

19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 471 392**

51 Int. Cl.:

C07D 333/36 (2006.01)
A01N 43/10 (2006.01)
A01N 43/18 (2006.01)
A01P 7/02 (2006.01)
A01P 7/04 (2006.01)
C07D 335/02 (2006.01)
C07D 409/12 (2006.01)
C07D 417/12 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **09.11.2010 E 10829922 (3)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **07.05.2014 EP 2500342**

54 Título: **Derivado de 1-heterodieno y agente de control de plagas**

30 Prioridad:

12.11.2009 JP 2009258651

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

26.06.2014

73 Titular/es:

**NIPPON SODA CO., LTD. (100.0%)
2-1, Ohtemachi 2-chome Chiyoda-ku
Tokyo 100-8165, JP**

72 Inventor/es:

**TAKAHASHI, JYUN;
NAKAMURA, TAKEHIKO;
MIYAZAWA, MASAHIRO;
HAMAMOTO, ISAMI y
KANAZAWA, JYUN**

74 Agente/Representante:

CURELL AGUILÁ, Mireia

ES 2 471 392 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

Derivado de 1-heterodieno y agente de control de plagas.

5 Campo técnico

La presente invención se refiere a un nuevo derivado de 1-heterodieno o una sal del mismo, y a un agente de control de plagas que contiene, como principio activo, al menos uno seleccionado entre derivados de 1-heterodieno, y a una sal de los mismos.

10

Esta solicitud reivindica la prioridad de la solicitud de patente japonesa nº 2009-258651, presentada el 12 de noviembre de 2009, cuya descripción se incorpora a la presente memoria como referencia.

15 Antecedentes de la técnica

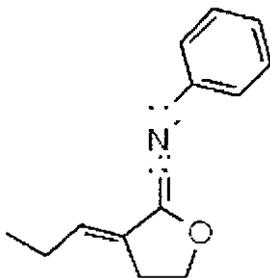
Son conocidos numerosos compuestos que tienen actividad insecticida y acaricida. Sin embargo, todavía existen problemas, tales como falta de eficacia, limitaciones con respecto al uso debido a problemas relacionados con la resistencia a fármacos, problemas de lesión por el plaguicida, y fuerte toxicidad para las personas, animales, peces, y similares.

20

Como compuestos que tienen una cadena principal similar a la del compuesto de la presente invención, la Bibliografía 1 no de patente describe un compuesto representado por la Fórmula (2), y la Bibliografía 2 no de patente describe un compuesto representado por la Fórmula (3). Sin embargo, la bioactividad de los compuestos descritos en estas bibliografías no de patentes no está clara.

25

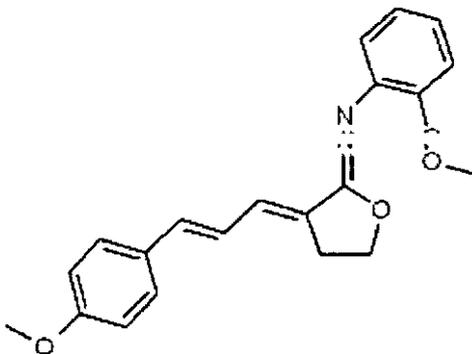
[Fórmula Química 1]



30

Fórmula (2)

[Fórmula Química 2]



35

Fórmula (3)

Listado de citas

40

Bibliografía no de patente

Bibliografía 1 no de patente J. Chem. Soc., Perkin Trans 1, 1995, 373-378

Bibliografía 2 no de patente J. Org. Chem., 72, 8005-8009 (2007)

Se hace referencia además al documento JP 2006 117604; Takahata *et al.*, "Journal of the Chemical Society, Chemical Communications", 1986, página 1671; O'Mant *et al.*, "Journal of the Chemical Society, section C: organic", 1968, páginas 1501-1505.

5

Sumario de la invención

Problema técnico

10

Un objetivo de la presente invención es proporcionar un derivado de 1-heterodieno que tiene una nueva cadena principal, que se puede sintetizar industrialmente y también tiene excelente actividad biológica y efectos residuales, o una sal del mismo, y un agente de control de plagas.

