂CF₃, ciclopropilo y ciclopropilmetilo.
- R⁴ representa también de modo destacado pirazolilo (preferentemente 3-pirazolilo), que puede estar sustituido con F, Cl, metilo, etilo o con pirazolilmetilo, que a su vez puede estar sustituido con haloalquilo C₁-C₆, en particular con CF₃.
- 35 R⁵ representa de modo destacado fenilo, que está monosustituido o polisustituido con un resto de la serie CH₃, F, Cl, CF₃, CF(CF₃)₂, OCH₃, OCF₃, NO₂, CN, SCF₃, S(O)CF₃ y S(O)₂CF₃ y CH₂-Q.
- Q representa un resto de la serie



en los que la fecha indica la posición de unión con el grupo CH₂.

R⁶ representa de modo destacado hidrógeno.

- 5 En las definiciones preferentes, mientras no se indique lo contrario,

halógeno (también en restos tales como, por ejemplo, haloalquilo) se selecciona de la serie flúor, cloro, bromo y yodo, también preferentemente de la serie flúor, cloro y bromo,

- heteroarilo o hetarilo (también como parte de una unidad superior, tal como por ejemplo heteroarilalquilo) se selecciona de la serie furilo, tienilo, pirrolilo, pirazolilo, imidazolilo, 1,2,3-triazolilo, 1,2,4-triazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, 1,2,3-oxadiazolilo, 1,2,4-oxadiazolilo, 1,3,4-oxadiazolilo, 1,2,5-oxadiazolilo, 1,2,3-tiadiazolilo, 1,2,4-tiadiazolilo, 1,3,4-tiadiazolilo, 1,2,5-tiadiazolilo, piridilo, pirimidinilo, piridazinilo, pirazinilo, 1,2,3-triazinilo, 1,2,4-triazinilo, 1,3,5-triazinilo, tetrazoilo, benzofurilo, bencisofurilo, benzotienilo, bencisotienilo, indolilo, isoindolilo, indazolilo, benzotiazolilo, bencisotiazolilo, benzoxazolilo, bencisoxazolilo, bencimidazolilo, 2,1,3-benzoxadiazol, quinolinilo, isoquinolinilo, cinnolinilo, ftalazinilo, quinazolinilo, quinoxalinilo, naftiridinilo, benzotriazinilo, purinilo, pteridinilo e indolizínilo,

- heterociclilo (también como parte de una unidad superior, tal como, por ejemplo heterociclilalquilo) se selecciona de la serie 2-tetrahidrofuranilo, 3-tetrahidrofuranilo, 2-tetrahidrotienilo, 3-tetrahidrotienilo, 2-pirrolidinilo, 3-pirrolidinilo, 3-isoxazolidinilo, 4-isoxazolidinilo, 5-isoxazolidinilo, 3-isotiazolidinilo, 4-isotiazolidinilo, 5-isotiazolidinilo, 3-pirazolidinilo, 4-pirazolidinilo, 5-pirazolidinilo, 2-oxazolidinilo, 4-oxazolidinilo, 5-oxazolidinilo, 2-tiazolidinilo, 4-tiazolidinilo, 5-tiazolidinilo, 2-imidazolidinilo, 4-imidazolidinilo, 1,2,4-oxadiazolidin-3-ilo, 1,2,4-oxadiazolidin-5-ilo, 1,2,4-tiadiazolidin-3-ilo, 1,2,4-tiadiazolidin-5-ilo, 1,2,4-triazolidin-3-ilo, 1,3,4-oxadiazolidin-2-ilo, 1,3,4-tiadiazolidin-2-ilo, 1,3,4-triazolidin-2-ilo, 2,3-dihidrofur-2-ilo, 2,3-dihidrofur-3-ilo, 2,4-dihidrofur-2-ilo, 2,3-dihidrotien-2-ilo, 2,3-dihidrotien-3-ilo, 2,4-dihidrotien-2-ilo, 2-pirrolin-2-ilo, 2-pirrolin-3-ilo, 3-pirrolin-2-ilo, 3-pirrolin-3-ilo, 2-isoxazolin-3-ilo, 3-isoxazolin-3-ilo, 4-isoxazolin-3-ilo, 2-

isoxazolin-4-ilo, 3-isoxazolin-4-ilo, 4-isoxazolin-4-ilo, 2-isoxazolin-5-ilo, 3-isoxazolin-5-ilo, 4-isoxazolin-5-ilo, 2-isotiazolin-3-ilo, 3-isotiazolin-3-ilo, 4-isotiazolin-3-ilo, 2-isotiazolin-4-ilo, 3-isotiazolin-4-ilo, 4-isotiazolin-4-ilo, 2-isotiazolin-5-ilo, 3-isotiazolin-5-ilo, 4-isotiazolin-5-ilo, 2,3-dihidropirazol-1-ilo, 2,3-dihidropirazol-2-ilo, 2,3-dihidropirazol-3-ilo, 2,3-dihidropirazol-4-ilo, 2,3-dihidropirazol-5-ilo, 3,4-dihidropirazol-1-ilo, 3,4-dihidropirazol-3-ilo, 3,4-dihidropirazol-4-ilo, 3,4-dihidropirazol-5-ilo, 4,5-dihidropirazol-1-ilo, 4,5-dihidropirazol-3-ilo, 4,5-dihidropirazol-4-ilo, 4,5-dihidropirazol-5-ilo, 2,3-dihidrooxazol-2-ilo, 2,3-dihidrooxazol-3-ilo, 2,3-dihidrooxazol-4-ilo, 2,3-dihidrooxazol-5-ilo, 3,4-dihidrooxazol-2-ilo, 3,4-dihidrooxazol-3-ilo, 3,4-dihidrooxazol-4-ilo, 3,4-dihidrooxazol-5-ilo, 3,4-dihidrooxazol-2-ilo, 3,4-dihidrooxazol-3-ilo, 3,4-dihidrooxazol-4-ilo, 2-piperidinilo, 3-piperidinilo, 4-piperidinilo, 1,3-dioxan-5-ilo, 2-tetrahidropiranilo, 4-tetrahidropiranilo, 2-tetrahidrotienilo, 3-hexahidropiridazinilo, 4-hexahidropiridazinilo, 2-hexahidropirimidinilo, 4-hexahidropirimidinilo, 5-hexahidropirimidinilo, 2-piperazinilo, 1,3,5-hexahidrotriazin-2-ilo y 1,2,4-hexahidrotriazin-3-ilo.

En las definiciones particularmente preferentes, mientras no se indique lo contrario,

halógeno se selecciona de la serie flúor, cloro, bromo y yodo, también preferentemente de la serie flúor, cloro y bromo,

heteroarilo o hetarilo (también como parte de una unidad superior, tal como por ejemplo heteroarilalquilo) se selecciona de la serie pirimidilo, oxadiazolilo, oxazolilo, pirazinilo, imidazolilo, tiazolilo y furanilo, pirrolilo, pirazolilo, 1,2,3-triazolilo, 1,2,4-triazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, 1,2,3-oxadiazolilo, 1,2,4-oxadiazolilo, 1,3,4-oxadiazolilo, 1,2,5-oxadiazolilo, 1,2,3-tiadiazolilo, 1,2,4-tiadiazolilo, 1,3,4-tiadiazolilo, 1,2,5-tiadiazolilo, piridilo, pirimidinilo, piridazinilo, pirazinilo, 1,2,3-triazinilo, 1,2,4-triazinilo, 1,3,5-triazinilo, tetrazolilo,

heterociclilo (también como parte de una unidad superior, tal como, por ejemplo heterocicilalquilo) se selecciona de la serie 2-tetrahidrofuranilo, 3-tetrahidrofuranilo, 2-tetrahidrotienilo, 3-tetrahidrotienilo, 2-pirrolidinilo, 3-pirrolidinilo, 3-isoxazolidinilo, 4-isoxazolidinilo, 5-isoxazolidinilo, 3-isotiazolidinilo, 4-isotiazolidinilo, 5-isotiazolidinilo, 3-pirazolidinilo, 4-pirazolidinilo, 5-pirazolidinilo, 2-oxazolidinilo, 4-oxazolidinilo, 5-oxazolidinilo, 2-tiazolidinilo, 4-tiazolidinilo, 5-tiazolidinilo, 2-imidazolidinilo, 4-imidazolidinilo, 1,2,4-oxadiazolidin-3-ilo, 1,2,4-oxadiazolidin-5-ilo, 1,2,4-tiadiazolidin-3-ilo, 1,2,4-tiadiazolidin-5-ilo, 1,2,4-triazolidin-3-ilo, 1,3,4-oxadiazolidin-2-ilo, 1,3,4-tiadiazolidin-2-ilo, 1,3,4-triazolidin-2-ilo, 2,3-dihidrofur-2-ilo, 2,3-dihidrofur-3-ilo, 2,4-dihidrofur-2-ilo, 2,3-dihidrotien-2-ilo, 2,3-dihidrotien-3-ilo, 2,4-dihidrotien-2-ilo, 2-pirrolin-2-ilo, 2-pirrolin-3-ilo, 3-pirrolin-2-ilo, 3-pirrolin-3-ilo, 2-isoxazolin-3-ilo, 3-isoxazolin-3-ilo, 4-isoxazolin-3-ilo, 2-isoxazolin-4-ilo, 3-isoxazolin-4-ilo, 4-isoxazolin-4-ilo, 2-isoxazolin-5-ilo, 3-isoxazolin-5-ilo, 4-isoxazolin-5-ilo, 2-isotiazolin-3-ilo, 3-isotiazolin-3-ilo, 4-isotiazolin-3-ilo, 2-isotiazolin-4-ilo, 3-isotiazolin-4-ilo, 4-isotiazolin-4-ilo, 2-isotiazolin-5-ilo, 3-isotiazolin-5-ilo, 4-isotiazolin-5-ilo, 2,3-dihidropirazol-1-ilo, 2,3-dihidropirazol-2-ilo, 2,3-dihidropirazol-3-ilo, 2,3-dihidropirazol-4-ilo, 2,3-dihidropirazol-5-ilo, 3,4-dihidropirazol-1-ilo, 3,4-dihidropirazol-3-ilo, 3,4-dihidropirazol-4-ilo, 3,4-dihidropirazol-5-ilo, 4,5-dihidropirazol-1-ilo, 4,5-dihidropirazol-3-ilo, 4,5-dihidropirazol-4-ilo, 4,5-dihidropirazol-5-ilo, 2,3-dihidrooxazol-2-ilo, 2,3-dihidrooxazol-3-ilo, 2,3-dihidrooxazol-4-ilo, 2,3-dihidrooxazol-5-ilo, 3,4-dihidrooxazol-2-ilo, 3,4-dihidrooxazol-3-ilo, 3,4-dihidrooxazol-4-ilo, 3,4-dihidrooxazol-5-ilo, 3,4-dihidrooxazol-2-ilo, 3,4-dihidrooxazol-3-ilo, 3,4-dihidrooxazol-4-ilo, 2-piperidinilo, 3-piperidinilo, 4-piperidinilo, 1,3-dioxan-5-ilo, 2-tetrahidropiranilo, 4-tetrahidropiranilo, 2-tetrahidrotienilo, 3-hexahidropiridazinilo, 4-hexahidropiridazinilo, 2-hexahidropirimidinilo, 4-hexahidropirimidinilo, 5-hexahidropirimidinilo, 2-piperazinilo, 1,3,5-hexahidrotriazin-2-ilo y 1,2,4-hexahidrotriazin-3-ilo.

Los restos sustituidos con halógeno, por ejemplo haloalquilo, están monohalogenados o polihalogenados hasta el máximo número de sustituyentes posible. En el caso de halogenación múltiple, los átomos de halógeno pueden ser iguales o diferentes. A este respecto, halógeno representa flúor, cloro, bromo y yodo, en particular flúor, cloro y bromo.

Las definiciones o explicaciones de restos indicadas anteriormente en general o en los intervalos de preferencia mencionados tienen validez para los productos finales y para los productos de partida e intermedios correspondientes. Estas definiciones de restos pueden combinarse discrecionalmente entre ellas, aunque también entre los intervalos de preferencia correspondientes.

Son preferentes según la invención los compuestos de la fórmula (I) en los que hay presente una combinación de significados indicados anteriormente como preferentes.

45 Son particularmente preferentes según la invención compuestos de la fórmula (I) en los que hay presente una combinación de significados indicados anteriormente como particularmente preferentes.

Son particularmente preferentes según la invención compuestos de la fórmula (I) en los que hay presente una combinación de significados indicados anteriormente como particularmente preferentes.

50 Son destacados según la invención los compuestos de la fórmula (I) en los que hay presente una combinación de significados indicados anteriormente como destacados.

En otro grupo preferente de compuestos de la fórmula (I) R^1 representa ciclopropilo.

En otro grupo preferente de compuestos de la fórmula (I) R^7 representa etilo.

En otro grupo preferente de compuestos de la fórmula (I) R^7 representa CH_2CF_3 .

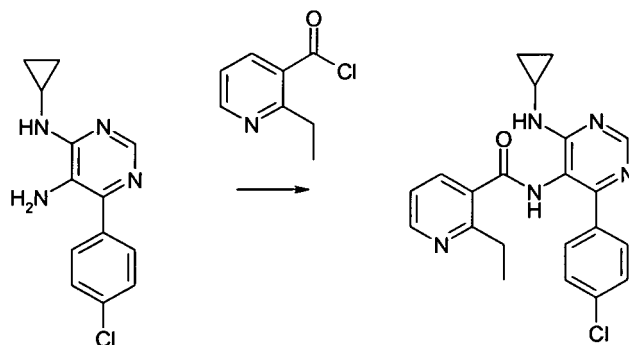
En otro grupo preferente de compuestos de la fórmula (I) R^5 representa fenilo dado el caso sustituido.

En otro grupo preferente de compuestos de la Fórmula (I) R^5 representa 3-piridilo dado el caso sustituido.

En el caso del procedimiento 1 según la invención para preparar los compuestos nuevos de la fórmula (I) se disponen como compuesto de la fórmula (II) por ejemplo 6-(4-cloro-fenil)-N-ciclopropil-pirimidin-4,5-diamina y como compuesto de la fórmula (III) cloruro de 2-etil-nicotinoilo, de tal modo que el procedimiento 1 puede representarse por medio del esquema de reacción I siguiente:

5

Esquema de reacción I



Esta reacción se realiza, en general, de modo que los compuestos de la fórmula (II) se hacen reaccionar con compuestos de la fórmula (III) en presencia de un coadyuvante básico en un diluyente a una temperatura de $-40\text{ }^{\circ}\text{C}$ a $120\text{ }^{\circ}\text{C}$.

10

Como coadyuvantes básicos se consideran aminas, por ejemplo trialkilaminas o piridinas. Se puede mencionar, por ejemplo, piridina.

En general, es ventajoso hacer reaccionar los compuestos de la fórmula (II) con compuestos de la fórmula (III) en un diluyente. A este respecto, pueden usarse, dado el caso, también mezclas de diluyentes. Los diluyentes se usan ventajosamente una cantidad tal que la mezcla de reacción puede agitarse bien durante la totalidad del procedimiento. Como diluyentes para llevar a cabo el procedimiento 1 según la invención se consideran disolventes orgánicos inertes en las condiciones de reacción.

15

Como ejemplos pueden mencionarse: halohidrocarburos, en particular clorohidrocarburos, tales como tetracloroetileno, tetracloroetano, dicloropropano, cloruro de metilo (DCM), diclorobutano, cloroformo, tetraclorocarbono, tricloroetano, tricloroetileno, pentacloroetano, difluorobenceno, 1,2-dicloroetano, clorobenceno, bromobenceno, diclorobenceno, clorotolueno, triclorobenceno; éteres tales como etil propil éter, metil terc-butil éter, n-butil éter, anisol, fenetol, ciclohexil metil éter, dimetil éter, dietil éter, dipropil éter, diisopropil éter, di-n-butil éter, diisobutil éter, diisoamil éter, etilenglicol dimetil éter, tetrahidrofurano, dioxano, diclorodietil éter y poliéteres de óxido de etileno y/o óxido de propileno.

20

Al finalizar la reacción, la totalidad de la preparación de reacción se concentra. Los productos obtenidos tras el procesamiento pueden purificarse de un modo habitual mediante cristalización, destilación al vacío o cromatografía en columna (véanse también los ejemplos de preparación).

25

Los compuestos de la fórmula (II) pueden obtenerse en parte comercialmente u obtenerse según procedimientos conocidos de la bibliografía (véase Journal of Combinatorial Chemistry (2003), 5(5), 653-659, y también los ejemplos de preparación).

30

Los compuestos que también se usan como compuestos de partida para la realización del procedimiento 1 según la invención se describen mediante la fórmula (III).

En la fórmula (III) R^4 tiene los significados que ya se han mencionado con respecto a la descripción de las sustancias según la invención de la fórmula (I).

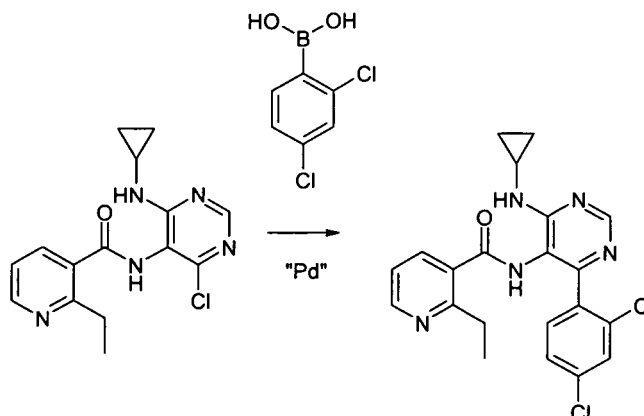
Los compuestos de la fórmula (III) pueden obtenerse en parte comercialmente u obtenerse según procedimientos conocidos de la bibliografía (véase Chemical Communications (2008), 4207-4209 y Methods of Organic Synthesis (2002), volumen E22a, Ed. Murray Goodman, el documento JP401316361A y Mendeleev Communications (2006) (3), 161 - 163).

35

En el caso del procedimiento 2 según la invención para preparar los compuestos nuevos de la fórmula (I) se disponen como compuesto de la fórmula (IV) por ejemplo N-(4-cloro-6-ciclopropilamino-pirimidin-5-il)-2-etil-nicotinamida y como compuesto de la fórmula (V) ácido 2,4-diclorofenilborónico, de tal modo que el procedimiento 2 puede representarse por medio del esquema de reacción II siguiente:

40

Esquema de reacción II



El compuesto de la fórmula (IV) se hace reaccionar en un diluyente adecuado tal como, por ejemplo, alcoholes (por ejemplo, metanol o etanol), éteres (por ejemplo, dietil éter o dioxano) o agua o una mezcla de estos diluyentes (por ejemplo, dioxano/agua) dado el caso en presencia de una base y en presencia de catalizadores de paladio adecuados y bases en un intervalo de temperatura de -20 °C a 120 °C en disolventes adecuados (reacción de Suzuki).

Bases adecuadas son bases inorgánicas u orgánicas, en particular carbonatos, tales como, por ejemplo, carbonato de sodio.

Pueden usarse una pluralidad de catalizadores de paladio. Preferentemente se usan catalizadores de la serie PdCl₂(dppf) [dppf = 1,1'-bis(difenilfosfina)ferroceno], Pd(PPh₃)₄, PdCl₂(PPh₃)₂, PdCl₂(CH₃CN)₂, Pd₂(dba)₃ [dba = dibencilidenacetona] o Pd(OAc)₂, de modo particularmente preferente Pd(PPh₃)₄.

Los compuestos de la fórmula (IV) son parcialmente conocidos y pueden prepararse según procedimientos conocidos, descritos, por ejemplo, en Tetrahedron Letters, 49(13), 2 143-2145; 2008.

Los ácidos borónicos o ésteres de ácidos borónicos de la fórmula (V) se pueden conseguir en parte comercialmente o pueden prepararse según procedimientos conocidos. Esto se describe por ejemplo en el documento WO 1999/64428.

Al finalizar la reacción, la totalidad de la preparación de reacción se concentra. Los productos obtenidos tras el procesamiento pueden purificarse de un modo habitual mediante cristalización, destilación al vacío o cromatografía en columna (véanse también los ejemplos de preparación).

Los principios activos según la invención son adecuados por su buena tolerancia por las plantas, toxicidad aceptable para animales de sangre caliente y buena tolerancia por el medio ambiente para proteger plantas y órganos de plantas, aumentar el rendimiento de las cosechas, mejorar la calidad del producto cosechado y para la lucha contra parásitos animales, especialmente insectos, arácnidos, helmintos, nematodos y moluscos presentes en agricultura y jardinería, en la cría de animales, en silvicultura, en jardines y en instalaciones de recreo, en protección de materiales y productos, así como en el sector de la higiene. Pueden usarse preferiblemente como agentes fitoprotectores. Son activos contra especies normalmente sensibles y resistentes y contra todos o cada uno de los diversos estadios de desarrollo. A los parásitos mencionados anteriormente pertenecen:

Del orden de los anopluros (fitirápteros), por ejemplo, *Damalinea spp.*, *Haematopinus spp.*, *Linognathus spp.*, *Pediculus spp.*, *Trichodectes spp.*

De la clase de los arácnidos, por ejemplo *Acarus siro*, *Aceria sheldoni*, *Aculops spp.*, *Aculus spp.*, *Amblyomma spp.*, *Argas spp.*, *Boophilus spp.*, *Brevipalpus spp.*, *Bryobia praetiosa*, *Chorioptes spp.*, *Dermanyssus gallinae*, *Eotetranychus spp.*, *Epitimerus pyri*, *Eutetranychus spp.*, *Eriophyes spp.*, *Hemitarsonemus spp.*, *Hyalomma spp.*, *Ixodes spp.*, *Latrodectus mactans*, *Metatetranychus spp.*, *Oligonychus spp.*, *Ornithodoros spp.*, *Panonychus spp.*, *Phyllocoptura oleivora*, *Polyphagotarsonemus latus*, *Psoroptes spp.*, *Rhipicephalus spp.*, *Rhizoglyphus spp.*, *Sarcoptes spp.*, *Scorpio maurus*, *Stenotarsonemus spp.*, *Tarsonemus spp.*, *Tetranychus spp.*, *Vasates lycopersici*.

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

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

Del orden de los coleópteros por ejemplo *Acanthoscelides obtectus*, *Adoretus spp.*, *Agelastica alni*, *Agriotes spp.*, *Amphimallon solstitialis*, *Anobium punctatum*, *Anoplophora spp.*, *Anthonomus spp.*, *Anthrenus spp.*, *Apogonia spp.*, *Atomaria spp.*, *Attagenus spp.*, *Bruchidius obtectus*, *Bruchus spp.*, *Ceuthorhynchus spp.*, *Cleonus mendicus*, *Conoderus spp.*, *Cosmopolites spp.*, *Costelytra zealandica*, *Curculio spp.*, *Cryptorhynchus lapathi*, *Dermestes spp.*, *Diabro-*

5 *tica* spp., *Epilachna* spp., *Faustinus cubae*, *Gibbium psyllodes*, *Heteronychus arator*, *Hylamorpha elegans*, *Hylotrupes bajulus*, *Hypera postica*, *Hypothenemus* spp., *Lachnosterna consanguinea*, *Leptinotarsa decemlineata*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Lixus* spp., *Lyctus* spp., *Meligethes aeneus*, *Melolontha melolontha*, *Migdolus* spp., *Monochamus* spp., *Naupactus xanthographus*, *Niptus hololeucus*, *Oryctes rhinoceros*, *Oryzaeophilus surinamensis*, *Otiorrhynchus sulcatus*, *Oxycetonia jucunda*, *Phaedon cochleariae*, *Phyllophaga* spp., *Popillia japonica*, *Premnotrypes* spp., *Psylliodes chrysocephala*, *Ptinus* spp., *Rhizobius ventralis*, *Rhizopertha dominica*, *Sitophilus* spp., *Sphenophorus* spp., *Sternechus* spp., *Symphyletes* spp., *Tenebrio molitor*, *Tribolium* spp., *Trogoderma* spp., *Tychius* spp., *Xylotrechus* spp., *Zabrus* spp.