Solución al problema

15

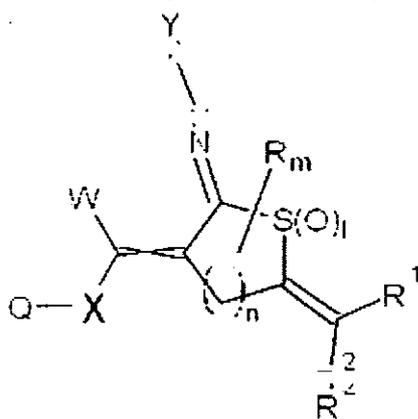
Se han realizado estudios para lograr el objetivo mencionado anteriormente, y se ha descubierto que un derivado de 1-heterodieno que tiene una estructura específica, o una sal del mismo, tiene excelente actividad insecticida y acaricida, y de este modo se ha completado la presente invención.

20

A saber, la presente invención incluye lo siguiente.

<1> Un derivado de 1-heterodieno representado por la Fórmula (1):

[Fórmula química 3]



25

Fórmula (1)

en la que Q en la Fórmula (1) representa un grupo alquilo de C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquenilo de C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquinilo de C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo cicloalquilo de C3-8 sustituido o no sustituido, un grupo cicloalquenilo de C4-8 sustituido o no sustituido, un grupo arilo de C6-10 sustituido o no sustituido, o un grupo heterocíclico sustituido o no sustituido;

30

W representa un átomo de hidrógeno, o un grupo alquilo de C1-6 no sustituido;

Y representa un grupo arilo de C6-10 sustituido o no sustituido,

35

X representa un átomo de oxígeno, un átomo de azufre, un grupo sulfinilo, o un grupo sulfonilo;

1 representa el número de átomos de oxígeno entre paréntesis, y es cualquier número entero de 0 a 2;

40

n representa el número de repeticiones de grupos metileno en el paréntesis, y es cualquier número entero de 1 a 4;

R representa un grupo alquilo de C1-6 no sustituido, un grupo alquenilo de C2-6 no sustituido, un grupo alquinilo de C2-6 no sustituido, un grupo cicloalquilo de C3-8 no sustituido, un grupo cicloalquenilo de C4-8 no sustituido, un grupo arilo de C6-10 no sustituido, o un grupo heterocíclico no sustituido;

45

m representa el número de R(s), y es cualquier número entero de 0 a 8, y, cuando m es 2 o más, R puede ser igual o diferente, y también cualquier plural R(s) se puede combinar para formar un anillo de 3 a 8 miembros no sustituido o sustituido;

50

R¹ y R², cada uno representan independientemente un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo de C1-6 no

sustituido, o un grupo cicloalquilo de C3-8 no sustituido,

un isómero E, un isómero Z, o una mezcla de los mismos se expresa mediante un estereoenlace doble carbono-carbono (estereoenlaces dobles no definidos) en la Fórmula (1);

o una sal del mismo.

<2> El derivado de 1-heterodieno según el <1> anterior, en el que n es 2, o una sal del mismo.

<3> El derivado de 1-heterodieno según el <1> o <2> anterior, en el que Q es un grupo arilo de C6-10 sustituido o no sustituido, o un grupo heterocíclico sustituido o no sustituido, o una sal del mismo.

<4> El derivado de 1-heterodieno según uno cualquiera de los <1> a <3> anteriores, en el que Y es un grupo arilo de C6-10 sustituido o no sustituido, o una sal del mismo.

<5> Un agente de control de plagas que comprende, como principio activo, al menos uno seleccionado del derivado de 1-heterodieno según uno cualquiera de los <1> a <4> anteriores, y una sal del mismo.

<6> El agente de control de plagas según el <5> anterior, en el que la plaga es un insecto o acárido.

Efectos ventajosos de la invención

Según la presente invención, es posible proporcionar un derivado de 1-heterodieno que tiene una nueva estructura, o una sal del mismo. La presente invención también puede proporcionar un agente de control de plagas que incluye, como principio activo, el derivado de 1-heterodieno o una sal del mismo, que tiene excelente actividad biológica, particularmente excelente actividad biológica frente a insectos y acáridos, y también tiene una seguridad elevada.

Descripción de las formas de realización

El derivado de 1-heterodieno según la presente invención es un compuesto representado por la Fórmula (1) mencionada anteriormente. Cada grupo en la Fórmula (1) se describirá en detalle a continuación. Tal como se usa en la presente memoria, "grupo --- de Ca-b" y "grupo --- de Cc" significan que los números de átomos de carbono que constituyen los grupos son "a a b" y "c".

"Que tiene un sustituyente" significa que cualquier átomo de hidrógeno en el "grupo" que sirve como núcleo madre está sustituido con un grupo que tiene una estructura que es diferente de la del núcleo madre. No existe limitación particular en el número del "sustituyente".

Los ejemplos de "sustituyente" incluyen "el grupo alquilo de C1-6", "el grupo alqueno de C2-6", "el grupo alquino de C2-6", "el grupo cicloalquilo de C3-8", "el grupo cicloalqueno de C4-8", "el grupo arilo de C6-10", "el grupo heterocíclico", "el grupo acilo de C1-11", "el grupo (1-imino)-alquilo de C1-6", "el grupo alcoxi de C1-6", "el átomo de halógeno", "el grupo sililo", "el grupo hidroxilo", "el grupo amino", "el grupo tiol", "el grupo sulfonilo", "el grupo sulfonilo", "el grupo ciano", "el grupo nitro", "el grupo formilo", "el grupo haloalquilo de C1-6", "el grupo arilo", o "el grupo aralquilo de C7-12" definido a continuación. En estos "sustituyentes", cualquier átomo de hidrógeno en el "sustituyente" anterior puede estar sustituido con el otro "sustituyente".

Q en la Fórmula (1) representa un grupo alquilo de C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alqueno de C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquino de C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo cicloalquilo de C3-8 sustituido o no sustituido, un grupo cicloalqueno de C4-8 sustituido o no sustituido, un grupo arilo de C6-10 sustituido o no sustituido, o un grupo heterocíclico sustituido o no sustituido.

En Q en la Fórmula (1), el "grupo alquilo de C1-6 no sustituido" es un grupo de hidrocarburo saturado lineal o ramificado de 1 a 6 átomos de carbono. Los ejemplos de los mismos incluyen un grupo metilo, un grupo etilo, un grupo n-propilo, un grupo i-propilo, un grupo n-butilo, un grupo s-butilo, un grupo i-butilo, un grupo t-butilo, un grupo n-pentilo, un grupo n-hexilo, y similares.

Los ejemplos del "grupo alquilo de C1-6 que tiene un sustituyente" incluyen "grupo alquilo de C1-6" que tiene un "grupo cicloalquilo de C3-6" como sustituyente (por ejemplo, "un grupo cicloalquil C3-6-alquilo de C1-6", y preferiblemente "un grupo cicloalquil C3-6-alquilo de C1-2") tal como un grupo ciclopropilmetilo, un grupo 2-ciclopropiletilo, un grupo ciclopentilmetilo, y un grupo 2-ciclohexiletilo; "grupos alquilo de C1-6" que tienen "un grupo cicloalqueno de C4-6" como sustituyentes (por ejemplo, "un grupo cicloalqueno C4-6-alquilo de C1-6", y preferiblemente "un grupo cicloalqueno C4-6-alquilo de C1-2") tal como un grupo ciclopentilmetilo, un grupo 3-ciclopentilmetilo, un grupo 3-ciclohexenilmetilo, y un grupo 2-(3-ciclohexenil)etilo; "grupos alquilo de C1-6" que tienen un "grupo halógeno" como sustituyente (por ejemplo, "un grupo haloalquilo de C1-6", preferiblemente "un grupo haloalquilo de C1-6 sustituido con 1 a 3 átomos de halógeno", más preferiblemente un grupo trifluorometilo) tal como un grupo fluorometilo, un grupo clorometilo, un grupo bromometilo, un grupo difluorometilo, un grupo