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

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

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

15 Del orden de los dípteros, por ejemplo, *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Bibio hortulanus*, *Calliphora erythrocephala*, *Ceratitis capitata*, *Chrysomyia* spp., *Cochliomyia* spp., *Cordylobia anthropophaga*, *Culex* spp., *Cuterebra* spp., *Dacus oleae*, *Dermatobia hominis*, *Drosophila* spp., *Fannia* spp., *Gastrophilus* spp., *Hylemyia* spp., *Hyppobosca* spp., *Hypodermia* spp., *Liriomyza* spp., *Lucilia* spp., *Musca* spp., *Nezara* spp., *Oestrus* spp., *Oscinella frit*, *Pegomyia hyoscyami*, *Phorbia* spp., *Stomoxys* spp., *Tabanus* spp., *Tannia* spp., *Tipula paludosa*, *Wohlfahrtia* spp.

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

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

Además se pueden combatir protozoos tales como *Eimeria*.

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

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

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

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

55 Del orden de los isópteros, por ejemplo *Reticulitermes* spp., *Odontotermes* spp.

Del orden de los lepidópteros, por ejemplo *Acronicta major*, *Aedia leucomelas*, *Agrotis spp.*, *Alabama argillacea*, *Anticarsia spp.*, *Barathra brassicae*, *Bucculatrix thurberiella*, *Bupalus piniarius*, *Cacoecia podana*, *Capua reticulana*, *Carpocapsa pomonella*, *Cheimatobia brumata*, *Chilo spp.*, *Choristoneura fumiferana*, *Clysia ambiguella*, *Cnaphalocerus spp.*, *Earias insulana*, *Ephestia kuehniella*, *Euproctis chrysorrhoea*, *Euxoa spp.*, *Feltia spp.*, *Galleria mellonella*, *Helicoverpa spp.*, *Heliothis spp.*, *Hofmannophila pseudospretella*, *Homona magnanima*, *Hyponomeuta padella*, *Laphygma spp.*, *Lithocolletis blancardella*, *Lithophane antennata*, *Loxagrotis albicosta*, *Lymantria spp.*, *Malacosoma neustria*, *Mamestra brassicae*, *Mocis repanda*, *Mythimna separata*, *Oria spp.*, *Oulema oryzae*, *Panolis flammea*, *Pectinophora gossypiella*, *Phyllocnistis citrella*, *Pieris spp.*, *Plutella xylostella*, *Prodenia spp.*, *Pseudaletia spp.*, *Pseudoplusia includens*, *Pyrausta nubilalis*, *Spodoptera spp.*, *Thermesia gemmatilis*, *Tinea pellionella*, *Tineola bisselliella*, *Tortrix viridana*, *Trichoplusia spp.*

Del orden de los ortópteros, por ejemplo *Acheta domesticus*, *Blatta orientalis*, *Blattella germanica*, *Gryllotalpa spp.*, *Leucophaea maderae*, *Locusta spp.*, *Melanoplus spp.*, *Periplaneta americana*, *Schistocerca gregaria*.

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

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

Del orden de los tisanópteros, por ejemplo *Baliothrips biformis*, *Enneothrips flavens*, *Frankliniella spp.*, *Heliothrips spp.*, *Hercinothrips femoralis*, *Kakothrips spp.*, *Rhipiphorothrips cruentatus*, *Scirtothrips spp.*, *Taeniothrips cardamoni*, *Thrips spp.*

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

A los nematodos parásitos de plantas pertenecen, por ejemplo *Anguina spp.*, *Aphelenchoides spp.*, *Belonoaimus spp.*, *Bursaphelenchus spp.*, *Ditylenchus dipsaci*, *Globodera spp.*, *Heliocotylenchus spp.*, *Heterodera spp.*, *Longidorus spp.*, *Meloidogyne spp.*, *Pratylenchus spp.*, *Radopholus similis*, *Rotylenchus spp.*, *Trichodorus spp.*, *Tylenchorhynchus spp.*, *Tylenchulus spp.*, *Tylenchulus semipenetrans*, *Xiphinema spp.*

Dado el caso, los compuestos según la invención pueden, a determinadas concentraciones o cantidades de aplicación, usarse también como herbicidas, protectores, reguladores del crecimiento o agentes para mejorar las propiedades de la planta, o como microbicidas, por ejemplo como fungicidas, antimicóticos, bactericidas, viricidas (incluidos agentes contra viroides) o como agentes contra MLO (organismos similares a microplasma) y RLO (organismos similares a rickettsia). Dado el caso, también pueden emplearse como intermedios o precursores para la síntesis de otros principios activos.

Los principios activos pueden convertirse en las formulaciones habituales tales como soluciones, emulsiones, polvos humectables para pulverización, suspensiones a base de agua o de aceite, polvos, agentes de espolvoreo, pastas, polvos solubles, gránulos solubles, gránulos dispersables, concentrados de suspensión-emulsión, materiales naturales impregnados con sustancias activas, materiales sintéticos impregnados con principios activos, fertilizantes y también microencapsulaciones en sustancias poliméricas.

Estas formulaciones se preparan de modo conocido, por ejemplo mezclando los principios activos con diluyentes, es decir disolventes líquidos y/o vehículos sólidos, dado el caso usando agentes tensioactivos, es decir emulsionantes y/o dispersantes y/o agentes espumantes. La preparación de las formulaciones se realiza o en instalaciones adecuadas o también antes o durante la aplicación.

Pueden usarse como coadyuvantes las sustancias que son adecuadas para conferir al agente en sí y/o a las preparaciones derivadas del mismo (por ejemplo, licores para pulverizar, recubrimientos de semillas) propiedades particulares, tales como unas propiedades técnicas determinadas y/o unas propiedades biológicas particulares. Como coadyuvantes típicos se consideran: diluyentes, disolventes y vehículos.

Diluyentes adecuados son, por ejemplo, agua, líquidos químicos orgánicos polares y no polares, por ejemplo de las clases de los hidrocarburos aromáticos y no aromáticos (tales como parafinas, alquilbencenos, alquilnaftalinas, clorobencenos), de los alcoholes y polioles (que pueden, dado el caso, estar sustituidos, eterificados y/o esterificados), de las cetonas (tales como acetona, ciclohexanona), ésteres (incluidos grasos y oleaginosos) y (poli)éteres, aminas, sencillas o sustituidas, amidas, lactamas (tales como N-alquilpirrolidona) y lactonas, de las sulfonas y sulfóxidos (tales como dimetilsulfóxido).

Si el diluyente que se usa es agua, también es posible usar, por ejemplo, disolventes orgánicos como codisolventes. Como disolventes líquidos se consideran, esencialmente: compuestos aromáticos, tales como xileno, tolueno o alquilnaftalenos, compuestos aromáticos clorados o hidrocarburos alifáticos clorados, tales como clorobencenos, cloro-etilenos o cloruro de metileno, hidrocarburos alifáticos, tales como ciclohexano o parafinas, por ejemplo, fracciones de aceites minerales, alcoholes tales como butanol o glicol y también sus éteres y ésteres, cetonas, tales como acetona, metiletilcetona, metilisobutilcetona o ciclohexanona, disolventes muy polares, tales como dimetilformamida y dimetilsulfóxido, así como agua.

Como vehículos sólidos se consideran: por ejemplo sales de amonio y minerales naturales en polvo tales como

caolines, arcillas, talco, creta, cuarzo, atapulgita, montmorillonita o tierra de diatomeas y minerales sintéticos en polvo, tales como ácido silícico muy disperso, óxido de aluminio y silicatos; como vehículos sólidos para gránulos se consideran: por ejemplo, piedras quebradas y fraccionadas naturales tales como calcita, mármol, piedra pómez, sepiolita, dolomita y también gránulos sintéticos de harinas inorgánicas y orgánicas, así como gránulos de material orgánico como papel, serrín, cáscaras de coco, mazorcas de maíz y varas de tabaco; como emulsionantes y/o formadores de espuma se tienen en cuenta: por ejemplo, emulsionantes no ionógenos y aniónicos, tales como ésteres de ácido graso de polioxietileno, éteres de alcohol graso de polioxietileno, por ejemplo alquilarilpoliglicoléteres, sulfonatos de alquilo, sulfatos de alquilo, sulfonatos de arilo y también hidrolizados de proteína; como agentes dispersantes se tienen en consideración sustancias no iónicas y/o iónicas, por ejemplo de las clases de los éteres alcohólicos POE y/o POP, ésteres de ácidos y/o POP-POE, éteres de alquilarilo y/o POP-POE, aductos de grasas y/o POP-POE, derivados de poliol POE y/o POP, aductos de azúcar o sorbitán POP y/o POE, sulfatos, sulfonatos y fosfatos de alquilo o arilo, o los correspondientes aductos de éter PO. Además oligómeros o polímeros adecuados, por ejemplo los derivados de monómeros vinílicos, de ácido acrílico, de EO y/o PO solos o en combinación con, por ejemplo, (poli)alcoholes o (poli)aminas. También es posible usar lignina y sus derivados de ácido sulfónico, celulosas modificadas o no modificadas, ácidos sulfónicos aromáticos y/o alifáticos y sus aductos con formaldehído.

En las formulaciones pueden usarse agentes de adherencia tales como carboximetilcelulosa y polímeros naturales y sintéticos en forma de polvos, gránulos o látex, tales como goma arábica, alcohol de polivinilo, acetato de polivinilo, así como fosfolípidos naturales, tales como cefalinas y lecitinas, y fosfolípidos sintéticos.

Es posible usar colorantes tales como pigmentos inorgánicos, por ejemplo óxido de hierro, óxido de titanio y azul de Prusia, y colorantes orgánicos, tales como colorantes de alizarina, colorantes azoicos y colorantes de ftalocianina metálica, y oligonutrientes tales como sales de hierro, manganeso, boro, cobre, cobalto, molibdeno y cinc.

Otros aditivos posibles son perfumes, aceites minerales o vegetales, dado el caso modificados, ceras y nutrientes (incluidos oligonutrientes), tales como sales de hierro, manganeso, boro, cobre, cobalto, molibdeno y cinc.

Pueden también encontrarse estabilizantes, tales como criostabilizantes, conservantes, antioxidantes, fotoprotectores u otros agentes que mejoran la estabilidad química y/o física.

Las formulaciones contienen en general entre el 0,01 y el 98 % en peso de principio activo, preferentemente entre el 0,5 y el 90 %.

El principio activo según la invención puede presentarse en sus formulaciones comerciales y en las formas de aplicación preparadas a partir de dichas formulaciones mezclado con otros principios activos tales como insecticidas, atrayentes, esterilizantes, bactericidas, acaricidas, nematocidas, fungicidas, sustancias reguladoras del crecimiento, herbicidas, protectores, fertilizantes o productos semioquímicos.

También es posible una mezcla con otros principios activos conocidos tales como herbicidas, fertilizantes, reguladores del crecimiento, protectores, productos semioquímicos, o también con agentes para mejorar las propiedades de las plantas.

Los principios activos según la invención, en caso de uso como insecticidas, pueden presentarse en sus formulaciones comerciales y en las formas de aplicación preparadas a partir de dichas formulaciones mezclados con sinergistas. Los sinergistas son compuestos mediante los que aumenta el efecto de los principios activos sin que el sinergista mismo añadido deba ser eficazmente activo.

Los principios activos según la invención, en caso de uso como insecticida, pueden presentarse además en sus formulaciones comerciales habituales, así como en las formas de uso preparadas a partir de estas formulaciones mezclados con sustancias inhibitoras que reducen la degradación del principio activo tras la aplicación en los alrededores de la planta, sobre la superficie de partes de la planta o en tejidos vegetales.

El contenido en principio activo de las formas de aplicación preparadas a partir de las formulaciones comerciales habituales puede variar dentro de unos intervalos amplios. La concentración de principios activos en las formas de aplicación puede variar del 0,00000001 al 95 % en peso de principio activo, preferentemente entre el 0,00001 y el 1 % en peso.

La aplicación se lleva a cabo de un modo habitual adaptado a las formas de aplicación.

Según la invención se pueden tratar todo tipo de plantas y de partes de plantas. Por plantas se entiende, a este respecto, todas las plantas y poblaciones de plantas, tales como plantas silvestres deseadas y no deseadas o plantas de cultivo (incluidas las plantas de cultivo de origen natural). Plantas de cultivo pueden ser plantas que pueden obtenerse mediante procedimientos de cultivo y optimización convencionales o mediante procedimientos de biotecnología e ingeniería genética o combinaciones de estos procedimientos, incluidas las plantas transgénicas e incluidas las variedades de plantas que pueden estar o no protegidas por los derechos de obtentor. Por partes de plantas se entienden todas las partes y órganos de las plantas subterráneos y aéreos, tales como brote, hoja, flor y raíz, mencionándose a modo de ejemplo hojas, agujas, tallos, troncos, flores, cuerpos fructíferos, frutos y semillas, así como

raíces, bulbos y rizomas. A las partes de las plantas, pertenecen también los productos cosechados, así como el material reproductivo vegetativo y generativo, por ejemplo, plantones, bulbos, rizomas, esquejes y semillas.

5 El tratamiento según la invención de las plantas y partes de plantas con los principios activos se realiza directamente o por acción sobre sus alrededores, hábitat o espacio de almacenamiento según los procedimientos de tratamiento habituales, por ejemplo por inmersión, atomización, evaporación, nebulización, dispersión, embadurnado, inyección y en el caso de material de propagación, especialmente en el caso de semillas, además mediante recubrimiento con una o más capas.

10 Los principios activos según la invención son particularmente adecuadas para el tratamiento de semillas. Así, una gran parte de los daños provocados por parásitos en plantas de cultivo se genera ya por la infestación de las semillas durante el almacenamiento y después de la introducción de las semillas en el suelo así como durante e inmediatamente después de la germinación de la planta. Esta fase es especialmente crítica debido a que las raíces y los brotes de la planta en crecimiento son particularmente sensibles y con sólo un daño pequeño se puede provocar la muerte de toda la planta. Existe por ello un gran interés en proteger las semillas y la planta en germinación usando los agentes adecuados.

15 La lucha contra parásitos mediante el tratamiento de semillas de plantas se conoce desde hace tiempo y es objeto de continuas mejoras. No obstante aparecen en el tratamiento de semillas una serie de problemas que no siempre se pueden solucionar de un modo satisfactorio. Por lo tanto, merece la pena desarrollar procedimientos de protección de las semillas y de las plantas en germinación que hagan innecesario el uso adicional de agentes fitoprotectores tras la siembra o una vez haya brotado la planta. Merece además la pena optimizar la cantidad del principio activo que se va a aplicar de tal manera que las semillas y las plantas en germinación estén protegidas de la mejor manera posible contra la infestación de patógenos sin que, sin embargo, el principio activo usado dañe la planta misma. De modo particular, los procedimientos para el tratamiento de semillas pueden incluir también plantas transgénicas con propiedades insecticidas intrínsecas, para conseguir una protección óptima de las semillas y de la planta en germinación usando un mínimo de agentes fitoprotectores.

25 La presente invención se refiere también, por lo tanto, a un procedimiento para proteger semillas y plantas en germinación contra el ataque de parásitos en el que las semillas se tratan con un agente según la invención. La invención igualmente se refiere al uso del agente según la invención para el tratamiento de semillas para proteger de parásitos las semillas y las plantas que surgen de las mismas. Además, la invención se refiere a semillas tratadas con un agente de acuerdo con la invención para la protección contra parásitos.

30 Una de las ventajas de la presente invención es que, debido a las propiedades sistémicas especiales del agente según la invención, el tratamiento de la semilla con estos agentes no sólo protege a la semilla misma contra parásitos, sino también a las plantas procedentes de la misma después del brote. De este modo, puede evitarse el tratamiento directo del cultivo en el momento de la siembra o poco después.

35 Asimismo, se contempla como ventajoso poder usar los principios activos según la invención particularmente también con semillas transgénicas, siendo capaces las plantas que surgen a partir de dichas semillas de expresar una proteína dirigida contra parásitos. Mediante el tratamiento de tales semillas con los agentes según la invención se pueden combatir ya determinados parásitos por medio de la expresión de, por ejemplo, una proteína insecticida y, adicionalmente, protegerlas de daños por medio de los agentes según la invención.

40 Los agentes según la invención son adecuados para proteger las semillas de cualquier variedad de plantas como las mencionadas ya anteriormente que se usan en agricultura, en invernaderos, en silvicultura o en jardinería. En particular se trata, a este respecto, de semillas de maíz, cacahuete, canola, colza, amapola, soja, algodón, remolacha (por ejemplo remolacha azucarera y remolacha forrajera), arroz, mijo, trigo, cebada, avena, centeno, girasol, tabaco, patatas u hortalizas (por ejemplo tomates, coles).

45 Los agentes según la invención son también adecuados para tratar semillas de frutales y hortalizas tal como ya se ha mencionado anteriormente. Tiene particular importancia el tratamiento de semillas de maíz, soja, algodón, trigo y canola o colza.

50 Como ya se ha mencionado anteriormente, el tratamiento de semillas transgénicas con los agentes según la invención tiene también una importancia particular. A este respecto se trata de plantas de semillas de plantas que normalmente contienen al menos un gen heterólogo que controla la expresión de un polipéptido con características insecticidas particulares. Los genes heterólogos en semillas transgénicas pueden proceder, a este respecto, de microorganismos como *Bacillus*, *Rhizobium*, *Pseudomonas*, *Serratia*, *Trichoderma*, *Clavibacter*, *Glomus* o *Gliocladium*. La presente invención es especialmente adecuada para el tratamiento de semillas transgénicas que contienen al menos un gen heterólogo que procede de *Bacillus sp.* y cuyo producto génico muestra actividad frente al piral del maíz y/o el taladrador de la raíz. De modo especialmente preferente se trata, a este respecto, de un gen heterólogo que procede de *Bacillus thuringiensis*.

55 En el ámbito de la presente invención se aplica el principio activo según la invención solo o en una formulación adecuada sobre las semillas. Preferentemente, las semillas se tratan en un estado que sea tan estable que no

aparezcan daños en el tratamiento. En general se puede realizar el tratamiento de las semillas en cualquier momento entre la cosecha y la siembra. Habitualmente se usan semillas que se retiran de la planta y que se limpian de mazorcas, pieles, tallos, cáscaras, pelusas o carne de frutas.

- 5 En general, se debe prestar atención en el tratamiento de las semillas a que la cantidad aplicada sobre ellas del agente según la invención o de los aditivos se elija de tal manera, que no se perjudique la germinación de las semillas o que no se dañe la planta resultante. Esto hay que tenerlo en cuenta sobre todo en el caso de principios activos que en determinadas cantidades de aplicación puedan mostrar efectos fitotóxicos.

- 10 Como ya se ha mencionado anteriormente, se pueden tratar de acuerdo con la invención todas las plantas y sus partes. En una forma de realización preferente se pueden tratar especies y variedades de plantas de origen natural u obtenidas mediante procedimientos convencionales de cultivo biológico, como cruzamiento o fusión de protoplastos, así como sus partes. En una forma de realización preferida adicional, se tratan plantas transgénicas y variedades de plantas que se han obtenido mediante procedimientos de ingeniería genética, dado el caso en combinación con procedimientos convencionales (organismos modificados genéticamente), y sus partes. Los conceptos "partes" o "partes de las plantas" o "partes de plantas" se han explicado anteriormente.

- 15 De forma particularmente preferente, se tratan plantas según la invención de las variedades de plantas comerciales o que se encuentran en uso, respectivamente. Por variedades de plantas se entiende plantas con propiedades nuevas ("rasgos") que se han obtenido mediante cultivo convencional, mediante mutagénesis o usando técnicas de ADN recombinante. Éstas pueden ser variedades, biotipos y genotipos.

- 20 Según la especie de planta o variedad de planta, su hábitat y condiciones de crecimiento (suelo, clima, periodo vegetativo, alimentación), pueden aparecer también efectos superaditivos ("sinérgicos") mediante el tratamiento según la invención. Así, son posibles, por ejemplo, cantidades de aplicación reducidas y/o ampliaciones del espectro de acción y/o un reforzamiento de la actividad de las sustancias y agentes que pueden usarse según la invención, mejor crecimiento de plantas, tolerancia elevada frente a altas o bajas temperaturas, tolerancia elevada frente a sequedad o frente al contenido de sal del agua o el suelo, rendimiento de floración elevado, recolección facilitada, aceleramiento de la maduración, mayores rendimientos de cosecha, mayor calidad y/o mayor valor nutritivo de los productos de cosecha, mayor capacidad de almacenamiento y/o procesabilidad de los productos cosechados que superan los efectos que realmente se esperan.

- 30 A las plantas o variedades de plantas transgénicas preferidas para tratar según la invención (obtenidas por ingeniería genética) pertenecen todas las plantas que mediante modificación por ingeniería genética han obtenido material genético que confiere a estas plantas propiedades valiosas especialmente ventajosas ("rasgos"). Son ejemplos de dichas propiedades: mejor crecimiento de planta, tolerancia elevada frente a temperaturas altas o bajas, tolerancia aumentada frente a sequedad o frente al contenido de sal de agua o suelo, rendimiento de floración elevado, recolección facilitada, aceleramiento de la maduración, mayores rendimientos de cosecha, mayor calidad y/o mayor valor nutritivo de los productos de cosecha, mayor capacidad de almacenamiento y/o procesabilidad de los productos cosechados. Son ejemplos adicionales y especialmente destacados de dichas propiedades una defensa elevada de las plantas frente a plagas animales y microbianas, como frente a insectos, ácaros, hongos fitopatógenos, bacterias y/o virus, así como una tolerancia elevada de las plantas frente a determinados principios activos herbicidas. Como ejemplos de plantas transgénicas se destacan especialmente las plantas de cultivo importantes, como cereales (trigo, arroz), maíz, soja, patata, remolacha azucarera, tomates, guisantes y otras variedades de hortalizas, algodón, tabaco, colza, así como plantas frutales (con los frutos manzanas, peras, cítricos y uvas viníferas), destacándose particularmente maíz, soja, patatas, algodón, tabaco y colza. Como propiedades ("rasgos"), se destacan especialmente la defensa elevada de las plantas contra insectos, arácnidos, nematodos y caracoles mediante toxinas presentes en las plantas, particularmente aquellas que se producen en las plantas mediante el material genético de *Bacillus thuringiensis* (por ejemplo, mediante los genes CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c, Cry2Ab, Cry3Bb y CryIF, así como sus combinaciones) generadas en las plantas (en adelante "plantas Bt") Como propiedades ("rasgos"), también se destaca especialmente el aumento de la defensa de plantas frente a hongos, bacterias y virus mediante resistencia sistémica adquirida (SAR), sistemina, pitoalexina, elicitores, así como genes de resistencia y las proteínas y toxinas expresadas correspondientes. Como propiedades ("rasgos"), se destaca especialmente, también, el aumento de la tolerancia de las plantas frente a determinados principios activos herbicidas, por ejemplo, imidazolinonas, sulfonilureas, glufosato o fosfinotricina (por ejemplo, gen "PAT") Los genes que confieren las propiedades deseadas respectivas ("rasgos") pueden aparecer también en combinaciones entre sí en las plantas transgénicas. Como ejemplos de "plantas Bt", se citan variedades de maíz, variedades de algodón, variedades de soja y variedades de patata que se comercializan con las denominaciones comerciales YIELD GARD® (por ejemplo maíz, algodón, soja), KnockOut® (por ejemplo maíz), StarLink® (por ejemplo maíz), Bollgard® (algodón), Nucotn® (algodón) y NewLeaf® (patata). Como ejemplos de plantas tolerantes a herbicida, se citan variedades de maíz, variedades de algodón y variedades de soja que se comercializan con las denominaciones comerciales Roundup Ready® (tolerancia frente a glifosato, por ejemplo, maíz, algodón, soja), Liberty Link® (tolerancia frente a fosfinotricina, por ejemplo, colza), IMI® (tolerancia frente a imidazolinonas) y STS® (tolerancia frente a sulfonilureas, por ejemplo, maíz). Como plantas resistentes a herbicida (cultivadas convencionalmente con tolerancia a herbicida), se mencionan también las variedades comercializadas con la referencia Clearfield® (por ejemplo maíz). Naturalmente, estas indicaciones son válidas también para las variedades de plantas desarrolladas en el futuro o presentes en el mercado futuro con estas u otras propiedades genéticas

desarrolladas en el futuro (“rasgos”).