5 diclorometilo, un grupo dibromometilo, un grupo trifluorometilo, un grupo triclorometilo, un grupo tribromometilo, un grupo 2,2,2-trifluoroetilo, un grupo 2,2,2-tricloroetilo, un grupo pentafluoroetilo, un grupo 4-fluorobutilo, un grupo 4-clorobutilo, un grupo 3,3,3-trifluoropropilo, un grupo 2,2,2-trifluoro-1-trifluorometiletilo, un grupo perfluorohexilo, un grupo perclorohexilo, y un grupo 2,4,6-triclorohexilo; "grupos alquilo de C1-6" que tienen un "grupo arilo de C6-10" como sustituyente (por ejemplo, "un grupo aril C6-10-alquilo de C1-6", y preferiblemente "un grupo fenil-alquilo de C1-2") tal como un grupo bencilo, un grupo fenetilo, un grupo 3-fenilpropilo, un grupo 1-naftilmetilo, y un grupo 2-naftilmetilo; "grupos alquilo de C1-6" que tienen un "grupo heterocíclico" como sustituyente (por ejemplo, "un grupo alquilo de C1-6 heterocíclico", y preferiblemente "un grupo alquilo de C1-2 heterocíclico de 5 a 6 miembros") tal como un grupo 2-piridilmetilo, un grupo 3-piridilmetilo, un grupo 4-piridilmetilo, un grupo 2-(2-piridil)etilo, un grupo 2-(3-piridil)etilo, un grupo 2-(4-piridil)etilo, un grupo 3-(2-piridil)propilo, un grupo 3-(3-piridil)propilo, un grupo 3-(4-piridil)propilo, un grupo 2-pirazilmetilo, un grupo 3-pirazilmetilo, un grupo 2-(2-pirazil)etilo, un grupo 2-(3-pirazil)etilo, un grupo 3-(2-pirazil)propilo, un grupo 3-(3-pirazil)propilo, un grupo 2-pirimidilmetilo, un grupo 4-pirimidilmetilo, un grupo 2-(2-pirimidil)etilo, un grupo 2-(4-pirimidil)etilo, un grupo 3-(2-pirimidil)propilo, un grupo 3-(4-pirimidil)propilo, un grupo 2-furilmetilo, un grupo 3-furilmetilo, un grupo 2-(2-furil)etilo, un grupo 2-(3-furil)etilo, un grupo 3-(2-furil)propilo, y un grupo 3-(3-furil)propilo; "grupos alquilo de C1-6" que tienen un "grupo hidroxilo" como sustituyente (por ejemplo, "un grupo hidroxil-alquilo de C1-6", y preferiblemente "un grupo hidroxil-alquilo de C1-2") tal como un grupo hidroximetilo, un grupo hidroxietilo, y un grupo hidroxipropilo; y similares.

20 Los ejemplos del "grupo alquilo de C1-6 que tiene un sustituyente" en el que cualquier átomo de hidrógeno en el sustituyente anterior está sustituido con el otro "sustituyente" incluyen "grupos hidroxil-alquilo de C1-6" que tienen un "grupo alquilo de C1-6" como sustituyente (por ejemplo, "un grupo alcoxi C1-6-alquilo de C1-6", y preferiblemente "un grupo alcoxi C1-6-alquilo de C1-2") tal como un grupo metoximetilo, un grupo etoximetilo, un grupo metoxietilo, un grupo etoxietilo, un grupo metoxi-n-propilo, un grupo etoximetilo, un grupo etoxietilo, un grupo n-propoximetilo, un grupo i-propoxietilo, un grupo s-butoximetilo, un grupo t-butoxietilo, un grupo 1,2-dimetoxietilo, y un grupo 2,2-dimetoxietilo; "grupos alquilo de C1-6" que tienen un "grupo oxil" como sustituyente, tal como un grupo epoxi y un grupo 2,3-epoxipropilo; "grupo hidroxil-alquilo de C1-6" que tiene un "grupo acilo de C1-11" como sustituyente (por ejemplo "un grupo aciloxi C1-11-alquilo de C1-6", y preferiblemente "un grupo aciloxi C2-7-alquilo de C1-2") tal como un grupo formiloximetilo, un grupo acetoximetilo, un grupo 2-acetoxietilo, un grupo propioniloximetilo, y un grupo propioniloxietilo; y similares.