Las plantas mencionadas pueden tratarse de modo especialmente ventajoso según la invención con los compuestos de la fórmula general (I). Los intervalos de preferencia indicados anteriormente para los principios activos tienen también validez para el tratamiento de estas plantas. El tratamiento de plantas con los compuestos o las mezclas indicados especialmente en el presente texto es particularmente destacado.

5 Los principios activos según la invención actúan no sólo contra parásitos de plantas, de la higiene y de productos almacenados sino también en el campo de la medicina veterinaria frente a parásitos animales (ectoparásitos y endoparásitos) como garrapatas duras y blandas, aradores de la sarna, trombídidos, moscas (picadoras y chupadoras), larvas parásitas de moscas, piojos, liendres del cabello, liendres de las plumas y pulgas. A estos parásitos pertenecen:

10 Del orden de los anopluros, por ejemplo, *Haematopinus spp.*, *Linognathus spp.*, *Pediculus spp.*, *Phthirus spp.*, *Solenopotes spp.*.

Del orden de los malofágidos y los subórdenes Amblycerina, así como Ischnocerina, por ejemplo, *Trimenopon spp.*, *Menopon spp.*, *Trinoton spp.*, *Bovicola spp.*, *Werneckiella spp.*, *Lepikentron spp.*, *Damalina spp.*, *Trichodectes spp.*, *Felicola spp.*

15 Del orden de los dípteros y los subórdenes *Nematocera* y *Brachycera*, por ejemplo *Aedes spp.*, *Anopheles spp.*, *Culex spp.*, *Simulium spp.*, *Eusimulium spp.*, *Phlebotomus spp.*, *Lutzomyia spp.*, *Culicoides spp.*, *Chrysops spp.*, *Hybomitra spp.*, *Atylotus spp.*, *Tabanus spp.*, *Haematopota spp.*, *Philipomyia spp.*, *Braula spp.*, *Musca spp.*, *Hydrotaea spp.*, *Stomoxys spp.*, *Haematobia spp.*, *Morellia spp.*, *Fannia spp.*, *Glossina spp.*, *Calliphora spp.*, *Lucilia spp.*, *Chrysomyia spp.*, *Wohlfahrtia spp.*, *Sarcophaga spp.*, *Oestrus spp.*, *Hypoderma spp.*, *Gasterophilus spp.*, *Hippobosca spp.*, *Lipoptena spp.*, *Melophagus spp.*.

20 Del orden de los *Siphonaptera*, por ejemplo, *Pulex spp.*, *Ctenocephalides spp.*, *Xenopsylla spp.*, *Ceratophyllus spp.*.

Del orden de los heteroptéridos, por ejemplo, *Cimex spp.*, *Triatoma spp.*, *Rhodnius spp.*, *Panstrongylus spp.*

Del orden de los blatáridos, por ejemplo *Blatta orientalis*, *Periplaneta americana*, *Blattella germanica*, *Supella spp.*.

25 De la subclase de los ácaros (*Acarina*) y de los órdenes *Meta-* y *Mesostigmata*, por ejemplo *Argas spp.*, *Ornithodoros spp.*, *Otobius spp.*, *Ixodes spp.*, *Amblyomma spp.*, *Boophilus spp.*, *Dermacentor spp.*, *Haemophysalis spp.*, *Hyalomma spp.*, *Rhipicephalus spp.*, *Dermanyssus spp.*, *Raillietia spp.*, *Pneumonyssus spp.*, *Sternostoma spp.*, *Varroa spp.*.

30 Del orden de los actinedidos (*Prostigmata*) y acarididos (*Astigmata*) por ejemplo *Acarapis spp.*, *Cheyletiella spp.*, *Ornithocheyletia spp.*, *Myobia spp.*, *Psorergates spp.*, *Demodex spp.*, *Trombicula spp.*, *Listrophorus spp.*, *Acarus spp.*, *Tyrophagus spp.*, *Caloglyphus spp.*, *Hypodectes spp.*, *Pterolichus spp.*, *Psoroptes spp.*, *Chorioptes spp.*, *Otodectes spp.*, *Sarcoptes spp.*, *Notodres spp.*, *Knemidocoptes spp.*, *Cytodites spp.*, *Laminosioptes spp.*.

35 Los principios activos de la fórmula (I) según la invención también son adecuados para combatir artrópodos que infestan animales útiles agrícolas, tales como, por ejemplo, vacunos, ovinos, cabras, caballos, cerdos, asnos, camellos, búfalos, conejos, gallinas, pavos, patos, gansos, abejas, otros animales domésticos tales como, por ejemplo, perros, gatos, aves de jaula, peces de acuario, así como los denominados animales de experimentación, como por ejemplo hámsteres, cobayas, ratas y ratones. Combatiendo a estos artrópodos se reducen los casos de muerte y las disminuciones en el rendimiento (en carne, leche, lana, pieles, huevos, miel, etc.), de modo que con el uso de los principios activos según la invención se posibilita una cría animal más sencilla y económica.

40 La aplicación de los principios activos según la invención en el sector veterinario y en la cría de animales se realiza de un modo conocido mediante administración enteral en forma de, por ejemplo, comprimidos, cápsulas, bebidas, tubo directo al estómago, granulados, pastas, bolos, procedimientos a través de la alimentación, supositorios, mediante administración parental, como por ejemplo por inyecciones (intramusculares, subcutáneas, intravenosas, intraperitoneales, y otras), injertos, aplicación nasal, mediante aplicación dermatológica en forma de por ejemplo inmersión o baño, pulverización (aerosol), vertido (en el dorso y en la cruz), lavado, empolvado, así como usando cuerpos moldeados que contienen principios activos, tales como collares, chapas para las orejas o el rabo, brazaletes

45 para las extremidades, bozales, dispositivos de marcado, etc.

En la aplicación en ganado, aves, animales domésticos etc. se pueden usar los principios activos de la fórmula (I) como formulaciones (por ejemplo polvos, emulsiones, medios fluidos) que contienen los principios activos en una cantidad de 1 a 80 % en peso, y se aplican directamente o tras dilución (por ejemplo dilución de 100 a 10 000 veces) o se emplean como baño químico.

50 Además, se ha encontrado que los compuestos según la invención muestran una actividad insecticida alta contra insectos que destruyen materiales técnicos.

A modo de ejemplo y de preferencia, pero sin actuar como limitación, se pueden mencionar los insectos siguientes:

Escarabajos tales como *Hylotrupes bajulus*, *Chlorophorus pilosis*, *Anobium punctatum*, *Xestobium rufovillosum*, *Ptilinus pecticornis*, *Dendrobium pertinex*, *Ernobius mollis*, *Priobium carpini*, *Lyctus brunneus*, *Lyctus africanus*, *Lyctus planicollis*, *Lyctus linearis*, *Lyctus pubescens*, *Trogoxylon aequale*, *Minthes rugicollis*, *Xyleborus spec.* *Tryptodendron spec.* *Apate monachus*, *Bostrychus capucins*, *Heterobostrychus brunneus*, *Sinoxylon spec.* *Dinoderus minutus*;

5 *Himenópteros* tales como *Sirex juvencus*, *Urocerus gigas*, *Urocerus gigas taignus*, *Urocerus augur*;

Termitas tales como *Kaloterme flavicollis*, *Cryptotermes brevis*, *Heterotermes indicola*, *Reticulitermes flavipes*, *Reticulitermes santonensis*, *Reticulitermes lucifugus*, *Mastotermes darwiniensis*, *Zootermopsis nevadensis*, *Coptotermes formosanus*;

Tisanuros tales como *Lepisma saccharina*.

10 Por materiales técnicos se entiende en el presente contexto materiales carentes de vida, como por ejemplo plásticos, adhesivos, colas, papel y cartón, madera, productos de la transformación de la madera y pinturas.

Los agentes preparados para su uso pueden contener, dado el caso, además, otros insecticidas y, dado el caso, también, aún uno o más fungicidas.

15 Con respecto a las posibles asociados de mezcla adiciones nos remitimos a los insecticidas y fungicidas mencionados anteriormente.

Al mismo tiempo se pueden usar los compuestos según la invención para proteger los objetos de la vegetación, en especial cascos de barcos, tamices, redes, edificios, instalaciones portuarias que estén en contacto con agua marina o salobre.

20 Además se pueden emplear los compuestos según la invención solos o en combinaciones con otros principios activos tales como antiincrustantes.

25 Los principios activos son adecuados también para combatir parásitos animales en protección doméstica, higiénica o de productos, en particular de insectos, arácnidos y ácaros presentes en espacios cerrados, como por ejemplo viviendas, pabellones industriales, oficinas, cabinas de vehículos, entre otros. Para la lucha contra estos parásitos, se pueden usar solas o en combinación con otros principios activos o coadyuvantes en productos insecticidas domésticos. Son activos contra especies sensibles y resistentes y contra todos los estadios de desarrollo. A estos parásitos pertenecen:

Del orden de los escorpiones, por ejemplo, *Buthus occitanus*.

Del orden de los acarinos, por ejemplo, *Argas persicus*, *Argas reflexus*, *Bryobia ssp.*, *Dermanyssus gallinae*, *Glyciphagus domesticus*, *Ornithodoros moubat*, *Rhipicephalus sanguineus*, *Trombicula alfreddugesi*, *Neutrombicula autumnalis*, *Dermatophagoides pteronissimus*, *Dermatophagoides forinae*.

30 Del orden de las arañas, por ejemplo, *Aviculariidae*, *Araneidae*.

Del orden de los opiliones, por ejemplo, *Pseudoscorpiones chelifer*, *Pseudoscorpiones cheiridium*, *Opiliones phalangium*.

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

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

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

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

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

40 Del orden de los saltatorios, por ejemplo, *Acheta domesticus*.

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

Del orden de los isópteros, por ejemplo, *Kaloterme spp.*, *Reticuliterme spp.*

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

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

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

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

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

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

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

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

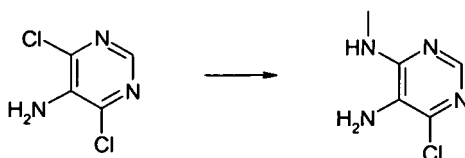
- 15 La aplicación en el sector de los insecticidas domésticos se realiza bien solos o bien en combinación con otros principios activos adecuados tales como ésteres de ácidos fosfóricos, carbamatos, piretroides, neonicotinoides, reguladores del crecimiento o principios activos de otras clases conocidas de insecticida.

- 20 La aplicación se realiza en aerosoles, agentes de pulverización sin presión, por ejemplo pulverizadores de bombeo o de atomización, máquinas automáticas de nebulización, nebulizadores, espumas, geles, productos vaporizadores con placas vaporizadoras de celulosa o plástico, vaporizadores líquidos, vaporizadores de gel y membrana, vaporizadores con mecanismo propulsor, sistemas vaporizadores carentes de energía o pasivos, papeles, saquitos y geles atrapa polillas, en forma de gránulos o polvos, en cebos dispersos o estaciones de cebo.

Ejemplos de preparación:

Ejemplo 1 (precursor)

- 25 6-Cloro-N-metil-pirimidin-4,5-diamina



- 30 Se dispusieron 5-amino-4,6-dicloropirimidina (15,0 g, 91,4 mmol) y metilamina (solución 2M en THF, 5 eq) y se añadió trietilamina (27,76 g, 274 mmol). La preparación se agitó a reflujo hasta completar la reacción (aproximadamente 3 horas). A continuación, la mezcla de reacción se concentró y al residuo se añadió agua. El valor del pH se ajustó a 7-8 con solución saturada de NaHCO₃. Se extrajo 3 veces con cloruro de metileno, se secaron las fases orgánicas reunidas sobre sulfato de sodio, se filtró y se eliminó el disolvente al vacío.

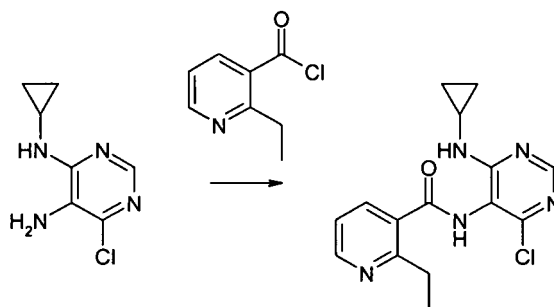
Rendimiento: 12,0 g (82 %)

CL-EM: M+(ES+) 159 (100 %)

RMN DMSO 2,89 (3H, m), 4,77 (2H, s), 6,71 (1H, s), 7,75 (1H, s).

- 35 **Ejemplo 2 (precursor)**

N-(4-Cloro-6-ciclopropilamino-pirimidin-5-il)-2-etil-nicotinamida



Se dispuso 6-cloro-N-ciclopropil-pirimidin-4,5-diamina (véase Journal of Combinatorial Chemistry (2003), 5(5), 653-659) (3,0 g, 16,2 mmol) en una mezcla de cloruro de metileno (12,20 ml) y piridina (3,94 ml). La suspensión se enfrió a 0°C y se añadió cloruro de 2-etil-nicotinoilo (1,2 eq) en forma de sólido. Se dejó que la mezcla de reacción alcanzara la temperatura ambiente y se agitó hasta completar la reacción. A continuación, se añadieron 10 ml de cloruro de metileno, convirtiendo la suspensión en una solución. A la fase orgánica se añadieron aproximadamente 10 ml de solución de NaHCO₃ semisaturada, agitando vigorosamente con un agitador magnético en un matraz, precipitaron cristales poco solubles (producto), se filtraron con succión, se lavaron 3 veces con un poco de agua y 3 veces con n-heptano y se secaron.

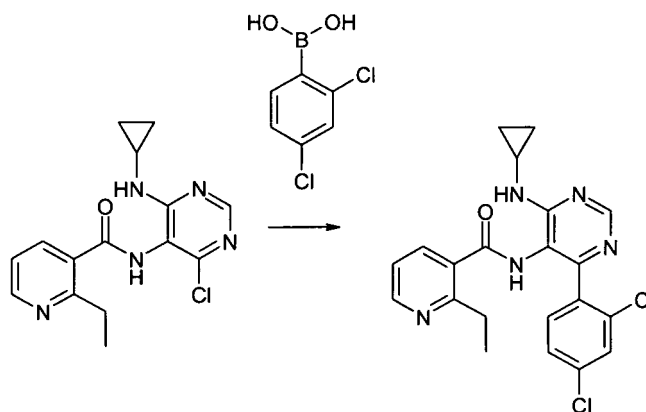
10 Fracción 1: 3,41 g, 66 %

CL/EM: M+(ES+) 318 (100 %)

RMN 0,56 (2H, m), 0,76 (2H, m), 1,25 (3H, t), 2,87 (1H, m), 2,96 (2H, c), 7,22 (1H, s), 7,32 (1H, m), 8,10 (1H, m), 8,30 (1H, m), 8,59 (1H, m), 9,55 (1H, m).

Ejemplo 3 (producto final)

15 N-[4-Ciclopropilamino-6-(2,4-diclorofenil)-pirimidin-5-il]-2-etil-nicotinamida



En un tubo de reacción desgasificado y precalentado a 100 °C se dispusieron N-(4-cloro-6-ciclopropilamino-pirimidin-5-il)-2-etil-nicotinamida (0,41 mmol), carbonato de sodio (3 eq) y 2,4-ácido diclorofenilborónico (2 eq) con la mezcla de diluyentes desgasificada dioxano (2 ml) / agua (0,7 ml). Se añadió el 5 % en moles de tetrakis(trifenilfosfina)paladio(0) y la mezcla de reacción se agitó durante 3 horas a 90 °C. A continuación se diluyó con agua, se extrajo 3 veces con cloruro de metileno, las fases orgánicas reunidas se lavaron con solución acuosa de NaHCO₃, se secaron sobre Na₂SO₄, se filtraron y se concentraron al vacío.

CL/EM M+(ES+) 430 (50 %)

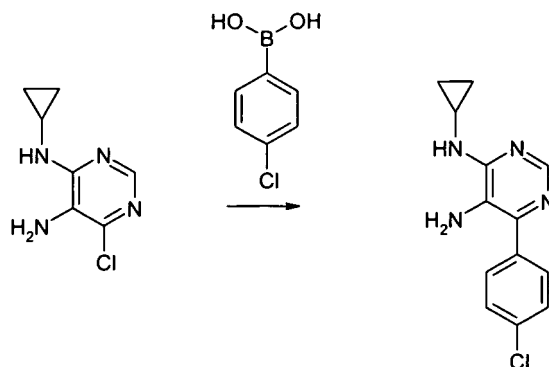
RMN DMSO 0,57 (2H, m), 0,79 (2H, m), 1,03 (3H, t), 2,91 (1H, m), 6,86 (1H, m), 7,263 (1H, m), 7,44 (2H, m), 7,61 (1H, m), 7,72 (1H, m), 8,50 (2H, m), 9,33 (1H, s).

El residuo se separó por medio de un cartucho Chromabond Flash RS 70 SiOH usando cloruro de metileno/MeOH.

CL/EM M+(ES+) 428(100 %)

Ejemplo 4 (precursor)

6-(4-Cloro-fenil)-N-ciclopropil-pirimidin-4,5-diamina



- 5 En un tubo de reacción desgasificado y precalentado a 100 °C de una bandeja giratoria del reactor se dispusieron 6-cloro-N-ciclopropil-pirimidin-4,5-diamina (10 g, 54,1 mmol), carbonato de sodio (17,22 g, 162 mmol) y se añadió la mezcla de disolventes desgasificada dioxano (20 ml) / agua (7 ml). Se añadieron el 5 % en moles de tetrakis(trifenilfosfina)paladio(0) y ácido 4-clorofenilborónico (108,2 mmol) y la mezcla de reacción se agitó durante la noche a 90 °C. La solución se enfrió, se filtró, se concentró y el residuo se cristalizó en acetonitrilo.

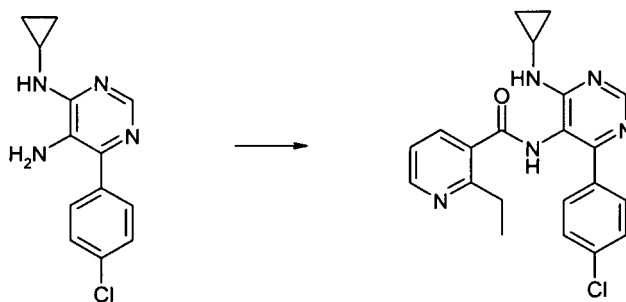
Rendimiento: 8193 mg; 58 %

- 10 CL-EM: M+(ES+)261(100 %)

RMN DMSO 0,52 (2H, m), 0,53 (2H, m), 2,89 (1H, m), 4,52 (1H, s), 6,76 (1H, s), 7,47 (2H, m), 7,65 (2H, m), 8,04 (1H, s).

Ejemplo 5 (producto final)

N-[4-(4-Cloro-fenil)-6-ciclopropilamino-pirimidin-5-il]-2-etil-nicotinamida



- 15 Se dispuso 6-(4-cloro-fenil)-N-ciclopropil-pirimidin-4,5-diamina (1,00 g, 3,83 mmol) en una mezcla de DCM (3,20 ml) y piridina (0,93 ml) y se enfrió a 0 °C. Se añadió cloruro de 2-etil-nicotinoilo (780 mg, 4,60 mmol) en forma de sólido, se dejó calentar la mezcla de reacción hasta temperatura ambiente y se agitó durante 1 hora. Tras la adición de solución semisaturada de NaHCO₃ se agitó, se separó la fase orgánica y se concentró al vacío.

- 20 El residuo se separó por medio de un cartucho Chromabond Flash RS 120 SiOH usando DCM/MeOH.

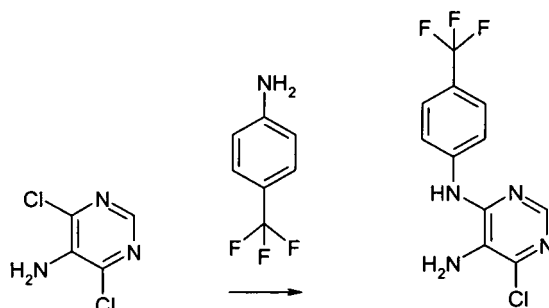
Fracción 1: 394 mg; 25 %

CL/EM M+(ES+) 394 (98 %)

RMN DMSO 0,55 (2H, m), 0,78 (2H, m), 1,063 (3H, t), 2,89 (1H, m), 6,94 (1H, s), 7,28 (1H, m), 7,45 (2H, d), 7,67 (2H, d), 7,88 (1H, d), 8,52 (2H, m), 9,37 (1H, s).

Ejemplo 66-Cloro-N⁴-[4-(trifluorometil)fenil]pirimidin-4,5-diamina

(Véase también Tetrahedron Letters., 48, 1489 (2007))



- 5 Se calentó una mezcla de 4,6-dicloroaminopirimidina (1,5 g), isopropanol (20 ml), 4-trifluorometilanilina (1,47 g) y una gota de ácido clorhídrico concentrado durante 10 min a 150 °C en un recipiente de microondas. Después de enfriar se filtró el precipitado generado.

Rendimiento: 580 mg.

En la tabla siguiente se indican otros compuestos según la invención.

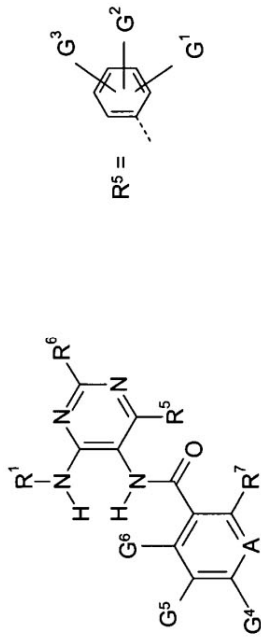
- 10 Se usaron las abreviaturas siguientes:

Ph = fenilo = Ar

R en la columna R¹ (véanse, por ejemplo, los ejemplos N° 1-222, 1-229, 1-230, 1-250, 3-7, etc.) caracteriza el sitio de unión al resto de la molécula.