30 En Q en la Fórmula (1), el "grupo alqueno de C2-6 no sustituido" es un grupo de hidrocarburo insaturado lineal o ramificado, de 2 a 6 átomos de carbono, que tiene al menos un doble enlace carbono-carbono. Los ejemplos de los mismos incluyen un grupo vinilo, un grupo 1-propenilo, un grupo alilo, un grupo 1-butenilo, un grupo 2-butenilo, un grupo 3-butenilo, un grupo 1-pentenilo, un grupo 2-pentenilo, un grupo 3-pentenilo, un grupo 4-pentenilo, un grupo 1-hexenilo, un grupo 2-hexenilo, un grupo 3-hexenilo, un grupo 4-hexenilo, un grupo 5-hexenilo, un grupo 1-metil-2-propenilo, un grupo 2-metil-2-propenilo, un grupo 1-metil-2-butenilo, un grupo 2-metil-2-butenilo, y similares. Entre estos grupos, se prefiere un grupo alqueno de C2-4.

40 Los ejemplos del "grupo alqueno de C2-6 que tiene un sustituyente" incluyen "grupos alqueno de C2-6" que tienen un "grupo halógeno" como sustituyente (por ejemplo, "un grupo haloalqueno de C2-6", y preferiblemente "un grupo haloalqueno de C2-6 sustituido con 1 a 3 átomos de halógeno") tal como un grupo 3-cloro-2-propenilo, un grupo 4-cloro-2-butenilo, un grupo 4,4-dicloro-3-butenilo, un grupo 4,4-difluoro-3-butenilo, un grupo 3,3-dicloro-2-propenilo, un grupo 2,3-dicloro-2-propenilo, un grupo 3,3-difluoro-2-propenilo, un grupo 2,4,6-tricloro-2-hexenilo, y similares.

45 En Q en la Fórmula (1), el "grupo alquino de C2-6 no sustituido" es un grupo de hidrocarburo insaturado lineal o ramificado, de 2 a 6 átomos de carbono, que tiene al menos un triple enlace carbono-carbono. Los ejemplos del mismo incluyen un grupo etinilo, un grupo 1-propinilo, un grupo propargilo, un grupo 1-butinilo, un grupo 2-butinilo, un grupo 3-butinilo, un grupo 1-pentinilo, un grupo 2-pentinilo, un grupo 3-pentinilo, un grupo 4-pentinilo, un grupo 1-hexinilo, un grupo 1-metil-2-propinilo, un grupo 2-metil-3-butinilo, un grupo 1-metil-2-butinilo, un grupo 2-metil-3-pentinilo, un grupo 1,1-dimetil-2-butinilo, y similares. Entre estos grupos, se prefiere un grupo alquino de C2-4.

50 Los ejemplos del "grupo alquino de C2-6 que tiene un sustituyente" incluyen "grupos alquino de C2-6" que tienen un "grupo halógeno" como sustituyente (por ejemplo, "un grupo haloalquino de C2-6", y preferiblemente "un grupo haloalquino de C2-6 sustituido con 1 a 3 átomos de halógeno") tal como un grupo 3-cloro-1-propinilo, un grupo 3-cloro-1-butinilo, un grupo 3-bromo-1-butinilo, un grupo 3-bromo-2-propinilo, un grupo 3-yodo-2-propinilo, un grupo 3-bromo-1-hexinilo, un grupo 5,5-dicloro-2-metil-3-pentinilo, un grupo 4-cloro-1,1-dimetil-2-butinilo, y similares.

60 En Q en la Fórmula (1), el "grupo cicloalquilo de C3-8 no sustituido" es un grupo de hidrocarburo saturado de 3 a 8 átomos de carbono, que tiene un resto cíclico. Los ejemplos del mismo incluyen un grupo ciclopropilo, un grupo ciclobutilo, un grupo ciclopentilo, un grupo ciclohexilo, y similares.