Tabla 1



Compuestos de la fórmula











Ej. Nº	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	R ⁵	R ⁶	R ⁷	A	G ¹	G ²	G ³	G ⁴	G ⁵	G ⁶
1-1	ciclopropilo	CH ₃							4-F	H	H	H	H	H
1-2	ciclopropilo	CH ₃							4-OCH ₂ -C ₆ H ₃ (Cl) ₂	H	H	H	H	H
1-3	ciclopropilo	CH ₃							4-OCH ₂ -C ₆ H ₃ (Cl) ₂	H	H	H	H	H
1-4	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃							3-F	4-F	H	H	H	H
1-5	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃							2-F	4-F	H	H	H	H
1-6	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃							4-OCH ₂ -C ₆ H ₃ (Cl)	H	H	H	H	H

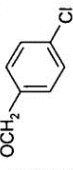
Ej. N°	R ¹	R ⁷	G ¹	G ²	G ³	R ⁶	A	G ⁴	G ⁵	G ⁶
1-7	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	4-OCH ₃	H	H	H	N	H	H	H
1-8	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	4-CH ₃	H	H	H	N	H	H	H
1-9	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	2-F	3-F	H	H	N	H	H	H
1-10	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	4-SCH ₃	H	H	H	N	H	H	H
1-11	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	2-F	H	H	H	N	H	H	H
1-12	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	3,4-OCH ₂ CH ₂ -O-		H	H	N	H	H	H
1-13	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	3-Cl	H	H	H	N	H	H	H
1-14	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	3-NH ₂	H	H	H	N	H	H	H
1-15	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	3-F	4-F	5-F	H	N	H	H	H
1-16	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	2-F	3-F	4-F	H	N	H	H	H
1-17	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	4-COCH ₃	H	H	H	N	H	H	H
1-18	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	4-C(CH ₃) ₃	H	H	H	N	H	H	H
1-19	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	4-N(CH ₃) ₂	H	H	H	N	H	H	H
1-20	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	3-Cl	4-F	H	H	N	H	H	H
1-21	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃	4-F	H	H	H	N	H	H	H
1-22	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃	4-OCF ₃	H	H	H	N	H	H	H
1-23	CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	CH ₂ CH ₃	4-OCF ₃	H	H	H	N	H	H	H
1-24	CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	CH ₂ CH ₃	4-F	H	H	H	N	H	H	H
1-25	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	2-F	3-Cl	H	H	N	H	H	H
1-26	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	3,4-OCF ₂ O		H	H	N	H	H	H
1-27	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	3-CH ₃	4-F	H	H	N	H	H	H
1-28	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	3-C(CH ₃)NOCH ₃	H	H	H	N	H	H	H
1-29	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	3-CHNOCH ₃	H	H	H	N	H	H	H








Ej. N°	R ¹	R ⁷	G ¹	G ²	G ³	R ⁶	A	G ⁴	G ⁵	G ⁶
1-30	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	2-F	5-CF ₃	H	H	N	H	H	H
1-31	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	CONH ₂	H	H	H	N	H	H	H
1-32	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	3,4-OCH ₂ CH ₂ O-		H	H	N	H	H	H
1-33	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	3-NH ₂	OCH ₃	5-NH ₂	H	N	H	H	H
1-34	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	4-CO ₂ CH ₃	H	H	H	N	H	H	H
1-35	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	3-SCH ₃	H	H	H	N	H	H	H
1-36	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	4-CH ₂ OCH ₃	H	H	H	N	H	H	H
1-37	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	2-F	4-F	5-Cl	H	N	H	H	H
1-38	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	3-CH ₂ OCH ₃	H	H	H	N	H	H	H
1-39	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	4-NHCOCH ₃	H	H	H	N	H	H	H
1-40	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	3-F	4-NH ₂	H	H	N	H	H	H
1-41	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	3-F	4-OCH ₃	H	H	N	H	H	H
1-42	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	3-F	4-CH ₃	H	H	N	H	H	H
1-43	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	2-F	4-CF ₃	H	H	N	H	H	H
1-44	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	3-F	4-Cl	H	H	N	H	H	H
1-45	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	2-F	5-COCH ₃	H	H	N	H	H	H
1-46	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	3-F	5-OCH ₃	H	H	N	H	H	H
1-47	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	2-F	5-CH ₃	H	H	N	H	H	H
1-48	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	2-F	4-OCH ₃	H	H	N	H	H	H
1-49	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	3-F	5-Cl	H	H	N	H	H	H
1-50	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	3-S(O) ₂ CH ₃	H	H	H	N	H	H	H
1-51	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	3-CN	4-F	H	H	N	H	H	H
1-52	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	2-F	3-OCH ₃	H	H	N	H	H	H

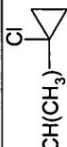

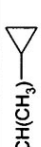

Ej. N°	R ¹	R ⁷	G ¹	G ²	G ³	R ⁶	A	G ⁴	G ⁵	G ⁶
1-53	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	3-Si(CH ₃) ₃	H	H	H	N	H	H	H
1-54	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	2-OCH ₃	4-F	H	H	N	H	H	H
1-55	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	3-NO ₂	H	H	H	N	H	H	H
1-56	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	2-Cl	5-Cl	H	H	N	H	H	H
1-57	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	3-CH ₃	5-CH ₃	H	H	N	H	H	H
1-58	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	3-Ar	H	H	H	N	H	H	H
1-59	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	2-Cl	5-Cl	H	H	N	H	H	H
1-60	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	4-CH ₂ CH ₂	H	H	H	N	H	H	H
1-61	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	2-Cl	3-Cl	H	H	N	H	H	H
1-62	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	4-Ar	H	H	H	N	H	H	H
1-63	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	3-CH ₃	4-CH ₃	H	H	N	H	H	H
1-64	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	4-O- 	H	H	H	N	H	H	H
1-65	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	2-F	4-OCH ₃	5-F	H	N	H	H	H
1-66	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	3-NH(SO ₂)CH ₃	H	H	H	N	H	H	H
1-67	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₂ - 	H	H	H	N	H	H	H
1-68	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	4-OCH(CH ₃)	H	H	H	N	H	H	H
1-69	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	3-Cl	4-Cl	5-Cl	H	N	H	H	H
1-70	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	4-NO ₂	H	H	H	N	H	H	H
1-71	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	3-F	5-NH ₂	H	H	N	H	H	H




Ej. Nº	R ¹	R ⁷	G ¹	G ²	G ³	R ⁶	A	G ⁴	G ⁵	G ⁶
1-73	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	4-OCF ₃	H	H	H	N	H	H	H
1-74	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	4-OCF ₃	H	H	H	N	H	H	H
1-75	ciclopropilo	Cl	4-OCF ₃	H	H	H	N	H	H	H
1-76	CH(CH ₃) ₂	Cl	4-OCF ₃	H	H	H	N	H	H	H
									H	H
									H	H
									H	H
									H	H
									H	H
1-82	ciclopropilo	Cl	4-CF ₃	H	H	H	N	H	H	H
1-83	ciclopropilo	CH ₃	4-CF ₃	H	H	H	N	H	H	H
1-84	ciclopropilo	CF ₃	4-CF ₃	H	H	H	N	H	H	H
1-85	ciclopropilo	CH(CH ₃) ₂	4-CF ₃	H	H	H	N	H	H	H
1-87	ciclopropilo	CH ₃	4-CF ₃	H	H	CH ₃	N	H	H	H
1-89	ciclopropilo	CH ₃	4-CF ₃	H	H	ciclopropilo	N	H	H	H
1-90	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	4-OCF ₃	H	H	H	N	H	H	H
1-91	CH(CH ₃) 	CH ₃	4-OCF ₃	H	H	H	N	H	H	H
1-92	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	CH ₃	4-OCF ₃	H	H	H	N	H	H	H
1-93	ciclopropilo	CH ₃	4-OCF ₃	H	H	H	N	H	H	H
1-94	CH(CH ₃) ₂	CH ₃	4-OCF ₃	H	H	H	N	H	H	H


Ej. N°	R ¹	R ⁷	G ¹	G ²	G ³	R ⁶	A	G ⁴	G ⁵	G ⁶
1-95	CH(CH ₃) 	CH ₃	4-OCF ₃	H	H	H	N	H	H	H
1-96	ciclopropilo	CH ₃	4-OCF ₃	H	H	H	N	H	H	H
1-97	ciclopropilo	CH ₃	4-OCF ₃	H	H	C(CH ₃)	N	H	H	H
1-98	ciclopropilo	CH ₃	4-OCF ₃	H	H	4-Cl-Ph	N	H	H	H
1-99	CH(CH ₃) 	Cl	4-OCF ₃	H	H	H	N	H	H	H
1-100	C(CH ₃) ₂ 	CH ₃	4-OCF ₃	H	H	H	N	H	H	H
1-101	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	CH ₃	4-OCF ₃	H	H	H	N	H	H	H
1-102	CH(CH ₃)CH ₂ CH ₃	Cl	4-OCF ₃	H	H	H	N	H	H	H
1-103	CH ₂ 	CH ₃	4-OCF ₃	H	H	H	N	H	H	H
1-104	CH ₂ 	Cl	4-OCF ₃	H	H	H	N	H	H	H
1-105	C(CH ₃) ₃	Cl	4-OCF ₃	H	H	H	N	H	H	H
1-106	CH(CH ₂ CH ₃) ₂	CH ₃	4-OCF ₃	H	H	H	N	H	H	H
1-107	CH(CH ₂ CH ₃) ₃	Cl	4-OCF ₃	H	H	H	N	H	H	H
1-108	CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₂	CH ₃	4-OCF ₃	H	H	H	N	H	H	H
1-109	CH(CH ₃)CH(CH ₃) ₃	Cl	4-OCF ₃	H	H	H	N	H	H	H
1-110	CH() ₂	CH ₃	4-OCF ₃	H	H	H	N	H	H	H
1-111	CH() ₂	Cl	4-OCF ₃	H	H	H	N	H	H	H


Ej. N°	R ¹	R ⁷	G ¹	G ²	G ³	R ⁶	A	G ⁴	G ⁵	G ⁶
1-114	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	4-SCF ₃	H	H	H	N	H	H	H
1-115	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	3-NH ₂	4-OCH(CH ₃) ₂	H	H	N	H	H	H
1-116	ciclopropilo	CH ₃	4-SCF ₃	H	H	H	N	H	H	H
1-117	ciclopropilo	CH ₃	S(O)CF ₃	H	H	H	N	H	H	H
1-118	ciclopropilo	CH ₃	S(O)CHP ₂	H	H	H	N	H	H	H
1-119	ciclopropilo	CH ₃		H	H	H	N	H	H	H
1-120	ciclopropilo	CH ₃	OCF ₃	CH ₃	H	H	N	H	H	H
1-121	ciclopropilo	CH ₃	4-OSO ₂ CH(CH ₃) ₂	H	H	H	N	H	H	H
1-122	ciclopropilo	CH ₃	3-F	4-CF ₃	5-F	H	N	H	H	H
1-123	ciclopropilo	CH ₃	4-OCF ₂ CHF ₂ CF ₃	4-CF ₃	H	H	N	H	H	H
1-124	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	4-F	H	H	H	N	H	H	H
1-125	CH ₃	CH ₂ CH ₃	4-F	H	H	H	N	H	H	H
1-126	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	2-Cl	4-Cl	H	H	N	H	H	H
1-127	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	H	H	H	H	N	H	H	H
1-128	ciclopropilo	H	H	H	H	H	N	H	H	H
1-129	ciclopropilo	Cl	4-F	H	H	H	N	H	H	H
1-130	ciclopropilo	Cl	4-Cl	H	H	H	N	H	H	H
1-131	ciclopropilo	Br	4-Cl	H	H	H	N	H	H	H
1-132	ciclopropilo	Br	4-F	H	H	H	N	H	H	H
1-133	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	4-CN	H	H	H	N	H	H	H



Ej. N°	R ¹	R ⁷	G ¹	G ²	G ³	R ⁶	A	G ⁴	G ⁵	G ⁶
1-134	C(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₃	4-F	H	H	H	N	H	H	H
1-135	C(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₃	4-Cl	H	H	H	N	H	H	H
1-136	C(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₃	4-CN	H	H	H	N	H	H	H
1-137	C(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₃	4-CF ₃	H	H	H	N	H	H	H
1-138	C(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₃	OCF ₃	H	H	H	N	H	H	H
1-139	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	2-Cl	4-F	H	H	N	H	H	H
1-140	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	2-Cl	H	H	H	N	H	H	H
1-141	C(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₃	3-NH ₂	4-F	H	H	N	H	H	H
1-142	C(CH ₃) ₃	CH ₂ CH ₃	2-Cl	4-Cl	H	H	N	H	H	H
1-143	CH(CH ₃) 	CH ₂ CH ₃	4-F	H	H	H	N	H	H	H
1-144	CH(CH ₃) 	CH ₂ CH ₃	4-Cl	H	H	H	N	H	H	H
1-145	CH(CH ₃) 	CH ₂ CH ₃	4-CN	H	H	H	N	H	H	H
1-146	CH(CH ₃) 	CH ₂ CH ₃	4-OCF ₃	H	H	H	N	H	H	H
1-147	CH(CH ₃) 	CH ₂ CH ₃	4-F	H	H	H	N	H	H	H
1-148	CH(CH ₃) 	CH ₂ CH ₃	2-Cl	4-Cl	H	H	N	H	H	H
1-149	CH(CH ₃) 	CH ₂ CH ₃	4-Cl	H	H	H	N	H	H	H

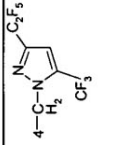
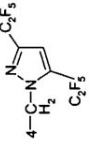

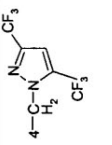
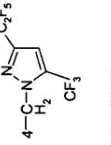
Ej. N°	R ¹	R ⁷	G ¹	G ²	G ³	R ⁶	A	G ⁴	G ⁵	G ⁶
1-150		CH ₂ CH ₃	4-CN	H	H	H	N	H	H	H
1-151		CH ₂ CH ₃	4-Cl	H	H	H	N	H	H	H
1-152		CH ₂ CH ₃	H	H	H	H	N	H	H	H
1-153	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	3—CONH— 	H	H	H	N	H	H	H
1-154	ciclopropilo	OCH ₃	4-Cl	H	H	H	N	H	H	H
1-155	ciclopropilo	OCH ₃	4-F	H	H	H	N	H	H	H
1-156	ciclopropilo	OCH ₃	4-CN	H	H	H	N	H	H	H
1-157	ciclopropilo	OCH ₃	4-OCF ₃	H	H	H	N	H	H	H
1-158	ciclopropilo	OCH ₂ CH ₃	4-Cl	H	H	H	N	H	H	H
1-159	ciclopropilo	OCH ₂ CH ₃	4-F	H	H	H	N	H	H	H
1-160	ciclopropilo	OCH ₂ CH ₃	4-CN	H	H	H	N	H	H	H
1-161	ciclopropilo	OCH ₂ CH ₃	4-OCF ₃	H	H	H	N	H	H	H
1-162	ciclopropilo	O(CH ₃) ₂	4-Cl	H	H	H	N	H	H	H
1-163	ciclopropilo	OCH(CH ₃) ₂	4-F	H	H	H	N	H	H	H
1-164	ciclopropilo	OCH(CH ₃) ₂	4-CN	H	H	H	N	H	H	H
1-165	ciclopropilo	OCH(CH ₃) ₂	4-OCF ₃	H	H	H	N	H	H	H
1-166	ciclopropilo	OCH ₂ CF ₃	4-Cl	H	H	H	N	H	H	H
1-167	ciclopropilo	OCH ₂ CF ₃	4-F	H	H	H	N	H	H	H
1-168	ciclopropilo	OCH ₂ CF ₃	4-CN	H	H	H	N	H	H	H
1-169	ciclopropilo	OCH ₂ CF ₃	4-OCF ₃	H	H	H	N	H	H	H

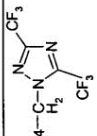
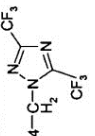
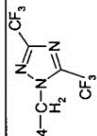
Ej. N°	R ¹	R ⁷	G ¹	G ²	G ³	R ⁶	A	G ⁴	G ⁵	G ⁶
1-170	ciclopropilo	CF ₃	4-F	H	H	H	N	H	H	H
1-171	ciclopropilo	CN	4-F	H	H	H	N	H	H	H
1-172	ciclopropilo	CH ₂ - 	4-H	H	H	H	N	H	H	H
1-173	ciclopropilo	CH ₂ - 	4-Cl	H	H	H	N	H	H	H
1-174	ciclopropilo	CHFCH ₃	4-Cl	H	H	H	N	H	H	H
1-175	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	3-CONH- 	H	H	H	N	H	H	H
1-176	ciclopropilo	CH ₂ CF ₃	4-Cl	H	H	H	N	H	H	H
1-177	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	4-Cl	H	H	H	N	H	H	H
1-178	ciclopropilo	CF ₃	4-Cl	H	H	H	N	H	H	H
1-179	ciclopropilo	CF ₂ H	4-Cl	H	H	H	N	H	H	H
1-180	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	2-CH ₃	4-F	H	H	N	H	H	H
1-181	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	2-CH ₃	4-CN	H	H	N	H	H	H
1-182	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	2-CH ₃	H	H	H	N	H	H	H
1-183	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	2-CH ₃	3-NH ₂	4-F	H	N	H	H	H
1-184	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	2-CH ₃	5-F	H	H	N	H	H	H
1-185	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	4-OCF ₃	H	H	H	N	H	H	H
1-186	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	4-CF ₃	H	H	H	N	H	H	H
1-187	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	2-F	4-Cl	H	H	N	H	H	H
1-188	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	2-CH ₃	4-Cl	H	H	N	H	H	H
1-189	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	2-CH ₃	4-CF ₃	H	H	N	H	H	H

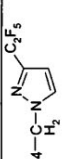
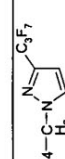
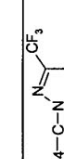
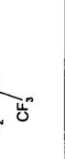
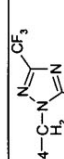
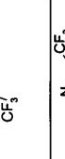
Ej. N°	R ¹	R ⁷	G ¹	G ²	G ³	R ⁶	A	G ⁴	G ⁵	G ⁶
1-190	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃		H	H	H	N	H	H	H
1-191	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	2-CH ₃	4-OCF ₃	H	H	N	H	H	H
1-192	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	4-Cl	H	H	H	N	H	Cl	H
1-193	ciclopropilo	CH ₃	4-OCF ₃	H	H	H	N	CF ₃	H	H
1-194	ciclopropilo	CHFCH ₃	4-Cl	H	H	H	N	H	Cl	H
1-195	ciclopropilo	CH ₃	4-Cl	H	H	H	N	CH ₃	H	CH ₃
1-196	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	4-F	H	H	H	N	CF ₃	H	H
1-197	ciclopropilo	ciclopropilo	4-Cl	H	H	H	N	H	Cl	H
1-198	ciclopropilo	ciclopropilo	4-F	H	H	H	N	H	Cl	H
1-199	ciclopropilo	CH ₃	4-Cl	H	H	H	N	CF ₃	H	H
1-200	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	4-Cl	H	H	H	N	H	H	CF ₃
1-201	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	4-F	H	H	H	N	H	H	CF ₃
1-202	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	4-CN	H	H	H	N	H	H	CF ₃
1-203	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	4-CF ₃	H	H	H	N	H	H	CF ₃
1-204	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	4-OCF ₃	H	H	H	N	H	H	CF ₃
1-205	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	2-F	4-F	H	H	N	H	H	CF ₃
1-206	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	2-Cl	4-Cl	H	H	N	H	H	CF ₃
1-207	ciclopropilo	CH ₃	4-Cl	H	H	H	N	H	H	CF ₃
1-208	ciclopropilo	CH ₃	4-F	H	H	H	N	H	H	CF ₃
1-209	ciclopropilo	CH ₃	4-CN	H	H	H	N	H	H	CF ₃
1-210	ciclopropilo	CH ₃	4-CF ₃	H	H	H	N	H	H	CF ₃

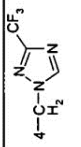
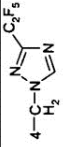
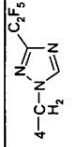
Ej. N°	R ¹	R ⁷	G ¹	G ²	G ³	R ⁶	A	G ⁴	G ⁵	G ⁶
1-211	ciclopropilo	CH ₃	4-OCF ₃	H	H	H	N	H	H	CF ₃
1-212	ciclopropilo	CH ₃	2-F	4-F	H	H	N	H	H	CF ₃
1-213	ciclopropilo	CH ₃	2-Cl	4-Cl	H	H	N	H	H	CF ₃
1-214	ciclopropilo	ciclopropilo	4-Cl	H	H	H	N	H	H	CF ₃
1-215	ciclopropilo	ciclopropilo	4-F	H	H	H	N	H	H	CF ₃
1-216	ciclopropilo	ciclopropilo	4-CN	H	H	H	N	H	H	CF ₃
1-217	ciclopropilo	ciclopropilo	4-CF ₃	H	H	H	N	H	H	CF ₃
1-218	ciclopropilo	ciclopropilo	4-OCF ₃	H	H	H	N	H	H	CF ₃
1-219	ciclopropilo	ciclopropilo	2-F	4-F	H	H	N	H	H	CF ₃
1-220	ciclopropilo	ciclopropilo	2-Cl	4-Cl	H	H	N	H	H	CF ₃
1-221	CH(CH ₃) ₂	CH ₂ CH ₃	4-Cl	H	H	H	N	H	H	H
1-222		CH ₂ CH ₃	2-F	4-F	H	H	N	H	H	H
1-223	CH(CH ₃)CH ₂ SCH ₃	CH ₂ CH ₃	4-Cl	H	H	H	N	H	H	H
1-224	ciclobutilo	CH ₂ CH ₃	4-F	H	H	H	N	H	H	H
1-225	ciclobutilo	CH ₂ CH ₃	2-F	4-F	H	H	N	H	H	H
1-226	ciclobutilo	CH ₂ CH ₃	4-Cl	H	H	H	N	H	H	H
1-227	ciclopentilo	CH ₂ CH ₃	4-F	H	H	H	N	H	H	H

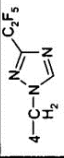
Ej. N°	R ¹	R ⁷	G ¹	G ²	G ³	R ⁶	A	G ⁴	G ⁵	G ⁶
1-228	ciclopentilo	CH ₂ CH ₃	2-F	4-F	H	H	N	H	H	H
1-229		CH ₂ CH ₃	4-F	H	H	H	N	H	H	H
1-230		CH ₂ CH ₃	2-F	4-Cl	H	H	N	H	H	H
1-231	ciclobutilo	CH ₂ CH ₃	2-F	4-Cl	H	H	N	H	H	H
1-232	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	4-iC ₃ F ₇	H	H	H	N	H	H	H
1-233	ciclopropilo	ciclopropilo	4-iC ₃ F ₇	H	H	H	N	H	H	H
1-234	ciclopropilo	ciclopropilo	H	H	H	H	N	H	H	H
1-235	ciclopropilo	ciclopropilo	4-F	H	H	H	N	H	H	H
1-236	ciclopropilo	ciclopropilo	4-Cl	H	H	H	N	H	H	H
1-237	ciclopropilo	propilo	H	H	H	H	N	H	H	H
1-238	ciclopropilo	propilo	4-F	H	H	H	N	H	H	H
1-239	ciclopropilo	propilo	4-Cl	H	H	H	N	H	H	H
1-240	ciclopropilo	ciclopropilo	2-F	4-F	H	H	N	H	H	H
1-241	ciclopropilo	C ₂ F ₅	4-Cl	H	H	H	N	H	H	H
1-242	ciclopropilo	ciclopropilo	4-CN	H	H	H	N	H	H	H