65 Los ejemplos del "grupo cicloalquilo de C3-8 que tiene un sustituyente" incluyen el "grupo cicloalquilo de C3-8" que tiene un "grupo alquilo de C1-6" como sustituyente (por ejemplo, "un grupo alquil C1-6-cicloalquilo de C3-8", y preferiblemente "un grupo cicloalquilo de C4-8 sustituido con un 1 a 3 grupos alquilo de C1-2") tal como un grupo 2,3,3-trimetilciclobutilo, un grupo 4,4,6,6-tetrametilciclohexilo, un grupo 1,3-dibutilciclohexilo, y similares.

En Q en la Fórmula (1), el “grupo cicloalqueno de C4-8 no sustituido” es un grupo alqueno de 4 a 8 átomos de carbono, que tiene un resto cíclico. Los ejemplos del mismo incluyen un grupo 1-ciclobutenilo, un grupo 1-ciclopentenilo, un grupo 3-ciclopentenilo, un grupo 1-ciclohexenilo, un grupo 3-ciclohexenilo, un grupo 3-cicloheptenilo, un grupo 4-ciclooctenilo, y similares.

Los ejemplos del “grupo cicloalqueno de C4-8 que tiene un sustituyente” incluyen el “grupo cicloalqueno de C4-8” que tiene un “grupo alquilo de C1-6” como sustituyente (por ejemplo, “un grupo alquil C1-6-cicloalqueno de C4-8”, y preferiblemente “un grupo cicloalqueno de C4-6 sustituido con 1 a 3 grupos alquilo de C1-2”) tal como un grupo 2-metil-3-ciclohexenilo, un grupo 3,4-dimetil-3-ciclohexenilo, y similares.

En Q en la Fórmula (1), el “grupo arilo de C6-10 no sustituido” es un grupo arilo monocíclico o policíclico de 6 a 10 átomos de carbono. En el grupo arilo policíclico, cuando al menos un anillo es un anillo aromático, el anillo restante puede ser cualquiera de un anillo de hidrocarburo saturado, un anillo de hidrocarburo insaturado o un anillo de hidrocarburo aromático. Los ejemplos del mismo incluyen un grupo fenilo, un grupo naftilo, un grupo azuleno, un grupo indenilo, un grupo indanilo, un grupo tetralinilo, y similares. Entre estos grupos, se prefiere un grupo fenilo.

Los ejemplos del “grupo arilo de C6-10 que tiene un sustituyente” incluyen un grupo 2-clorofenilo, un grupo 4-hidroxifenilo, y similares.