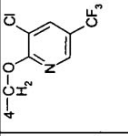
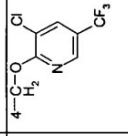
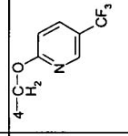
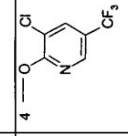
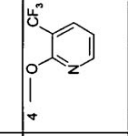
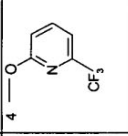
Ej. N°	R ¹	R ⁷	G ¹	G ²	G ³	R ⁶	A	G ⁴	G ⁵	G ⁶
1-243	ciclopropilo	ciclopropilo	4-OCF ₃	H	H	H	N	H	H	H
1-244	ciclopropilo	propilo	2-Cl	4-Cl	H	H	N	H	H	H
1-245	ciclopropilo	propilo	2-F	4-F	H	H	N	H	H	H
1-246	ciclopropilo	propilo	4-CN	H	H	H	N	H	H	H
1-247	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃		H	H	H	N	H	H	H
1-248	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃		H	H	H	N	H	H	H
1-249	ciclopropilo	C ₃ F ₇	4-Cl	H	H	H	N	H	H	H
1-250		CH ₂ CH ₃	4-Cl	H	H	H	N	H	H	H
1-251	ciclopropilo	C ₃ F ₇	4-F	H	H	H	N	H	H	H
1-252	ciclopropilo	ciclopropilo		H	H	H	N	H	H	H
1-253	ciclopropilo	ciclopropilo		H	H	H	N	H	H	H

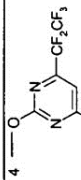
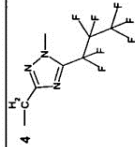
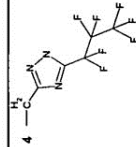
Ej. Nº	R ¹	R ⁷	G ¹	G ²	G ³	R ⁶	A	G ⁴	G ⁵	G ⁶
1-254	ciclopropilo	CH ₂ CF ₃	2-F	4-F	H	H	N	H	H	H
1-258	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃		H	H	H	N	H	H	H
1-259	ciclopropilo	ciclopropilo		H	H	H	N	H	H	H
1-260	ciclopropilo	C ₂ F ₅	2-F	4-F	H	H	N	H	H	H
1-261	ciclopropilo	C ₂ F ₅	4-F	H	H	H	N	H	H	H
1-262	ciclopropilo	C(=O)NHCH(CH ₂) ₂	4-F	H	H	H	N	H	H	H
1-264	ciclopropilo	CH ₂ CH ₂ CH ₃		H	H	H	N	H	H	H

Ej. N°	R ¹	R ⁷	G ¹	G ²	G ³	R ⁶	A	G ⁴	G ⁵	G ⁶
1-266	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃		H	H	H	N	H	H	H
1-267	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃		H	H	H	N	H	H	H
1-268	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃		H	H	H	N	H	H	H
1-269	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃		H	H	H	N	H	H	H
1-270	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	2-F	4-F	H	SCH ₃	N	H	H	H
1-271	ciclopropilo	OCF ₃	2-F	4-F	H	H	N	H	H	H
1-272	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃		H	H	H	N	H	H	H
1-273	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃		H	H	H	N	H	H	H
1-274	CH(CF ₃)CH ₃	CH ₂ CH ₃	2-F	4-F	H	H	N	H	H	H
1-275	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	H	H	H	CH ₃	N	H	H	H
1-276	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	4-F	H	H	CH ₃	N	H	H	H

Ej. N°	R ¹	R ⁷	G ¹	G ²	G ³	R ⁶	A	G ⁴	G ⁵	G ⁶
1-277	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	2-Cl	4-Cl	H	CH ₃	N	H	H	H
1-278	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	2-F	4-F	H	CH ₃	N	H	H	H
1-279	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	4-OCF ₃	H	H	CH ₃	N	H	H	H
1-281	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	4-F	H	H	CH ₃	N	H	H	H
1-282	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	4-Cl	H	H	CH ₃	N	H	H	H
1-283	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	2-Cl	4-Cl	H	CH ₃	N	H	H	H
1-284	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	2-Cl	4-Cl	H	CH ₃	N	H	H	H
1-285	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	2-Cl	4-Cl	H	CH ₃	N	H	H	H
1-287	ciclopropilo	ciclopropilo		H	H	H	N	H	H	H
1-288	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃		H	H	H	N	H	H	H
1-289	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	4-CN	H	H	CH ₃	N	H	H	H
1-290	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃		H	H	SCH ₃	N	H	H	H

Ej.Nº	R ¹	R ⁷	G ¹	G ²	G ³	R ⁶	A	G ⁴	G ⁵	G ⁶
1-292	ciclopropilo	ciclopropilo	 4-C-N ₂ C ₂ F ₅	H	H	H	N	H	H	H
1-299	CH(CF ₃)CH ₃	CH ₂ CH ₃	4-F	H	H	H	N	H	H	H
1-301	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	4-Cl	H	H	CH ₃	N	H	H	H

Ej. N°	R ¹	R ⁷	G ¹	G ²	G ³	R ⁶	A	G ⁴	G ⁵	G ⁶
1-305	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃		H	H	H	N	H	H	H
1-306	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃		H	H	H	N	H	H	H
1-307	ciclopropilo	CH ₂ CF ₃	4-F	H	H	H	N	H	H	H
1-308	ciclopropilo	CHF ₂ CF ₃	4-F	H	H	H	N	H	H	H
1-309	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃		H	H	H	N	H	H	H
1-310	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃		H	H	H	N	H	H	H
1-311	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃		H	H	H	N	H	H	H
1-312	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃		H	H	H	N	H	H	H

Ej. N°	R ¹	R ⁷	G ¹	G ²	G ³	R ⁶	A	G ⁴	G ⁵	G ⁶
1-313	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	4-F	H	H	CF ₃	N	H	H	H
1-314	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	2-F	4-F	H	CF ₃	N	H	H	H
1-315	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	4-F	H	H	H	N	H	H	Cl
1-316	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	4-Cl	H	H	H	N	H	H	Cl
1-317	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	4-O- 	H	H	H	N	H	H	H
1-318	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	4- 	H	H	H	N	H	H	H
1-319	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	4- 	H	H	H	N	H	H	H
1-322	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	4-F	H	H	H	N	H	F	H
1-323	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	4-F	H	H	H	N	H	Cl	H

Ej. Nº	R ¹	R ⁷	G ¹	G ²	G ³	R ⁶	A	G ⁴	G ⁵	G ⁶
1-324	ciclopropilo	CH ₂ CF ₃	4-F	H	H	CF ₃	N	H	H	H
1-325	ciclopropilo	CH ₂ CF ₃	4-F	H	H	Cl	N	H	H	H
1-326	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	4-F	H	H	Cl	N	H	H	H

Tabla 2: caracterización fisicoquímica

Ej. N°	MH+	LogP(HCOOH)	RMN (400 MHz, DMSO-d6, si no se indica lo contrario)
1-1	364,2	0,71	(MeOH d4); 0,68 (2H, m), 0,90 (2H, m), 2,38 (3H, s), 2,94 (1H, m), 7,22 (2H, t), 7,35 (1H, m), 7,61 (2H, m), 7,95 (1H, m), 8,49 (1H, m), 8,59 (1H, s).
1-2	538,1	2,31	
1-3	538,1	2,27	
1-4	396,2	1,34	
1-5	396,0		0,56 (2H, m), 0,78 (2H, m), 1,06 (3H, t), 2,90 (1H, m), 6,88 (1H, s), 7,11 (1H, m), 7,22 (2H, m), 7,50 (1H, m), 7,74 (1H, m), 8,52 (2H, m), 9,36 (1H, s).
1-8	374,2		
1-9	396,1		
1-10	406,1		
1-11	378,1		
1-12	404,1		
1-13	394,1		
1-14	361,1		(MeCN d3); 0,56 (2H, m), 0,80 (2H, m), 1,13 (3H, t), 2,67 (2H, c), 2,89 (1H, m), 6,12 (1H, m), 7,22 (1H, m), 7,41 (1H, m), 7,69 (1H, m), 7,97 (1H, m), 8,08 (1H, s), 8,58 (3H, m), 8,81 (1H, m).
1-73	430,0	1,45	0,60 (m, 2H), 0,78 (m, 2H), 2,24 (s, 3H), 2,91 (m, 1H), 7,29 (m, 1H), 7,39 (d, 2H), 7,76 (d, 2H), 7,95 (d, 1H), 8,49 (m, 1H), 8,56 (m, 1H), 9,56 (s, 1H).
1-74	432,1	1,55	1,26 (d, 6H), 2,36 (s, 3H), 4,41 (m, 1H), 5,75 (m, 1H), 7,31 (m, 1H), 7,40 (m, 2H), 7,78 (m, 2H), 7,99 (m, 1H), 8,01 (m, 1H), 8,49 (m, 1H).
1-75	450,1	1,99	0,78 (m, 2H), 0,89 (m, 2H), 3,15 (m, 1H), 7,34 (m, 3H), 7,76 (m, 2H), 7,95 (m, 1H), 8,40 (m, 1H), 8,60 (m, 1H), 9,42 (m, 1H).
1-76	452,1	2,05	1,27 (d, 6H), 4,40 (m, 1H), 7,13 (m, 1H), 7,48 (m, 3H), 7,77 (m, 2H), 7,90 (m, 1H), 8,48 (m, 1H), 8,64 (m, 1H), 10,02 (m, 1H).
1-82	434,0	1,94	0,54 (m, 2H), 0,80 (m, 2H), 2,91 (m, 1H), 6,81 (m, 1H), 7,50 (m, 1H), 7,78 (d, 2H), 7,99 (d, 1H), 8,06 (m, 1H), 8,46 (m, 1H), 8,56 (m, 1H), 8,57 (m, 1H), 9,72 (s, 1H),
1-83	414,1	1,43	0,58 (m, 2H), 0,77 (m, 2H), 2,21 (s, 3H), 2,90(m, 1H), 7,14 (m, 1H), 7,28 (m, 1H), 7,76 (d, 2H), 7,84 (d, 2H), 8,11 (m, 1H), 8,47 (m, 1H), 8,54 (m, 1H), 9,45 (s, 1H).
1-84	468,1	2,19	

ES 2 464 738 T3

(continuación)

Ej. N°	MH+	LogP(HCOOH)	RMN (400 MHz, DMSO-d6, si no se indica lo contrario)
1-85	442,1	2,02	0,57 (m, 2H), 0,78 (m, 2H), 1,01 (d, 6H), 2,89 (m, 1H), 7,05 (m, 1H), 7,23 (m, 1H), 7,76 (d, 2H), 7,83 (d, 2H), 7,85 (d, 2H), 8,54 (s, 1H), 9,70 (s, 1H).
1-87	428,2	1,27	
1-89	455,1	1,72	0,62 (m, 2H), 0,78 (m, 2H), 1,07 (m, 2H), 1,15 (m, 2H), 1,25 (m, 1H), 2,21 (s, 3H), 2,95 (m, 1H), 7,33 (m, 1H), 7,80 (m, 5H), 7,86 (m, 1H), 8,49 (m, 1H), 9,70 (s, 1H),
1-99	478,0	2,44	0,31 (m, 1H), 0,36 (m, 1H), 0,45 (, 1H), 0,50 (m, 1H), 1,00 (m, 1H), 1,20 (d, 3H), 3,76 (m, 1H), 5,81 (m, 1H), 7,39 (m, 3H), 7,70 (m, 3H), 8,24 (s, 1H), 8,45 (s, 2H),
1-100	458,1	1,80	0,31 (m, 1H), 0,36 (m, 1H), 0,45 (m, 1H), 0,50 (m, 1H), 1,10 (m, 1H), 1,28 (d, 3H), 3,80 (m, 1H), 6,59 (m, 1H), 7,30 (m, 2H), 7,41 (m, 2H), 7,79 (m, 2H), 8,44 (s, 1H), 8,50 (s, 1H), 9,49 (s, 1H),
1-111	504,1	2,65	0,36 (m, 4H), 0,50 (m, 4H), 1,11 (m, 2H), 3,56 (m, 1H), 6,21 (m, 1H), 7,44 (m, 2H), 7,53 (m, 2H), 7,79 (m, 2H), 8,42 (s, 1H), 8,50 (s, 1H), 9,91 (s, 1H),
1-114	460	1,4	0,56 (2H, m), 0,78 (2H, m), 1,04 (3H, t), 2,91 (1H, m), 7,00 (1H, m), 7,26 (1H, m), 7,74 (4H, m), 7,85 (1H), 8,54 (2H, m), 9,42 (1H, s),
1-115	419	1,40	0,55 (2H, m), 0,77 (2H, m), 1,04 (3H, t), 2,55 (2H, c), 2,89 (1H, m), 6,74 (1H, d), 6,96 (1H, m), 7,28 (1H, m), 7,92 (2H, m), 8,44 (1H, m), 8,55 (2H,m),9,41 (1H,s),
1-116	446	1,81	0,58 (2H, m), 0,79 (2H, m), 2,23 (3H, s), 2,90 (1H, m), 7,10 (1H, s), 7,25 (1H, m), 7,75 (4H, m), 7,85 (1H, m), 8,48 (1H, m), 8,54 (1H, s), 9,41 (1H, s),
1-117	477	1,65	
1-119	485	1,80	0,55 (2H, m), 0,76 (2H, m), 2,32 (3H, s), 2,88 (1H, m), 5,13 (2H, s), 6,87 (1H, m), 7,01 (2H, d), 7,25 (1H, m), 7,42 (4H, m), 7,64 (2H, d), 7,88 (1H, m), 8,49 (1H, m), 9,34 (1H, s),
1-120	444	1,52	
1-121	467	1,15	
1-122	450	1,95	0,58 (2H, m), 0,78 (2H, m), 2,91 (1H, m), 7,33 (2H, m), 7,61 (2H, m), 7,95 (1H, m), 8,52 (1H, m), 8,57 (1H, s), 9,41 (1H, s),
1-123	512	1,79	0,58 (2H, m), 0,77 (2H, m), 2,25 (3H, s), 6,33 (1H, m), 7,04 (1H, m), 7,29 (3H, m), 7,74 (2H, m), 7,90 (1H, m), 8,48 (1H, m), 8,83 (1H, s), 9,39 (1H, s),
1-124	378	1,03	

ES 2 464 738 T3

(continuación)

Ej. N°	MH+	LogP(HCOOH)	RMN (400 MHz, DMSO-d6, si no se indica lo contrario)
1-126	329	1,60	0,57 (2H, m), 0,79 (2H, m), 1,03 (3H, t), 2,91 (1H, m), 6,86 (1H, m), 7,263 (1H, m), 7,44 (2H, m), 7,61 (1H, m), 7,72 (1H, m), 8,50 (2H, m), 9,33 (1H, s),
1-127	360	1,01	0,55 (2H, m), 0,76 (2H, m), 1,06 (3H, t), 2,55 (2H, c), 2,89 (1H, m), 6,86 (1H, m), 7,25 (1H, m), 7,37 (3H, m), 7,62 (2H, m), 7,84 (1H, m), 8,52 (2H, m), 9,38 (1H, s),
1-128	332	0,63	0,56 (2H, m), 0,73 (2H, m), 2,86 (1H, m), 7,17 (1H, s), 7,30 (3H, m), 7,46 (1H, m), 7,62 (2H, m), 8,10 (1H, m), 8,52 (1H, s), 8,67 (1H, m), 8,96 (1H, m), 9,65 (1H, s),
1-129	384	1,27	0,54 (2H, m), 0,79 (2H, m), 2,90 (1H, m), 6,64 (1H, m), 7,23 (2H, m), 7,51 (1H, m), 7,70 (2H, m), 7,94 (1H, m), 8,47 (1H, m), 8,53 (1H, s), 9,69 (1H, s),
1-130	401	1,55	0,61 (2H, m), 0,85 (2H, m), 3,00 (1H, m), 7,47 (1H, m), 7,53 (2H, m), 7,69 (2H, m), 8,02 (1H, m), 8,48 (1H, m), 8,65 (1H, s),
1-133	385,2	1,10	0,56 (2H, m), 0,78 (2H, m), 1,04 (3H, t), 2,89 (1H, m), 7,07 (1H, m), 7,27 (1H, m), 7,84 (6H, m), 8,55 (2H, m), 9,40 (1H, s),
1-134	394,2	1,53	1,34 (3H, t), 1,48 (9H, s), 2,67 (2H, c), 5,78 (1H, s), 7,29 (3H, m), 7,60 (1H, m), 7,68 (2H, m), 8,48 (1H, s), 8,56 (1H, m), 9,61 (1H, s),
1-135	410,1	1,86	1,31 (3H, t), 1,48 (9H, s), 2,65 (1H, s), 5,81 (1H, s), 7,30 (1H, m), 7,50 (2H, m), 7,64 (3H, m), 8,48 (1H, s), 8,55 (1H, s), 9,61 (1H, s),
1-136	401,2	1,81	1,11 (3H, t), 1,48 (9H, s), 2,61 (2H, c), 5,93 (1H, s), 7,30 (1H, m), 7,61 (1H, m), 7,81 (2H, d), 7,88 (2H, d), 8,51 (1H, s), 8,55 (1H, m), 9,64(1H,s),
1-137	444,2	2,34	1,08 (3H, t), 1,49 (9H, s), 2,57 (2H, c), 5,88 (1H, s), 7,30 (1H, m), 7,61 (1H, m), 7,82 (4H, m), 8,51 (1H, s), 8,54 (1H, s), 9,65 (1H, s),
1-138	460,2	2,32	1,11 (2H, c), 1,48 (9H, s), 2,63 (2H, c), 5,82 (1H, s), 7,29(1H, m), 7,39 (2H, m), 7,58 (1H, m), 7,75 (2H, m), 8,49 (1H, s), 8,55 (1H, m), 9,63 (1H, s),
1-139	412,1	0,79	0,56 (2H, m), 0,78 (2H, m), 1,04 (3H, t), 2,90 (1H, m), 6,82 (1H, m), 7,23 (2H, m), 7,44 (2H, m), 7,67 (1H, m), 8,50 (2H, m), 9,30 (1H, m),
1-140	394,1	1,07	1,19 (2H, m) 0,78 (2H, m), 1,03 (3H, t), 2,91 (1H, m), 6,80 (1H, m), 7,37 (1H, m), 7,37 (3H, m), 7,49 (1H, m), 7,62 (1H, m), 8,48 (1H, m), 8,53 (1H, m), 9,28 (1H, m),
1-141	395,2	1,65	1,12 (3H, t), 1,48 (9H, s), 2,66 (2H, c), 5,97 (1H, s), 7,24 (1H, m), 7,30 (1H, m), 7,62 (1H, m), 8,20 (1H, m), 8,50 (2H, m), 8,55 (1H, m), 9,64 (1H, s),
1-142	444,1	1,89	1,08 (3H, t), 1,48 (9H, s), 5,84 (1H, s), 7,26 (1H, m), 7,42 (3H, m), 7,64 (1H, m), 8,48 (1H, s), 8,52 (1H, m), 9,56 (1H, s),
1-143	406,2	1,47	0,41 (4H, m), 1,03 (1H, m), 1,12 (3H, t), 1,25 (3H, d), 2,67 (2H, c), 3,79 (1H, m), 6,40 (1H, d), 7,23 (2H, t), 7,29 (2H, m), 7,72 (3H, m), 8,42 (1H, s), 8,55 (1H, m), 9,48 (1H, s),
1-144	422,1	1,62	0,45 (4H, m), 1,05 (1H, m), 1,13 (3H, t), 1,24 (3H, d), 2,65 (2H, c), 3,77 (1H, m), 6,43 (1H, d), 7,30 (1H, m), 7,48 (2H, d), 7,67 (2H, d), 7,76 (1H, d), 8,42 (1H, s), 8,56 (1H, d), 9,49 (1H, s),

ES 2 464 738 T3

(continuación)

Ej. N°	MH+	LogP(HCOOH)	RMN (400 MHz, DMSO-d6, si no se indica lo contrario)
1-145	413,2	1,67	0,40 (4H, m), 1,10 (4H, m), 1,24 (3H, d), 2,61 (2H, c), 3,79(1H, m), 6,59 (1H, d), 7,31 (1H, m), 7,76 (1H, m), 7,84 (4H, m), 8,45 (1H, s), 8,56 (1H, m), 9,51 (1H, s),
1-146	472,2	2,18	0,47 (4H, m) 1,09 (3H, t), 1,26 (3H, d), 2,62 (2H, c), 3,79 (1H, m), 6,45 (1H, d), 7,29 (1H, m), 7,40 (2H, d), 7,76 (3H, m), 8,43 (1H, s), 8,55 (1H, m), 9,51 (1H, s),
1-147	441,1	1,95	1,13 (4H, m), 1,35 (3H, d), 2,71 (2H, c), 4,25 (1H, m), 6,26 (1H, d), 7,26 (3H, m), 7,63 (1H, m), 7,72 (2H, m), 8,48 (1H, s), 8,55 (1H, m), 9,68 (1H, s),
1-148	490,1	2,67	1,09 (4H, m), 1,37 (2H, d), 2,59 (1H, m), 4,22 (1H, m), 6,25 (1H, d), 7,27 (1H, m), 7,44 (1H, m), 7,50 (2H, m), 7,66 (1H, m), 8,50 (1H, s), 8,54 (1H, m), 9,67 (1H, s),
1-149	458,1	2,26	1,16 (4H, m); 1,35 (3H, d), 2,70 (2H, c), 4,25 (1H, m) 6,30 (1H, m), 7,32 (1H, m), 7,51 (2H, d), 7,68 (3H, m), 8,49 (1H, s), 8,56 (1H, m), 9,69 (1H, s),
1-150	449,1	2,08	1,19 (4H, m), 1,35 (3H, d), 2,66 (1H, m), 4,3 (1H, m), 6,43 (1H, d), 7,32 (1H, m), 7,69 (4H, m), 8,52 (1H, s), 8,57 (1H, m), 9,71 (1H, s),
1-151	436,2	2,22	0,41 (6H, m), 1,13 (3H, t), 1,37 (4H, m), 1,50 (1H, m), 2,69 (2H, c), 5,73 (1H, s), 7,30 (1H, m), 7,50 (2H, s), 7,57 (1H, d), 7,63 (2H, d), 8,47 (1H, s), 8,55 (1H, m), 9,73 (1H, s),
1-152	386,2	1,32	
1-154	396,1	1,83	0,54 (2H, m), 0,75 (2H, m), 2,87 (1H, m), 3,99 (3H, s), 6,86 (1H, s), 7,10 (1H, m), 7,42 (2H, d), 7,70 (2H, d), 8,01 (1H, m), 8,30 (1H, m), 8,52 (1H, s), 9,37 (1H, s),
1-155	360,2	1,49	0,54 (2H, m); 0,75 (2H, m), 2,88 (1H, m), 3,99 (3H, s), 6,81 (1H, s), 7,14 (1H, m), 7,16 (2H, t), 7,74 (2H, m), 8,00 (1H, m), 8,29 (1H, m), 8,51 (1H, s), 9,37 (1H, s),
1-156	387,3	1,59	0,55 (2H, m), 0,75 (2H, m), 2,87 (1H, m), 3,99 (3H, s), 6,96 (1H, m), 7,09 (1H, m), 7,81 (4H, m), 7,99 (1H, m), 8,29 (1H, m), 8,55 (1H, m), 9,38 (1H, s),
1-157	446,1	2,21	0,54 (2H, m), 0,75 (2H, m), 2,88 (1H, m), 3,97 (3H, s), 6,86 (1H, s), 7,08 (1H, m), 7,33 (2H, m), 7,79 (2H, m), 7,99 (1H, m), 8,28 (1H, m), 8,53 (1H, s), 9,38 (1H, s),
1-158	410,0	2,54	0,53 (2H, m), 0,75 (2H, m), 1,31 (3H, t), 2,87 (1H, m), 4,47 (2H, c), 6,83 (1H, s), 7,09 (1H, m), 7,40 (2H, d), 7,69 (2H, d), 8,03 (1H, m), 8,28 (1H, m), 8,52 (1H, s), 9,28 (1H, s),
1-159	394,2	1,84	0,53 (2H, m), 0,74 (2H, m), 1,30 (3H, t), 2,86 (1H, m), 4,49 (2H, c), 6,79 (1H, s), 7,07 (1H, m), 7,16 (2H, t), 7,72 (2H, m), 8,01 (1H, m), 8,28 (1H, m), 8,51 (1H, s), 9,29 (1H, s),
1-160	401,2	1,80	0,54 (2H, m), 0,77 (2H, m), 1,31 (3H, t), 2,89 (1H, m), 4,49 (2H, c), 6,95 (1H, s), 7,07 (1H, m), 7,81 (4H, m), 8,01 (1H, m), 8,23 (1H, m), 8,55 (1H, s), 9,30 (1H, s),
1-161	460,1	2,64	0,53 (2H, m), 0,75 (2H, m), 1,27 (3H, t), 2,88 (1H, m), 4,45 (2H, c), 6,83 (1H, s), 7,07 (1H, m), 7,33 (2H, m), 7,77 (2H, m), 8,03 (1H, m), 8,27 (1H, m), 8,53 (1H, s), 9,30 (1H, s),

ES 2 464 738 T3

(continuación)

Ej. N°	MH+	LogP(HCOOH)	RMN (400 MHz, DMSO-d6, si no se indica lo contrario)
1-162	424,1	2,31	0,53 (2H, m), 0,75 (2H, m), 1,28 (6H, d), 2,86 (1H, m), 5,40 (1H, m), 6,82 (1H, m), 7,08 (1H, m), 7,42 (2H, d), 7,63 (2H, d), 8,06 (1H, m), 8,28 (1H, m), 8,52 (1H, s), 9,15 (1H, s),
1-163	408,2	2,19	0,54 (2H, m), 0,76 (2H, m), 1,28 (6H, d), 2,86 (1H, m), 5,40 (1H, m), 6,78 (1H, s), 7,06 (1H, m), 7,17 (2H, t), 7,67 (2H, m), 8,06 (1H, m), 8,28 (1H, m), 8,52 (1H, s), 9,16 (1H, s),
1-164	415,1	2,27	0,55 (2H, m), 0,75 (2H, m), 1,27 (6H, d), 2,87 (1H, m), 5,40 (1H, m), 6,93 (1H, m), 7,06 (1H, m), 7,80 (4H, m), 8,02 (1H, m), 8,27 (1H, m), 8,55 (1H, s), 9,16 (1H, s),
1-165	474,1	2,32	0,54 (2H, m), 0,75 (2H, m), 1,24 (6H, d), 2,86 (1H, m), 5,39 (1H, m), 6,82 (1H, m), 7,07 (1H, m), 7,34 (2H, m), 7,73 (2H, m), 8,05 (1H, m), 8,28 (1H, m), 8,53 (1H, s), 9,18 (1H, s),
1-166	464,1	2,48	0,52 (2H, m), 0,76 (2H, m), 2,86 (1H, m), 5,10 (2H, c), 6,78 (1H, s), 7,22 (1H, m), 7,38 (2H, d), 7,70 (2H, d), 8,04 (1H, m), 8,32 (1H, m), 8,53 (1H, s), 9,26 (1H, s),
1-167	448,1	2,12	0,52 (2H, m), 0,75 (2H, m), 2,86 (1H, m), 5,10 (2H, c), 6,72 (1H, m), 7,14 (2H, c), 7,21 (1H, m), 7,71 (2H, m), 8,02 (1H, m), 8,31 (1H, m), 8,52 (1H, s), 9,26 (1H, s),
1-168	455,2	2,11	0,53 (2H, m), 0,76 (2H, m), 2,89 (1H, m), 5,11 (2H, cij), 6,89 (1H, m), 7,22 (2H, m), 7,83 (4H, m), 8,01 (1H, m), 8,31 (1H, m), 8,56 (1H, s), 9,28 (1H, s),
1-169	514,0	2,84	0,52 (2H, m), 0,75 (2H, m), 2,8(1H, m), 5,11 (2H, c), 6,78 (1H, m), 7,21 (1H, m), 7,31 (2H, m), 7,77 (2H, m), 8,03 (1H, m), 8,32(1H, m), 8,54 (1H, s), 9,28 (1H, s),
1-170	418,3	1,59	0,50 (2H, m), 0,79 (3H, m), 2,91 (1H, m), 6,50 (1H, m), 7,26 (2H, t), 7,33 (2H, m), 7,93 (1H, m), 8,54 (1H, s), 8,80 (1H, m), 9,72 (1H, s),
1-177	394,1	1,31	0,55 (2H, m), 0,78 (2H, m), 1,063 (3H, t), 2,89 (1H, m), 6,94 (1H, s), 7,28 (1H, m), 7,45 (2H, d), 7,67 (2H, d), 7,88 (1H, d), 8,52 (2H, m), 9,37(1H, s),
1-178	434,2	1,76	0,49 (2H, m), 0,80 (2H, m), 2,93 (1H, m), 6,56 (1H, m), 7,51 (2H, m), 7,70 (2H, m), 7,82 (1H, m), 7,96 (1H, m), 8,54 (1H, s), 8,81 (1H, m), 9,7 (1H, s),
1-179	416,1	1,58	
1-180	390,1	1,10	0,57 (2H, m), 0,78 (2H, m), 1,02 (3H, t), 2,20 (3H, s), 2,42 (2H, c), 2,89 (1H, m), 6,82 (1H, s), 6,96 (1H, m), 7,07 (1H, m), 7,20 (2H, m), 7,68 (1H, m), 8,50 (2H, m), 9,21 (1H, s),
1-181	397,2	1,22	0,58 (2H, m), 0,79 (2H, m), 1,00 (3H, t), 2,25 (3H, s), 2,38 (2H, c), 2,90 (1H, m), 6,97 (1H, m), 7,21 (1H, m), 7,38 (1H, m), 7,61 (1H, m), 7,71 (3H, m), 8,49 (1H, m), 8,52 (1H, s), 9,28 (1H, s),
1-182	374,2	0,94	
1-183	393,1	0,94	
1-184			(MeOH d4); (0,66 (2H, m), 0,89 (2H, m), 1,10 (3H, t), 2,21 (3H, s), 2,50 (2H, c), 2,88 (1H, m), 7,01 (1H, m), 7,07 (1H, m), 7,27 (1H, m), 7,32 (1H, m), 7,72 (1H, d), 8,49 (1H, m), 8,53 (1H, s),

ES 2 464 738 T3

(continuación)

Ej. N°	MH+	LogP(HCOOH)	RMN (400 MHz, DMSO-d6, si no se indica lo contrario)
1-185			(MeOH d4); 0,63 (2H, m), 0,89 (2H, m), 1,10 (3H, t), 2,55 (2H, c), 7,30 (1H, m), 7,36 (2H, d), 7,68 (2H,d), 7,91 (1H, m), 8,52 (2H, m),
1-186			(MeOH d4); 0,65 (2H, m); 0,89 (2H, m), 1,06 (3H, t), 2,49 (2H, c), 2,86 (1H, m), 7,31 (1H, m), 7,76 (4H, s), 7,94 (1H, m), 8,52 (1H, m), 8,56 (1H, s),
1-187	412,1	1,46	0,56 (2H, m), 0,78 (2H, m), 1,05 (3H, t), 2,89 (1H, m), 6,90 (1H, s), 7,25 (1H, m), 7,33 (1H, m), 7,44 (2H, m), 7,76 (1H, m), 8,5 (2H, m), 9,38 (1H, s),
1-188	408,2	1,40	0,58 (2H, m), 0,78 (2H, m), 1,02 (3H, t), 2,20 (3H, s), 2,90 (1H, m), 6,86 (1H, m), 7,20 (3H, m), 7,32 (1H, m), 7,73 (1H, m), 8,50 (2H, m), 9,23 (1H, s),
1-189	442,0	1,77	0,59 (2H, m), 0,78 (2H, m), 0,95 (3H, t), 2,28 (3H, s), 2,91 (1H, m), 6,93 (1H, m), 7,19 (1H, m), 7,40 (1H, m), 7,51(1H, m), 7,60 (1H, m), 7,73 (1H, m), 8,47 (1H, m), 8,53 (1H, s), 9,28 (1H, s),
1-196	446,2	2,43	0,56 (2H, m), 0,79 (2H, m), 1,07 (2H, c), 2,89 (1H, m), 7,04 (1H, m), 7,20 (2H, t), 7,68 (2H, m), 7,80 (1H, d), 8,18 (1H, d), 8,53 (1H, s), 9,56 (1H, s),
1-197	440,1	2,52	0,58 (2H, m); 0,76 (4H, m), 0,86 (2H, m), 1,77 (1H, m); 2,86 (1H, m), 7,18 (1H, m), 7,42 (2H, d), 7,58 (2H, d), 8,14 (1H, m), 8,46 (1H, m), 8,52 (1H, s), 9,62 (1H, s),
1-198	424,1	2,16	0,58 (2H, m), 0,73 (2H, m), 0,79 (2H, m), 0,86 (2H, m), 1,83 (1H, m), 2,87 (1H, m), 7,20 (3H, m), 7,61 (2H, m), 8,11 (1H, m), 8,45 (1H, m), 8,51 (1H, s), 9,61 (1H, s),
1-199	448,1	2,35	0,57 (2H, m), 1,12 (2H, m), 2,47 (3H, s), (2,89 (1H, m), 7,15 (1H, s), 7,47 (2H, d), 7,65 (2H, d), 7,82 (1H, d), 8,16 (1H, d), 8,53 (1H, s), 9,57 (1H, s),
1-224	392,1	1,36	
1-229	408,1	1,58	
1-230	426,1	1,72	
1-254	450,1	1,83	
1-258	577,3	2,07	
1-262	433	1,45	(d7-DMF); 0,87 (8H, m), 3,03 (1H, m), 3,18 (1H, m), 7,39 (2H, t), 7,70 (m, 1H), 7,80 (3H, m), 8,19 (1H, d), 8,55 (1H, s), 8,68 (1H, dd), 9,11 (1H, d ancho), 9,72 (1H, d ancho)
1-264	591,2	1,9	
1-273	509,2	1,11	
1-275	374	0,76	0,55 (2 H, m), 0,76 (2 H, m), 1,05 (3 H, t), 2,53 (2 H, c), 2,92 (1 H, m), 6,63 (1 H, m), 7,24 (1 H, m), 7,38 (3 H, m), 7,60 (2 H, m), 7,80(1 H, m), 8,51 (1 H, m), 9,27(1 H, m),

ES 2 464 738 T3

1-276	392	0,88	0,55 (2 H, m), 0,76 (2 H, m), 1,06 (3 H, t), 2,53 (2 H, c), 2,92 (1 H, m), 3,13 (3 H, s), 6,69 (1 H, m), 7,20 (2 H, m), 7,25 (1 H, m), 7,65 (2H,m), 7,83 (1 H, m), 8,52 (1H, m), 9,28 (1H, m),
-------	-----	------	--

ES 2 464 738 T3

(continuación)

Ej. N°	MH+	LogP(HCOOH)	RMN (400 MHz, DMSO-d6, si no se indica lo contrario)
1-277	442/444	1,34	0,55 (2 H, m), 0,77 (2 H, m), 1,03 (3 H, t), 2,45 (2 H, c), 2,93 (1 H, m), 6,66 (1 H, m), 7,21 (1 H, m), 7,43 (2 H, m), 7,60(1 H, m), 7,68 (1 H, m), 8,49 (1 H, m), 9,22 (1 H, m),
1-278	410	1	0,55 (2 H, m), 0,77(2 H, m), 1,05 (3 H, t), 2,47 (3 H, s), 2,50(2 H, c), 2,93 (1 H, m), 6,66(1 H, m), 7,10(1 H, m), 7,21 (2 H, m), 7,47 (1 H, m), 7,71 (1 H, m), 8,50(1 H, m), 9,25 (1 H, m),
1-279	458	1,44	0,55 (2 H, m), 0,76 (2 H, m), 1,03 (3 H, t), 2,92 (1 H, m), 6,75 (1 H, m), 7,24 (1 H, m), 7,35 (2 H, m), 7,73 (2 H, m), 7,85 (1 H, m), 8,52 (1 H, m), 9,31 (1 H, m),
1-287	521,2	1,45	
1-290	605,2	2,47	
1-299	433,1	1,85	1,17 (3H, CH3), 1,40 (3H, CH3, s),2,75 (2H, CH2), 5,23 (1H, m), 6,08 (1H, d), 7,20 (3H, m), 7,66 (3H, m), 8,14 (1H, s), 8,55 (2H, m)
1-305	589,1	2,04	
1-306	535,1	1,84	
1-308	450	1,83	0,55 (2 H, m), 0,77 (2 H, m), 2,88 (1 H, m), 6,13 (1 H, dc), 7,18 (3 H, m), 7,67 (3 H, m), 8,23 (1 H, m), 8,54 (1 H, m), 8,80 (1 H, m), 8,89 (1 H, m),
1-309	535,2	1,77	
1-310	555,1	1,84	
1-315	411	2,18	(d3-MeCN): 0,53 (2H, m), 0,83 (2H, m), 0,92 (3H, t), 2,02 (2H, c), 2,95 (1H, m), 6,03 (1H, m), 7,19 (3H, m), 7,31 (2H, m), 7,55 (2H, m), 8,11 (1H, s ancho), 8,55 (1H, s)
1-316	427	2,54	(d3-MeCN): 0,53 (2H, m), 0,83 (2H, m), 0,93 (3H, t), 2,01 (2H, c), 2,94 (1H, m), 6,03 (1H, s ancho), 7,20 (1H, m), 7,30 (2H, m), 7,48 (3H, m), 7,63 (1H, m),8,09 (1H, s ancho), 8,56 (1H, s)

Tabla 3


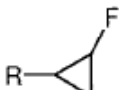
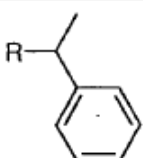
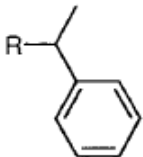
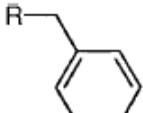
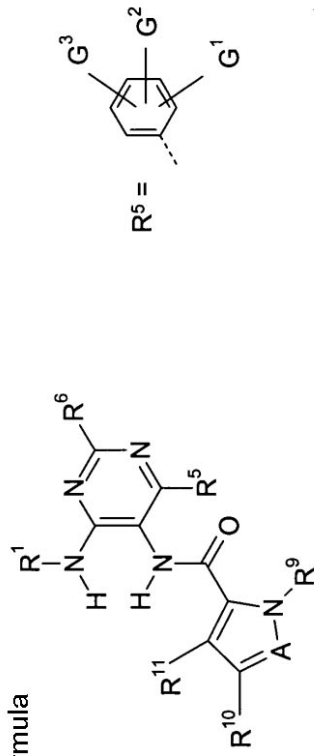
Compuestos de fórmula								
Ej. N°	R ¹	R ⁵	R ⁷	R ⁶	A	G ⁴	G ⁵	G ⁶
3-1	Ciclopropilo	Cl	CH ₂ CH ₃	H	N	H	H	H
3-2	Ciclopropilo	H	CH ₂ CH ₃	H	N	H	H	H
3-3	Ciclopropilo	Br	CH ₂ CH ₃	H	N	H	H	H
3-4	Ciclopropilo	Cl	OCH ₂ CF ₃	H	N	H	H	H
3-5	Ciclopropilo	Cl	CH ₂ CF ₃	H	N	H	H	H
3-6	Ciclobutilo	Cl	CH ₂ CH ₃	H	N	H	H	H
3-7		Cl	CH ₂ CH ₃	H	N	H	H	H
3-8	Ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	CH ₂ CH ₃	H	N	H	H	H
3-9	Ciclopropilo	Cl	CH ₂ CH ₃	CH ₃	N	H	H	H
3-10	CH(CF ₃)CH ₃	Cl	CH ₂ CH ₃	CH ₃	N	H	H	H
3-11	Ciclopropilo	Cl	CH ₂ CH ₃	CF ₃	N	H	H	H
3-12		Cl	CH ₂ CH ₃	H	N	H	H	H
3-13	Ciclopropilo	Ciclopropilo	CH ₂ CF ₃	Cl	N	H	H	H
3-14		Cl	CH ₂ CH ₃	CH ₃	N	H	H	H
3-15		Cl	CH ₂ CH ₃	H	N	H	H	H
3-16		Cl	CH ₂ CH ₃	H	N	H	H	H

Tabla 4: caracterización fisicoquímica

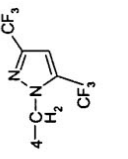
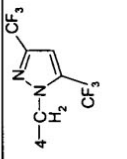
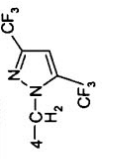
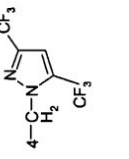
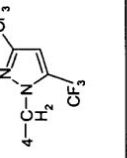
Ej. N°	MH+	LogP(HCOOH)
3-1	318,2	0,79
3-3	364,1	0,84
3-4	388,0	2,25
3-5	370,1	1,61
3-6	331,1	1,34
3-7	331,1	1,26
3-8	312,2	1,74
3-9	332,2	1,41
3-10	374,0	1,65
3-11	384,1	2,27
3-12	412,1	2,22

Tabla 7

Compuestos de la fórmula



Ej. N°	R ¹	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹	R ⁵	G ¹	G ²	G ³	R ⁶	A
7-1	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	H	H	Ph	4-F	H	H	H	N
7-2	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	H	Cl	Ph	4-F	H	H	H	N
7-3	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	H	H	Ph	H	H	H	H	N
7-4	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	H	H	Ph	4-Cl	H	H	H	N
7-5	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	H	H	Ph	4-OCF ₃	H	H	H	N
7-6	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	H	H	Ph	4-SCF ₃	H	H	H	N
7-7	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	H	Cl	Ph	H	H	H	H	N

Ej. N°.	R ¹	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹	R ⁵	G ¹	G ²	G ³	R ⁶	A
7-8	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	H	Cl	Ph	4-Cl	H	H	H	N
7-9	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	H	Cl	Ph	4-OCF ₃	H	H	H	N
7-10	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	H	Cl	Ph	4-SCF ₃	H	H	H	N
7-11	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃		H	Cl	H	H	H	H	N
7-12	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	H	H	Ph	4-CN	H	H	H	N
7-13	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃		H	Ph	H	H	H	H	N
7-14	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃		H	Ph	2-Cl	4-Cl	H	H	N
7-15	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃		H	Ph	4-OCF ₃	H	H	H	N
7-16	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃		H	Ph	4-Cl	H	H	H	N

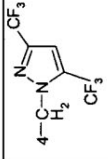
Ej. N°	R ¹	R ⁹	R ¹⁰	R ¹¹	R ⁵	G ¹	G ²	G ³	R ⁶	A
7-17	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃		H	Ph	4-F	H	H	H	N
7-18	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	H	H	Ph	2-Cl	4-Cl	H	H	N
7-19	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	H	Cl	Ph	2-Cl	4-Cl	H	H	N
7-20	ciclopropilo	CH ₂ CH ₃	H	Cl	Ph	4-CN	H	H	H	N
7-21	ciclopropilo	CH(CH ₃) ₂	H	Cl	Ph	4-F	H	H	H	N
7-22	ciclopropilo	CH(CH ₃) ₂	H	Cl	Ph	4-Cl	H	H	H	N
7-23	ciclopropilo	CH ₂ CF ₃	H	H	Ph	4-F	H	H	H	N
7-24	ciclopropilo	n-propilo	H	Cl	Ph	4-F	H	H	H	N
7-25	ciclopropilo	n-propilo	H	Cl	Ph	4-Cl	H	H	H	N