En Q en la Fórmula (1), el “grupo heterocíclico no sustituido” es un grupo que tiene un anillo de 3 a 7 miembros, que tiene, como átomos que constituyen del anillo, 1 a 4 heteroátomos seleccionados de un átomo de nitrógeno, un átomo de oxígeno y un átomo de azufre, además de un átomo de carbono. Los ejemplos del mismo incluyen un grupo que tiene un heterociclo aromático, un heterociclo saturado, un heterociclo insaturado, o un heterociclo condensado de estos heterociclos con un anillo bencénico. Los ejemplos más específicos de los mismos incluyen un grupo aziridin-1-ilo, un grupo aziridin-2-ilo; un grupo tetrahidrofuran-2-ilo, un grupo tetrahidrofuran-3-ilo, un grupo pirrolidin-1-ilo, un grupo pirrolidin-2-ilo, un grupo pirrolidin-3-ilo; un grupo pirrol-1-ilo, un grupo pirrol-2-ilo, un grupo pirrol-3-ilo, un grupo furan-2-ilo, un grupo furan-3-ilo, un grupo tiofen-2-ilo, un grupo tiofen-3-ilo, un grupo imidazol-1-ilo, un grupo imidazol-2-ilo, un grupo imidazol-4-ilo, un grupo imidazol-5-ilo, un grupo pirazol-1-ilo, un grupo pirazol-3-ilo, un grupo pirazol-4-ilo, un grupo pirazol-5-ilo, un grupo oxazol-2-ilo, un grupo oxazol-4-ilo, un grupo oxazol-5-ilo, un grupo tiazol-2-ilo, un grupo tiazol-4-ilo, un grupo tiazol-5-ilo, un grupo isoxazol-3-ilo, un grupo isoxazol-4-ilo, un grupo isoxazol-5-ilo, un grupo isotiazol-3-ilo, un grupo isotiazol-4-ilo, un grupo isotiazol-5-ilo, un grupo 1,2,3-triazol-1-ilo, un grupo 1,2,3-triazol-4-ilo, un grupo 1,2,3-triazol-5-ilo, un grupo 1,2,4-triazol-1-ilo, un grupo 1,2,4-triazol-3-ilo, un grupo 1,2,4-triazol-5-ilo, un grupo 1,3,4-oxadiazol-2-ilo, un grupo 1,2,4-oxadiazol-3-ilo, un grupo 1,3,4-tiadiazol-2-ilo, un grupo 1,2,4-tiadiazol-3-ilo, un grupo tetrazol-1-ilo, un grupo tetrazol-2-ilo; un grupo piridin-2-ilo, un grupo piridin-3-ilo, un grupo piridin-4-ilo, un grupo pirazin-2-ilo, un grupo pirimidin-2-ilo, un grupo pirimidin-4-ilo, un grupo pirimidin-5-ilo, un grupo piridazin-3-ilo, un grupo piridazin-4-ilo, un grupo triazinilo; un grupo oxazol-1-ilo, un grupo oxazol-2-ilo, un grupo indol-3-ilo, un grupo indol-4-ilo, un grupo indol-5-ilo, un grupo indol-6-ilo, un grupo indol-7-ilo, un grupo benzofuran-2-ilo, un grupo benzofuran-3-ilo, un grupo benzofuran-4-ilo, un grupo benzofuran-5-ilo, un grupo benzofuran-6-ilo, un grupo benzofuran-7-ilo, un grupo benzotiofen-2-ilo, un grupo benzotiofen-3-ilo, un grupo benzotiofen-4-ilo, un grupo benzotiofen-5-ilo, un grupo benzotiofen-6-ilo, un grupo benzotiofen-7-ilo, un grupo isoindol-1-ilo, un grupo isoindol-2-ilo, un grupo isoindol-4-ilo, un grupo isoindol-5-ilo, un grupo isoindol-6-ilo, un grupo isoindol-7-ilo, un grupo isobenzofuran-1-ilo, un grupo isobenzofuran-4-ilo, un grupo isobenzofuran-5-ilo, un grupo isobenzofuran-6-ilo, un grupo isobenzofuran-7-ilo, un grupo benzoimidazol-1-ilo, un grupo benzoimidazol-2-ilo, un grupo benzoimidazol-4-ilo, un grupo benzoimidazol-5-ilo, un grupo benzoxazol-2-ilo, un grupo benzoxazol-4-ilo, un grupo benzoxazol-5-ilo, un grupo benzotiazol-2-ilo, un grupo benzotiazol-4-ilo, un grupo benzotiazol-5-ilo; un grupo cromen-2-ilo, un grupo cromen-3-ilo, un grupo cromen-4-ilo, un grupo cromen-5-ilo, un grupo cromen-6-ilo, un grupo cromen-7-ilo, un grupo cromen-8-ilo, un grupo quinolin-2-ilo, un grupo quinolin-3-ilo, un grupo quinolin-4-ilo, un grupo quinolin-5-ilo, un grupo quinolin-6-ilo, un grupo quinolin-7-ilo, un grupo quinolin-8-ilo, un grupo isoquinolin-1-ilo, un grupo isoquinolin-3-ilo, un grupo isoquinolin-4-ilo, un grupo isoquinolin-5-ilo, un grupo isoquinolin-6-ilo, un grupo isoquinolin-7-ilo, un grupo isoquinolin-8-ilo; un grupo piperidin-1-ilo, un grupo piperidin-2-ilo, un grupo piperidin-3-ilo, un grupo piperidin-4-ilo, un grupo piperazin-1-ilo, un grupo piperazin-2-ilo, un grupo piperazin-3-ilo, un grupo morfolin-2-ilo, un grupo morfolin-3-ilo, un grupo morfolin-4-ilo; 1,3-benzodioxol-4-ilo, un grupo 1,3-benzodioxol-5-ilo, un grupo 1,4-benzodioxan-5-ilo, un grupo 1,4-benzodioxan-6-ilo, un grupo 3,4-dihidro-2H-1,5-benzodioxepin-6-ilo, un grupo 3,4-dihidro-2H-1,5-benzodioxepin-7-ilo, un grupo 2,3-dihidrobenzofuran-4-ilo, un grupo 2,3-dihidrobenzofuran-5-ilo, un grupo 2,3-dihidrobenzofuran-6-ilo, un grupo 2,3-dihidrobenzofuran-7-ilo; y similares.