Tabla 8: caracterización fisicoquímica

Ej. Nº	MH+	LogP(HCOOH)	RMN (DMSO-d6, 400 MHz)
7-1	367	1,31	0,52 (2 H, m), 0,77 (2 H, m), 1,22 (3 H, t), 2,91 (1 H, m), 4,12 (2 H, c), 6,86 (1 H, m), 7,18 (2 H, m), 7,59 (1 H, s), 7,71 (2 H, m), 8,53 (1 H, s), 9,19 (1 H, s)
7-2	401/403	1,86	0,51 (2 H, m), 0,77 (2 H, m), 1,21 (3 H, t), 2,87 (1 H, m), 4,14 (2 H, c), 7,23 (2 H, m), 7,26 (1 H, m), 7,64 (1 H, s), 7,71 (2 H, m), 8,54 (1 H, s), 9,27 (1 H, s)
7-3	349	1,12	0,56(2 H, m), 0,73 (2 H, m), 1,18 (3 H, t), 2,87 (1 H, m), 4,30(2 H, c), 6,84(1 H, m), 7,12 (1H, m), 7,33 (3 H, m), 7,43 (1 H, m), 7,63 (2 H, m), 8,51 (1 H, s), 9,36 (1 H, s)
7-4	383/385	1,6	0,55 (2 H, m), 0,74 (2 H, m), 1,16(3 H, t), 2,84 (1 H, m), 4,31 (2 H, c), 6,85 (1 H, m), 7,42 (2 H, m), 7,48 (1 H, m), 7,65 (2 H, m), 8,52 (1 H, s), 9,55 (1 H, s)
7-5	433	1,99	0,57 (2 H, m), 0,74 (2 H, m), 1,14 (3 H, t), 2,88 (1 H, m), 4,29 (2 H, c), 6,87 (1 H, m), 7,22 (1 H, m), 7,30 (2 H, m), 7,44 (1 H, m), 7,75 (2 H, m), 8,52 (1 H, s), 9,39 (1 H, s)
7-6	449	2,29	0,57 (2 H, m), 0,74 (2 H, m), 1,13 (3 H, t), 2,89 (1 H, m), 4,27 (2 H, c), 6,86 (1 H, m), 7,25 (1 H, m), 7,44 (1 H, m), 7,66 (2 H, m), 7,76 (2 H, m), 8,53 (1 H, s), 9,41 (1 H, s)
7-7	383	1,63	0,52 (2 H, m), 0,77 (2 H, m), 1,19 (3 H, t), 2,91 (1 H, m), 4,09 (2 H, ci), 6,78 (1 H, m), 7,37 (3 H, m), 7,58 (1 H, m), 7,65 (2 H, s), 8,54 (1 H, s), 9,21 (1 H, s)
7-8	417/419	2,20	0,52 (2 H, m), 0,77 (2 H, m), 1,20(3 H, t), 2,91 (1 H, m), 4,12 (2 H, cij), 6,90 (1 H, m), 7,43 (2 H, m), 7,59 (1 H, m), 7,64 (1 H, s), 7,68 (2 H, m), 8,54 (1 H, s), 9,20(1 H, s)
7-9	467/469	2,63	0,52 (2 H, m), 0,77 (2 H, m), 1,20(3 H, t), 2,92 (1 H, m), 4,11(2 H, c), 6,88 (1 H, m), 7,35 (2 H, m), 7,58 (1 H, s), 7,75 (2 H, m), 8,55 (1 H, s), 9,24 (1 H, s)
7-10	483/485	2,99	0,52 (2 H, m), 0,77 (2 H, m), 1,19 (3 H, t), 2,92 (1 H, m), 4,10 (2 H, c), 6,88 (1 H, m), 7,58 (1 H, s), 7,74 (4 H, m), 8,56 (1 H, s), 9,25 (1 H, s)
7-11	523/525	3,29	0,52 (2 H, m), 0,72 (2 H, m), 1,31 (3 H, t), 2,83 (1 H, m), 4,45 (2 H, c), 5,57 (2 H, s), 6,94 (1 H, m), 7,49 (2 H, m), 8,27 (1 H, s), 9,57 (1 H, s)
7-12	374	1,45	0,58 (2 H, m), 0,74(2 H, m), 1,15 (3 H, t), 2,88 (1 H, m), 4,28 (2 H, c), 6,86(1 H, m), 7,31 (1 H, m), 7,45 (1 H, m), 7,79 (4 H, m), 8,54 (1 H, s), 9,40 (1 H, s)
7-13	565	2,80	0,53 (2 H, m), 0,72 (2 H, m), 1,17 (3 H, t), 2,86 (1 H, m), 4,27 (2 H, c), 5,52 (2 H, s), 6,72 (1 H, m), 7,18 (1 H, m), 7,30 (3 H, m), 7,51 (1 H, s), 7,60 (2 H, m), 8,50 (1 H, s), 9,41 (1 H, s)
7-14	633/635	3,79	0,54 (2 H, m), 0,73 (2 H, m), 1,14 (3 H, t), 2,87 (1 H, m), 4,23 (2 H, c), 5,50 (2 H, s), 6,62 (1 H, m), 7,21 (1 H, m), 7,28 (2 H, m), 7,49 (2 H, m), 8,49 (1 H, s), 9,29 (1 H, s)
7-15	649	3,76	0,54 (2 H, m), 0,73 (2 H, m), 1,14 (3 H, t), 2,86 (1 H, m), 4,26 (2 H, cij), 5,53 (2 H, s), 6,74 (1 H, m), 7,26 (3 H, m), 7,50 (1 H, s), 7,71 (2 H, m), 8,50 (1 H, s), 9,43 (1 H, s)
7-16	599/601	3,41	0,53 (2 H, m), 0,72 (2 H, m), 1,17 (3 H, t), 2,85 (1 H, m), 4,28 (2 H, c), 5,53 (2 H, s), 6,77 (1 H, m), 7,26 (1 H,m), 7,35 (2 H, m), 7,50 (1 H, m), 7,60 (2 H, m), 8,50 (1 H, s), 9,42 (1 H, s)

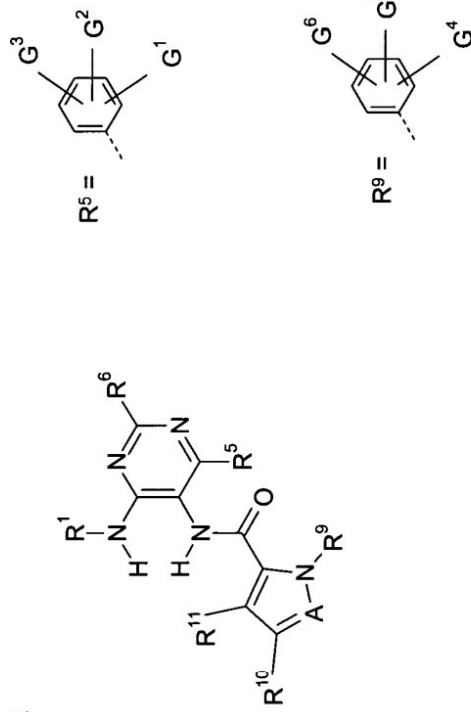
ES 2 464 738 T3

(continuación)

Ej. N°	MH+	LogP(HCOOH)	RMN (DMSO-d6, 400 MHz)
7-17	583	3,05	0,52 (2 H, m), 0,73 (2 H, m), 1,17(3 H, t), 2,85 (1 H, m), 4,28(2 H, c), 5,54(2 H, s), 6,74 (1 H, m), 7,11(2 H, m), 7,23 (1 H, m), 7,51 (1 H, s), 7,66(2 H, m), 8,49(1 H, s), 9,41 (1 H, s)
7-18	417/419	1,95	0,57 (2 H, m), 0,76(2 H, m), 1,15 (3 H, t), 2,88 (1 H, m), 4,27 (2 H, c), 6,73 (1 H, m), 7,17 (1 H, m), 7,3 -7,6 (4 H, m), 8,59 (1 H, s), 9,25 (1 H, s)
7-19	451/453	2,57	
7-20	408/4 10	1,90	0,53 (2 H, m), 0,76(2 H, m), 1,20(3 H, t), 2,91 (1 H, m), 4,11(2 H, c), 7,03 (1 H, m), 7,58 (1 H, m), 7,82 (4 H, m), 8,56 (1 H, s), 9,21 (1 H, s)
7-21	415	2,18	0,49 (2H, m), 0,78 (2H, m), 1,27 (6H, d), 2,91 (1H, m), 4,55 (1H, m), 6,66 (1H, s ancho), 7,20 (2H, m), 7,61 (1H, s), 7,70 (2H, m), 8,54 (1H, s), 9,36 (1H, s ancho)
7-22	431	2,58	0,49 (2H, m), 0,78 (2H, m), 1,27 (6H, d), 2,92 (1H, m), 4,54 (1H, m), 6,69 (1H, s ancho), 7,44 (2H, m), 7,61 (1H, s), 7,67 (2H, m), 8,54 (1H, s), 9,37 (1H, s ancho)
7-23	421	1,68	0,54 (2H, m), 0,75 (2H, m), 2,86 (1H, m), 5,34 (2H, m), 7,09 (1H, s), 7,17 (2H, m), 7,39 (1H, s), 7,68 (3H, m), 8,54 (1H, s), 9,76 (1H, s ancho)
7-24	415	2,13	0,49 (2H, m), 0,75 (5H, m), 1,57 (2H, m), 2,88 (1H, m), 4,06 (t, 2H), 7,07 (1H, m), 7,22 (2H, m), 7,64 (1H, m), 7,73 (2H, m), 8,54 (1H, s), 9,30 (1H, s ancho)
7-25	431	2,51	0,49 (2H, m), 0,74 (5H, m), 1,57 (2H, m), 2,88 (1H, m), 4,05 (t, 2H), 7,10 (1H, m), 7,46 (2H, m), 7,65 (1H, m), 7,69 (2H, m), 8,55 (1H, s), 9,31 (1H, s ancho)

Tabla 9

Compuestos de la fórmula



Ej. N°	R ¹	G ⁴	G ⁵	G ⁶	R ¹⁰	R ¹¹	G ¹	G ²	G ³	R ⁶	A
9-1	ciclopropilo	4-F	H	H	H	H	4-F	H	H	H	N
9-2	ciclopropilo	4-Cl	H	H	H	H	4-F	H	H	H	N
9-3	ciclopropilo	2-Cl	H	H	H	H	4-F	H	H	H	N
9-4	ciclopropilo	2-Cl	H	H	H	H	4-Cl	H	H	H	N

Tabla 10: caracterización fisicoquímica

Ej. N°	MH+	LogP(HCOOH)	RMN (DMSO-d6, 400 MHz)
9-1	433	1,70	0,57 (2H, m), 0,78 (2H, m), 2,87 (1H, m), 7,06 (1H, s), 7,20 (4H, m), 7,32 (2H, m), 7,51 (1H, m), 7,73 (3H, m), 8,50 (1H, s), 9,69 (1H, s ancho)
9-2	449	2,02	0,57 (2H, m), 0,77 (2H, m), 2,87 (1H, m), 7,07 (1H, s), 7,18 (2H, m), 7,31 (2H, m), 7,49 (3H, m), 7,66 (2H, m), 7,76 (1H, s), 8,51 (1H, s), 9,70 (1H, s ancho)
9-3	449	1,76	0,52 (2H, m), 0,73 (2H, m), 2,81 (1H, m), 7,18 (4H, m), 7,27 (1H, m), 7,35 (1H, m), 7,42 (1H, m), 7,49 (1H, m), 7,67 (2H, m), 7,80 (1H, m), 8,48 (1H, s), 9,68 (1H, s ancho)
9-4	465	2,05	0,53 (2H, m), 0,73 (2H, m), 2,81 (1H, m), 7,18 (1H, m), 7,24 (2H, m), 7,35 (1H, m), 7,44 (3H, m), 7,52 (1H, m), 7,63 (2H, m), 7,81 (1H, m), 8,49 (1H, s), 9,68 (1H, s ancho)

Ejemplos biológicos**Ensayo de *Lucilia cuprina***

5 Disolvente: dimetilsulfóxido

Para elaborar una preparación de principios activos adecuado se mezclan 10 mg de principio activo con 0,5 ml de dimetilsulfóxido y se diluyo el concentrado con agua a la concentración deseada

Se infestan con larvas de *Lucilia cuprina* recipientes que contienen carne de caballo que se ha tratado con la preparación de principios activos a la concentración deseada.

10 Después de 2 días se determina el tanto por ciento de exterminio. A este respecto, un 100 % significa que todas las larvas han sido exterminadas; un 0 % que no se ha destruido ninguna larva.

En este ensayo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación, por ejemplo, muestran una actividad ≥ 80 % para una cantidad de aplicación de 100 ppm:

15 Ej. N°: 1-1, 1-21, 1-4, 1-5, 1-73, 1-74, 1-75, 1-76, 1-82, 1-83, 1-85, 1-100, 1-111, 1-114, 1-116, 1-123, 1-124, 1-126, 1-133, 1-177, 1-179, 1-180, 1-181, 1-185, 1-186, 1-187, 1-188, 1-190

Ensayo de *Musca domestica*

Disolvente: dimetilsulfóxido

Para elaborar una preparación de principios activos adecuado se mezclan 10 mg de principio activo con 0,5 ml de dimetilsulfóxido y se diluyo el concentrado con agua a la concentración deseada.

20 Se infestan con *Musca domestica* adulta recipientes que contienen una esponja que se ha tratado con la preparación de principios activos a la concentración deseada.

Después de 2 días se determina el tanto por ciento de exterminio. A este respecto, un 100 % significa que todas las moscas han sido exterminadas; un 0 % que no se ha destruido ninguna mosca.

25 En este ensayo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación, por ejemplo, muestran una actividad ≥ 80 % para una cantidad de aplicación de 100 ppm:

Ej. N°: 1-1, 1-4, 1-73, 1-75, 1-114, 1-124, 1-126, 1-177, 1-179, 1-180, 1-181, 1-185, 1-186, 1-187, 1-190

Ensayo de *Boophilus microplus* (Inyección)

Disolvente: dimetilsulfóxido

30 Para elaborar una preparación de principios activos adecuado se mezclan 10 mg de principio activo con 0,5 ml de dimetilsulfóxido y se diluyo el concentrado con agua a la concentración deseada.

La solución de principio activo se inyecta en el abdomen (*Boophilus microplus*) y los animales se trasladan a bandejas y

se mantienen en una cámara climatizada. El control de actividad se realiza sobre la puesta de huevos fértiles.

Después de 7 días se determina el tanto por ciento de actividad. A este respecto, un 100 % significa que ninguna garrapata ha puesto huevos fértiles.

- 5 En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una actividad ≥ 80 % para una cantidad de aplicación de 20 $\mu\text{g}/\text{animal}$:

Ej. Nº: 1-5, 1-100, 1-111, 1-177, 1-187

Ensayo de Myzus (tratamiento de pulverización)

Disolvente: 78 partes en peso de acetona

1,5 partes en peso de dimetilformamida

- 10 Emulsionante: 0,5 partes en peso de alquilaril poliglicol éter

Para elaborar una preparación adecuada de principios activos se mezcla 1 parte en peso de principio activo con las cantidades indicadas de disolvente y emulsionante y se diluye el concentrado con agua que contiene emulsionante a la concentración deseada.

- 15 Se pulverizan discos de hojas de col china (*Brassica pekinensis*), que están infestados con todos los estadios del pulgón verde del melocotonero (*Myzus persicae*), con una preparación de principios activos a la concentración deseada.

Después de 6 días se determina el tanto por ciento de actividad. A este respecto, un 100 % significa que todos los pulgones han sido exterminados; un 0 % que no se ha destruido ningún pulgón.

- 20 En este ensayo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación, por ejemplo, muestran una actividad ≥ 80 % para una cantidad de aplicación de 500 ppm:

Ej. Nº: 1-1, 1-10, 1-11, 1-114, 1-115, 1-116, 1-121, 1-123, 1-124, 1-126, 1-127, 1-129, 1-13, 1-130, 1-131, 1-132, 1-133, 1-139, 1-145, 1-146, 1-147, 1-148, 1-149, 1-150, 1-152, 1-154, 1-16, 1-174, 1-175, 1-176, 1-177, 1-178, 1-179, 1-180, 1-181, 1-183, 1-184, 1-185, 1-186, 1-187, 1-188, 1-189, 1-19, 1-190, 1-20, 1-21, 1-26, 1-27, 1-22, 1-23, 1-24, 1-25, 1-29, 1-30, 1-31, 1-32, 1-33, 1-37, 1-38, 1-4, 1-40, 1-44, 1-48, 1-5, 1-52, 1-59, 1-60, 1-7, 1-70, 1-71, 1-8, 1-9, 1-100, 1-112, 1-73, 1-85, 1-99

Ensayo de Phaeton (tratamiento de pulverización)

Disolvente: 78,0 partes en peso de acetona

1,5 partes en peso de dimetilformamida

Emulsionante: 0,5 partes en peso de alquilaril poliglicol éter

- 30 Para elaborar una preparación adecuada de principios activos se mezcla 1 parte en peso de principio activo con las cantidades indicadas de disolvente y emulsionante y se diluye el concentrado con agua que contiene emulsionante a la concentración deseada.

Se pulverizan discos de hojas de col china (*Brassica pekinensis*) con una preparación de principios activos a la concentración deseada y después de secar se infestan con larvas del escarabajo de la mostaza (*Phaedon cochleariae*).

- 35 Después de 7 días se determina el tanto por ciento de actividad. A este respecto, un 100 % significa que todas las larvas de escarabajo han sido exterminadas; un 0 % que no se ha destruido ninguna larva de escarabajo.

En este ensayo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación, por ejemplo, muestran una actividad ≥ 80 % para una cantidad de aplicación de 500 ppm:

- 40 Ej. Nº: 1-1, 1-11, 1-114, 1-115, 1-116, 1-119, 1-122, 1-123, 1-124, 1-126, 1-127, 1-129, 1-13, 1-130, 1-131, 1-132, 1-133, 1-134, 1-135, 1-136, 1-137, 1-139, 1-14, 1-140, 1-141, 1-142, 1-143, 1-144, 1-149, 1-15, 1-151, 1-154, 1-156, 1-157, 1-158, 1-159, 1-16, 1-160, 1-161, 1-162, 1-163, 1-164, 1-165, 1-167, 1-169, 1-170, 1-172, 1-173, 1-174, 1-175, 1-176, 1-177, 1-178, 1-179, 1-180, 1-181, 1-183, 1-184, 1-185, 1-186, 1-187, 1-188, 1-189, 1-19, 1-190, 1-191, 1-192, 1-193, 1-194, 1-195, 1-2, 1-20, 1-21, 1-25, 1-29, 1-3, 1-30, 1-33, 1-34, 1-37, 1-38, 1-4, 1-40, 1-43, 1-44, 1-45, 1-46, 1-47, 1-48, 1-49, 1-5, 1-52, 1-56, 1-58, 1-6, 1-60, 1-61, 1-64, 1-67, 1-68, 1-69, 1-7, 1-70, 1-71, 1-83, 1-84, 1-87, 1-9, 1-111, 1-72, 1-73, 1-74, 1-75, 1-76, 1-78, 1-82, 1-83, 1-85, 1-88, 1-89, 1-99

Ensayo de Spodoptera frugiperda (tratamiento de pulverización)

Disolvente: 78,0 partes en peso de acetona

1,5 partes en peso de dimetilformamida

Emulsionante: 0,5 partes en peso de alquilaril poliglicol éter

5 Para elaborar una preparación adecuada de principios activos se mezcla 1 parte en peso de principio activo con las cantidades indicadas de disolvente y emulsionante y se diluye el concentrado con agua que contiene emulsionante a la concentración deseada.

Se pulverizan discos de hojas de maíz (*Zea mays*) con una preparación de principios activos a la concentración deseada y después de secar se infestan con orugas del gusano cogollero (*Spodoptera frugiperda*).

10 Después de 7 días se determina el tanto por ciento de actividad. A este respecto, un 100 % significa que se han exterminado todas las orugas; un 0 % que ninguna oruga ha sido destruida.

En este ensayo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación, por ejemplo, muestran una actividad ≥ 80 % para una cantidad de aplicación de 500 ppm:

15 Ej. Nº: 1-1, 1-10, 1-11, 1-114, 1-1 15, 1-12, 1-123, 1-124, 1-126, 1-127, 1-129, 1-13, 1-130, 1-131, 1-132, 1-133, 1-134, 1-135, 1-139, 1-14, 1-143, 1-146, 1-147, 1-149, 1-15, 1-151, 1-152, 1-155, 1- 159, 1-16, 1-160, 1-164, 1-167, 1-170, 1-172, 1-173, 1-174, 1-176, 1-177, 1-183, 1-185, 1-186, 1-187, 1-188, 1-189, 1-19, 1-190, 1-191, 1-192, 1-2, 1-20, 1-21, 1-22, 1-25, 1-29, 1-3, 1-30, 1-4, 1-5, 1-6, 1-67, 1-7, 1-70, 1-71, 1-8, 1-9, 1-111, 1-72, 1-73, 1-74, 1-75, 1-76, 1-81, 1-83, 1-85, 1-86, 1-99

Ensayo de *Tetranychus*, resistente a OP (tratamiento de pulverización)

Disolvente: 78,0 partes en peso de acetona

20 1,5 partes en peso de dimetilformamida

Emulsionante: 0,5 partes en peso de alquilaril poliglicol éter

Para elaborar una preparación adecuada de principios activos se mezcla 1 parte en peso de principio activo con las cantidades indicadas de disolvente y emulsionante y se diluye el concentrado con agua que contiene emulsionante a la concentración deseada.

25 Discos de hojas de alubia (*Phaseolus vulgaris*) infestados por todos los estadios de araña roja común (*Tetranychus urticae*) se pulverizan con una preparación de principios activos a la concentración deseada.

Después de 6 días se determina el tanto por ciento de actividad. A este respecto, un 100 % significa que se han exterminado todas las arañas rojas; un 0 % que no se ha destruido ninguna araña roja.

30 En este ensayo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación, por ejemplo, muestran una actividad ≥ 80 % para una cantidad de aplicación de 500 ppm:

Ej. Nº: 1-116, 1-192, 1-199, 1-5, 1-83

Ensayo de *Boophilus microplus* (Inyección)

Disolvente: dimetilsulfóxido

35 Para elaborar una preparación de principios activos adecuada se mezclan 10 mg de principio activo con 0,5 ml de dimetilsulfóxido y se diluye el concentrado con agua a la concentración deseada. La solución de principio activo se inyecta en el abdomen (*Boophilus microplus*) y los animales se trasladan a bandejas y se mantienen en una cámara climatizada. El control de actividad se realiza sobre la puesta de huevos fértiles.

Después de 7 días se determina el tanto por ciento de actividad. A este respecto, un 100 % significa que ninguna garrapata ha puesto huevos fértiles.

40 En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una actividad ≥ 80 % para una cantidad de aplicación de 20 $\mu\text{g}/\text{animal}$:

1-222	1-225	1-245	1-274
1-224	1-235	1-254	1-299

Lucilia cuprina (48h)

Disolvente: dimetilsulfóxido

Para elaborar una preparación de principios activos adecuada se mezclan 10 mg de principio activo con 0,5 ml de dimetilsulfóxido y se diluye el concentrado con agua a la concentración deseada. Se infestan con larvas de *Lucilia cuprina* recipientes que contienen carne de caballo que se ha tratado con la preparación de principios activos a la concentración deseada.

- 5 Después de 2 días se determina el tanto por ciento de destrucción. A este respecto, un 100 % significa que todas las larvas han sido exterminadas; un 0 % que no se ha destruido ninguna larva.

En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una actividad ≥ 80 % para una cantidad de aplicación de 100 ppm:

1-127	1-176	1-234	1-246	1-279	7-1
1-131	1-222	1-235	1-254	1-299	7-2
1-132	1-224	1-238		1-305	7-20
1-147	1-225	1-239	1-258	1-308	
1-172	1-230	1-245	1-274	1-326	

10 **Ensayo de *Musca domestica***

Disolvente: dimetilsulfóxido

Para elaborar una preparación de principios activos adecuado se mezclan 10 mg de principio activo con 0,5 ml de dimetilsulfóxido y se diluye el concentrado con agua a la concentración deseada. Se infestan con *Musca domestica* adulta recipientes que contienen una esponja que se ha tratado con la preparación de principios activos a la concentración deseada.

- 15

Después de 2 días se determina el tanto por ciento de destrucción. A este respecto, un 100 % significa que todas las moscas han sido exterminadas; un 0 % que no se ha destruido ninguna mosca.

En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una actividad ≥ 80 % para una cantidad de aplicación de 100 ppm:

1-147	1-238	1-246	1-258	1-258
1-172	1-239	1-254	1-274	1-274
1-234	1-245	1-255	1-279	1-279
7-2				

- 20

En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una actividad ≥ 80 % para una cantidad de aplicación de 20 ppm:

1-127, 1-222, 1-224, 1-225, 1-230, 1-299, 7-20

25 **Ensayo de *Myzus* (tratamiento de pulverización)**

Disolvente: 78 partes en peso de acetona

1,5 partes en peso de dimetilformamida

Emulsionante: 0,5 partes en peso de alquilaril poliglicol éter

Para elaborar una preparación adecuada de principios activos se mezcla 1 parte en peso de principio activo con las cantidades indicadas de disolvente y emulsionante y se diluye el concentrado con agua que contiene emulsionante a la concentración deseada. Se pulverizan discos de hojas de col china (*Brassica pekinensis*), que están infestados con todos los estadios del pulgón verde del melocotonero (*Myzus persicae*), con una preparación de principios activos a la concentración deseada.

- 30

Después de 6 días se determina el tanto por ciento de actividad. A este respecto, un 100 % significa que todos los pulgones han sido exterminados; un 0 % que no se ha destruido ningún pulgón.

- 35

En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una actividad ≥ 80 % para una cantidad de aplicación de 500 g/ha:

1-22	1-229	1-242	1-272	1-279	1-314	3-4	3-12	7-23
1-222	1-230	1-246	1-274	1-289	1-316	3-5	7-1	9-1
1-223	1-231	1-254	1-275	1-299	1-322	3-6	7-2	
1-224	1-235	1-258	1-276	1-301	1-325	3-7	7-7	
1-225	1-236	1-261	1-277	1-307	1-326	3-8	7-20	
1-226	1-239	1-271	1-278	1-308	3-1	3-11	7-21	

Ensayo de *Phaedon* (tratamiento de pulverización)

Disolvente: 78,0 partes en peso de acetona

1,5 partes en peso de dimetilformamida

5 Emulsionante: 0,5 partes en peso de alquilaril poliglicol éter

10 Para elaborar una preparación adecuada de principios activos se mezcla 1 parte en peso de principio activo con las cantidades indicadas de disolvente y emulsionante y se diluye el concentrado con agua que contiene emulsionante a la concentración deseada. Se pulverizan discos de hojas de col china (*Brassica pekinensis*) con una preparación de principios activos a la concentración deseada y después de secar se infestan con larvas del escarabajo de la mostaza (*Phaedon cochleariae*).

Después de 7 días se determina el tanto por ciento de actividad. A este respecto, un 100 % significa que todas las larvas de escarabajo han sido exterminadas; un 0 % que no se ha destruido ninguna larva de escarabajo.

En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una actividad ≥ 80 % para una cantidad de aplicación de 500 g/ha:

15	1-221	1-238		1-283	1-301		7-11	7-25
	1-222	1-239		1-284			7-13	7-3
	1-223	1-241	1-271	1-285			7-14	7-4
	1-224	1-242	1-274	1-289			7-15	7-5
	1-225	1-246	1-275		1-307		7-16	7-6
	1-226	1-250	1-276		1-308		7-17	7-7
	1-227	1-254	1-277		1-315	3-13	7-18	7-8
	1-229		1-278			3-7	7-2	7-9
	1-230		1-279			3-8	7-20	9-1
	1-231	1-258	1-280		1-322	3-9	7-21	9-2
	1-235	1-260	1-281	1-299	1-325	7-1	7-22	9-3
	1-236	1-261	1-282		1-326	7-10	7-24	9-4

Ensayo de *Spodoptera frugiperda* (tratamiento de pulverización)

Disolvente: 78,0 partes en peso de acetona

20 1,5 partes en peso de dimetilformamida

Emulsionante: 0,5 partes en peso de alquilaril poliglicol éter

25 Para elaborar una preparación adecuada de principios activos se mezcla 1 parte en peso de principio activo con las cantidades indicadas de disolvente y emulsionante y se diluye el concentrado con agua que contiene emulsionante a la concentración deseada. Se pulverizan discos de hojas de maíz (*Zea mays*) con una preparación de principios activos a la concentración deseada y después de secar se infestan con orugas del gusano cogollero (*Spodoptera frugiperda*).

Después de 7 días se determina el tanto por ciento de actividad. A este respecto, un 100 % significa que se han exterminado todas las orugas; un 0 % que ninguna oruga ha sido destruida.

En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una actividad $\geq 80\%$ para una cantidad de aplicación de 500 g/ha:

1-221	1-231	1-254	1-271		1-308	3-7	7-25
1-222	1-235		1-272		1-314	3-9	7-4
1-224	1-236		1-274		1-315	7-19	7-7
1-225	1-238	1-258	1-276	1-299	1-316	7-2	7-8
1-226	1-239	1-260	1-277	1-301		3-10	7-20
1-227	1-241	1-261	1-278		1-322	3-12	7-21
1-228	1-242	1-262	1-293		1-325	3-13	7-22
1-229	1-246				1-326	3-14	7-23
1-230	1-250	1-270		1-307		3-15	7-24

Ensayo de *Tetranychus*, resistente a OP (tratamiento de pulverización)

5 Disolvente: 78,0 partes en peso de acetona

1,5 partes en peso de dimetilformamida

Emulsionante: 0,5 partes en peso de alquilaril poliglicol éter

10 Para elaborar una preparación adecuada de principios activos se mezcla 1 parte en peso de principio activo con las cantidades indicadas de disolvente y emulsionante y se diluye el concentrado con agua que contiene emulsionante a la concentración deseada. Discos de hojas de alubia (*Phaseolus vulgaris*) infestados por todos los estadios de araña roja común (*Tetranychus urticae*) se pulverizan con una preparación de principios activos a la concentración deseada.

Después de 6 días se determina el tanto por ciento de actividad. A este respecto, un 100 % significa que se han exterminado todas las arañas rojas; un 0 % que no se ha destruido ninguna araña roja.

15 En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una actividad $\geq 80\%$ para una cantidad de aplicación de 500g/ha:

1-258 1-275
7-2

Ensayo de *Spodoptera litura* (tratamiento de pulverización)

Disolvente: 3 partes en peso de dimetilformamida

Emulsionante: 1 parte en peso de polioxietileno alquilfenil éter

20 Para elaborar una preparación adecuada de principios activos se mezcla 1 parte en peso de principio activo con las cantidades indicadas de disolvente y emulsionante y se diluye el concentrado con agua que contiene emulsionante a la concentración deseada.

Se sumergen hojas de batata (*Pomoea batatas*) en una preparación de principios activos de la concentración deseada y después de secar se infestan con orugas del gusano del algodón (*Spodoptera litura*).

25 Después de 7 días se determina el tanto por ciento de actividad. A este respecto, un 100 % significa que se han exterminado todas las orugas; un 0 % que ninguna oruga ha sido destruida.

En este ensayo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación, por ejemplo, muestran una actividad del 100 % para una cantidad de aplicación de 100 ppm:

30 1-177, 1-190, 1-232, 1-234, 1-235, 1-236, 1-237, 1-238, 1-239, 1-240, 1-241, 1-242, 1-243, 1-244, 1-245, 1-246, 1-247, 1-248, 1-252, 1-253, 1-254, 1-258, 1-259, 1-264, 1-265, 1-266, 1-267, 1-268, 1-269, 1-288, 1-305, 1-310, 1-311, 1-312, 1-313, 1-314, 1-317, 1-318, 1-319, 1-324, 1-325, 1-326,

Ensayo de *Aulacophora femoralis* (tratamiento de pulverización)

Disolvente: 3 partes en peso de dimetilformamida

Emulsionante: 1 parte en peso de polioxietileno alquilfenil éter

Para elaborar un preparado de principios activos conveniente, se mezcla 1 parte en peso de principio activo con las cantidades indicadas de disolvente y emulsionante y se diluye el concentrado con agua a la concentración deseada. Se sumergen hojas de pepino (*Cucumis sativus*) en una preparación de principios activos de la concentración deseada y después de secar se infestan con larvas de *Aulacophora femoralis*.

5

Después de 7 días se determina el tanto por ciento de actividad. A este respecto, un 100 % significa que se han exterminado todas las orugas; un 0 % que ninguna oruga ha sido destruida.

En este ensayo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación, por ejemplo, muestran una actividad del 100 % para una cantidad de aplicación de 500 ppm:

- 10 1-177, 1-190, 1-232, 1-233, 1-234, 1-235, 1-236, 1-237, 1-238, 1-239, 1-240, 1-241, 1-242, 1-243, 1-244, 1-245, 1-246, 1-247, 1-248, 1-249, 1-251, 1-252, 1-253, 1-254, 1-258, 1-259, 1-260, 1-261, 1-264, 1-266, 1-267, 1-268, 1-269, 1-270, 1-273, 1-287, 1-288, 1-290, 1-292, 1-305, 1-306, 1-309, 1-310, 1-311, 1-312, 1-314, 1-318, 1-319, 1-322, 1-324, 1-325, 1-326, 3-13, 3-16,

- 5 cicloalquilo C₃-C₈, halocicloalquilo C₃-C₈, cicloalquenilo C₃-C₈, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, alquil C₁-C₆-sulfanilalquilo C₁-C₆, alquil C₁-C₆-carbonilalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-carbonilalquilo C₁-C₆, cicloalquil C₃-C₈-alquilo C₁-C₆, cicloalquil C₃-C₈-alquilo-C₁-C₆ halogenado, fenil-alquilo C₁-C₆, que dado el caso está monosustituido o polisustituido en el anillo de fenilo, con sustituyentes iguales o diferentes, con halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, nitro o ciano; heteroarilo, que dado el caso está monosustituido o polisustituido, con sustituyentes iguales o diferentes, con -OH, -SH, -NH₂, halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆-sulfanilo, alquil C₁-C₆-sulfinilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, mono-alquil C₁-C₆-amino, di-alquil C₁-C₆-amino, nitro o ciano; heteroaril-alquilo C₁-C₆, que dado el caso está monosustituido o polisustituido en la parte heteroaromática, con sustituyentes iguales o diferentes, con -OH, -SH, -NH₂, halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆-sulfanilo, alquil C₁-C₆-sulfinilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, mono-alquil C₁-C₆-amino, di-alquil C₁-C₆-amino, nitro o ciano; heterociclil-alquilo C₁-C₆, que dado el caso está monosustituido o polisustituido en el heterociclo, con sustituyentes iguales o diferentes, con -OH / =O, -SH / =S, -NH₂, halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆-sulfanilo, alquil C₁-C₆-sulfinilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, mono-alquil C₁-C₆-amino, di-alquil C₁-C₆-amino, nitro o ciano.
- 15 R² representa un resto de la serie hidrógeno, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₈, halocicloalquilo C₃-C₈, cicloalquenilo C₃-C₈, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, alquil C₁-C₆-carbonilalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-carbonilalquilo C₁-C₆, fenil-alquilo C₁-C₆, que dado el caso está monosustituido o polisustituido en el anillo de fenilo, con sustituyentes iguales o diferentes, con halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, nitro o ciano; heteroarilo, que dado el caso está monosustituido o polisustituido, con sustituyentes iguales o diferentes, con -OH, -SH, -NH₂, halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆-sulfanilo, alquil C₁-C₆-sulfinilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, mono-alquil C₁-C₆-amino, di-alquil C₁-C₆-amino, nitro o ciano; heteroaril-alquilo C₁-C₆, que dado el caso está monosustituido o polisustituido en la parte heteroaromática, con sustituyentes iguales o diferentes, con -OH, -SH, -NH₂, halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆-sulfanilo, alquil C₁-C₆-sulfinilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, mono-alquil C₁-C₆-amino, di-alquil C₁-C₆-amino, nitro o ciano; heterociclil-alquilo C₁-C₆, que dado el caso está monosustituido o polisustituido en el heterociclo, con sustituyentes iguales o diferentes, con -OH / =O, -SH / =S, -NH₂, halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆-sulfanilo, alquil C₁-C₆-sulfinilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, mono-alquil C₁-C₆-amino, di-alquil C₁-C₆-amino, nitro o ciano.
- 20 R³ representa un resto de la serie hidrógeno, alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, haloalquilo C₃-C₈, cicloalquilo C₃-C₈, halocicloalquilo C₃-C₈, cicloalquenilo C₃-C₈, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, alquil C₁-C₆-carbonilalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-carbonilalquilo C₁-C₆, fenil-alquilo C₁-C₆, que dado el caso está monosustituido o polisustituido en el anillo de fenilo, con sustituyentes iguales o diferentes, con halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, nitro o ciano; heteroarilo, que dado el caso está monosustituido o polisustituido, con sustituyentes iguales o diferentes, con -OH, -SH, -NH₂, halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆-sulfanilo, alquil C₁-C₆-sulfinilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, mono-alquil C₁-C₆-amino, di-alquil C₁-C₆-amino, nitro o ciano; heteroaril-alquilo C₁-C₆, que dado el caso está monosustituido o polisustituido en la parte heteroaromática, con sustituyentes iguales o diferentes, con -OH, -SH, -NH₂, halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆-sulfanilo, alquil C₁-C₆-sulfinilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, mono-alquil C₁-C₆-amino, di-alquil C₁-C₆-amino, nitro o ciano; heterociclil-alquilo C₁-C₆, que dado el caso está monosustituido o polisustituido en el heterociclo, con sustituyentes iguales o diferentes, con -OH / =O, -SH / =S, -NH₂, halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆-sulfanilo, alquil C₁-C₆-sulfinilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, mono-alquil C₁-C₆-amino, di-alquil C₁-C₆-amino, nitro o ciano.
- 30 R⁴ representa 3-piridilo y pirazolilo, que en cada caso, dado el caso, está monosustituido o polisustituido, con sustituyentes iguales o diferentes, con restos de la serie halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-alcoxi C₁-C₆, COOH, nitro, amino, mono-alquil C₁-C₆-amino, di-alquil C₁-C₆-amino, alquil C₁-C₆-aminocarbonilo y cicloalquil C₃-C₆-aminocarbonilo.
- 35 R⁴ también representa pirazolilo, que dado el caso está sustituido con halógeno o alquilo C₁-C₆, fenilo (que a su vez pueden estar sustituido con halógeno) o con pirazolilmetilo (que a su vez puede estar sustituido con haloalquilo C₁-C₆).
- 40 R⁵ representa fenilo, 2-piridilo o 3-piridilo, que en cada caso, dado el caso, está monosustituido o polisustituido, con sustituyentes iguales o diferentes, con restos de la serie halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, halocicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-alcoxi C₁-C₆, nitro, amino, ciano, monoalquil C₁-C₆-amino, dialquil C₁-C₆-amino, alquil C₁-C₆-sulfanilo, alquil C₁-C₆-sulfinilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, haloalquil C₁-C₆-sulfanilo, haloalquil C₁-C₆-sulfinilo, haloalquil C₁-C₆-sulfonilo, hetariloxi-alquilo C₁-C₆, hetariloxi y hetaril-alquilo C₁-C₆, seleccionándose el resto hetarilo de la serie pirrolilo, imidazolilo, pirazolilo, triazolilo, piridilo, pirimidinilo y tetrazolilo y pudiendo estar sustituido, a su vez, con sustituyentes de la serie halógeno, ciano, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₈ y halocicloalquilo C₃-C₈.
- 50 R⁵ también representa hidrógeno, halógeno, alquilo C₁-C₄ y cicloalquilo C₃-C₆.

5 R^6 representa un resto de la serie hidrógeno, halógeno, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 -alquilo C_1-C_6 , alquil C_1-C_6 -carbonilo, haloalquil C_1-C_6 -carbonilo, cicloalquilo C_3-C_6 , cicloalquil C_3-C_6 -alquilo C_1-C_6 , alquil C_1-C_6 -sulfanilo, alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , alcoxi C_1-C_6 -carbonilo, alquenil C_2-C_6 -oxicarbonilo, alquinil C_2-C_6 -oxicarbonilo, alcoxi C_1-C_6 -carbonilalquilo C_1-C_6 ; fenilo, fenil-alquilo C_1-C_6 , que en cada caso, dado el caso, está monosustituido o polisustituido en el anillo de fenilo, con sustituyentes iguales o diferentes, con halógeno, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , nitro o ciano; heterocicilil-alquilo C_1-C_6 , que dado el caso está monosustituido o polisustituido en el heterociclo, con sustituyentes iguales o diferentes, con halógeno, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , nitro o ciano; y fenilcarbonilo, que dado el caso está monosustituido o polisustituido en el anillo de fenilo, con sustituyentes iguales o diferentes, con halógeno, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , nitro o ciano.

X representa oxígeno o azufre.

3. Compuestos de fórmula (I) según la reivindicación 1, en la que

15 R^1 representa un resto de la serie alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alquenilo C_2-C_6 , alquinilo C_2-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , halocicloalquilo C_3-C_6 , alcoxi C_1-C_6 -alquilo C_1-C_6 , alquil C_1-C_6 -sulfanilalquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 -carbonilalquilo C_1-C_6 y cicloalquil C_3-C_6 -alquilo C_1-C_6 y cicloalquil C_3-C_6 -alquilo- C_1-C_6 halogenado,

R^2 representa hidrógeno,

R^3 representa hidrógeno,

20 R^4 representa 3-piridilo que, dado el caso, está monosustituido o polisustituido con restos de la serie halógeno, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , halocicloalquilo C_3-C_6 , cicloalquil C_3-C_6 -alquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , alquil C_1-C_6 -aminocarbonilo y cicloalquil C_3-C_6 -aminocarbonilo.

R^4 también representa pirazolilo, que dado el caso está sustituido con halógeno (preferentemente F, Cl, Br) y alquilo C_1-C_6 (preferentemente metilo, etilo y propilo), fenilo (que a su vez puede estar sustituido con halógeno) o con pirazolilmetilo (que a su vez puede estar sustituido con haloalquilo C_1-C_6 , en particular alquilo C_1-C_6 fluorado).

25 R^5 representa un resto de la serie fenilo, 2-piridilo o 3-piridilo, que en cada caso, dado el caso, está monosustituido o polisustituido, con sustituyentes iguales o diferentes, con al menos un resto de la serie halógeno, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 , haloalcoxi C_1-C_6 , nitro, ciano, alquil C_1-C_6 -sulfanilo, alquil C_1-C_6 -sulfinilo, alquil C_1-C_6 -sulfonilo, haloalquil C_1-C_6 -sulfanilo, haloalquil C_1-C_6 -sulfinilo, haloalquil C_1-C_6 -sulfonilo, hetariloxi-alquilo C_1-C_6 , hetariloxi y hetaril-alquilo C_1-C_6 , seleccionándose el resto hetarilo de la serie pirrolilo, imidazolilo, pirazolilo, triazolilo, piridilo, pirimidinilo y tetrazolilo y pudiendo estar sustituido, a su vez, con sustituyentes de la serie de halógeno, ciano, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_8 y halocicloalquilo C_3-C_8 .

R^5 también representa un resto de la serie hidrógeno, halógeno, alquilo C_1-C_4 y cicloalquilo C_3-C_6 .

35 R^6 representa un resto de la serie hidrógeno, halógeno, alquilo C_1-C_6 , haloalquilo C_1-C_6 , cicloalquilo C_3-C_6 , alquil C_1-C_6 -sulfanilo y fenilo, que puede estar sustituido con halógeno y

X representa oxígeno.

4. Compuestos de fórmula (I) según la reivindicación 1, en la que

40 R^1 representa un resto de la serie CH_3 , CH_2CH_3 , $CH(CH_3)_2$, ciclopropilo, halociclopropilo, $C(CH_3)_3$, $CH(CH_3)CH_2SCH_3$, $CH_2CH_2CH_3$, $CH(CH_3)CH_2CH_3$, CH_2CF_3 , $CHCH_3CF_3$, $CH(CH_3)$ ciclopropilo y

R^2 representa hidrógeno.

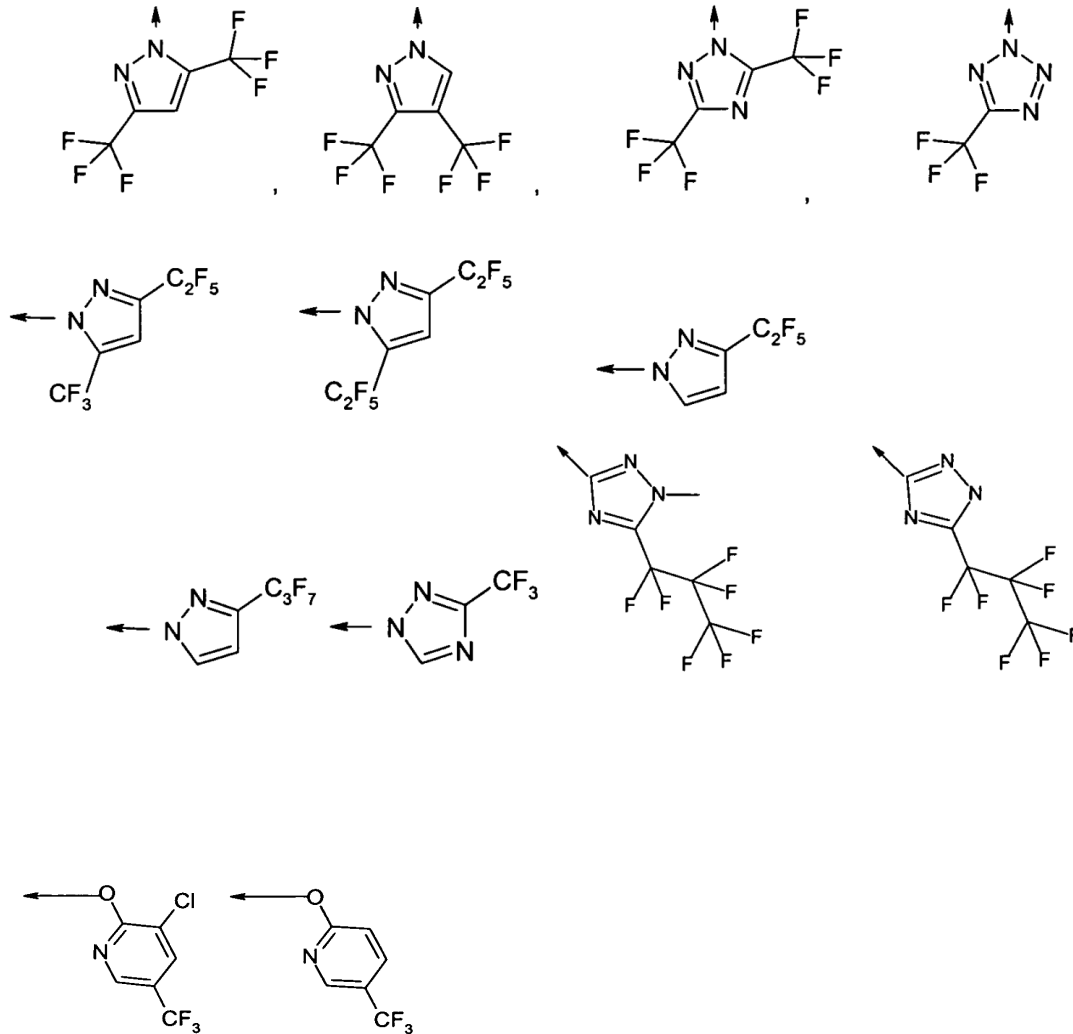
R^3 representa hidrógeno.

R^4 representa 3-piridilo, que está sustituido en la posición 2 con un sustituyente de la serie F, Cl, Br, metilo, etilo, CF_3 , CH_2CF_3 , $CHFCH_3$, $CHFCH_3$, ciclopropilo y ciclopropilmetilo.

45 R^4 representa también pirazolilo, que puede estar sustituido con F, Cl, metilo, etilo o con pirazolilmetilo, que a su vez puede estar sustituido con haloalquilo C_1-C_6 ,

R^5 representa fenilo, que está monosustituido o polisustituido con un resto de la serie CH_3 , F, Cl, CF_3 , $CF(CF_3)_2$, OCH_3 , OCF_3 , NO_2 , CN, SCF_3 , $S(O)CF_3$ y $S(O)_2CF_3$ y CH_2-Q ,

Q representa un resto de la serie



en los que la fecha indica la posición de unión con el grupo CH₂,

R⁶ representa hidrógeno y

5 X representa oxígeno.

5. Agente, caracterizado por un contenido de al menos un compuesto de la fórmula (I) según la reivindicación 1 y diluyentes y/o sustancias tensioactivas habituales.

10 6. Procedimiento para combatir parásitos de plantas, de la higiene y de productos almacenados, caracterizado por que se deja actuar un compuesto de la fórmula (I) según la reivindicación 1 o un agente según la reivindicación 5 sobre los parásitos y/o su hábitat.

7. Uso de compuestos de la fórmula (I) según la reivindicación 1 o de agentes según la reivindicación 5 para combatir parásitos de plantas, de la higiene y de productos almacenados.

8. Composiciones farmacéuticas que contienen al menos un compuesto según la reivindicación 1.

15 9. Uso de al menos un compuesto según la reivindicación 1 para preparar composiciones farmacéuticas para combatir parásitos en animales.