Entre estos grupos, se prefiere un grupo heterocíclico de 5 a 7 miembros, y un grupo pirazol-1-ilo, un grupo pirazol-3-ilo, un grupo pirazol-4-ilo, un grupo pirazol-5-ilo, un grupo piridin-2-ilo, un grupo piridin-3-ilo, un grupo piridin-4-ilo, un grupo pirazin-2-ilo y un grupo pirazin-3-ilo son particularmente preferidos.

Los ejemplos del “grupo heterocíclico que tiene un sustituyente” incluyen un grupo 5-pirazolon-1-ilo, un grupo 5-pirazolon-3-ilo, un grupo 5-pirazolon-4-ilo, un grupo 3,5-dimetilpirazol-1-ilo, un grupo 3,5-dimetilpirazol-4-ilo, un grupo cloropiridin-2-ilo, un grupo cloropiridin-3-ilo, un grupo cloropiridin-4-ilo, un grupo hidroxipiridin-2-ilo, un grupo hidroxipiridin-3-ilo, un grupo hidroxipiridin-4-ilo, un grupo 2,5-dimetilpirazin-3-ilo, un grupo 2,5-dimetilpirazin-6-ilo, y similares.

En la Fórmula (1), W representa un átomo de hidrógeno, o un grupo alquilo de C1-6 no sustituido.

En W en la Fórmula (1), los ejemplos del “grupo alquilo de C1-6 no sustituido” incluyen los grupos respectivos que son los mismos como se describen en Q.

5

En la Fórmula (1), Y representa un grupo arilo de C6-10 sustituido o no sustituido. Ejemplos del arilo de C6-10 sustituido o no sustituido, en Y, incluyen los grupos respectivos que son los mismos como se describen en Q.

10

En la Fórmula (1), X representa un átomo de oxígeno, un átomo de azufre, un grupo sulfinilo, o un grupo sulfonilo.

1 representa el número de átomo de oxígeno en el paréntesis, y es cualquier número entero de 0 a 2.

n representa el número de repeticiones de grupos metileno en el paréntesis, y es cualquier número entero de 1 a 4.

15

En la Fórmula (1), R representa un grupo alquilo de C1-6 no sustituido, un grupo alqueno de C2-6 no sustituido, un grupo alquino de C2-6 no sustituido, un grupo cicloalquilo de C3-8 no sustituido, un grupo cicloalqueno de C4-8 no sustituido, un grupo arilo de C6-10 no sustituido, o un grupo heterocíclico no sustituido.

20

Los ejemplos del grupo alquilo de C1-6 no sustituido, grupo alqueno de C2-6 no sustituido, grupo alquino de C2-6 no sustituido, grupo cicloalquilo de C3-8 no sustituido, grupo cicloalqueno de C4-8 no sustituido, grupo arilo C6-10 no sustituido, o grupo heterocíclico no sustituido en R incluyen los grupos respectivos que son los mismos como se describen en Q.

25

m representa el número de R(s), y es un número entero cualquiera de 0 a 8. Cuando m es 2 o más, R puede ser igual o diferente. Cualquier plural R(s) se puede combinar para formar un anillo de 3 a 8 miembros no sustituido o sustituido. Los ejemplos del anillo de 3 a 8 miembros no sustituido o sustituido a formar combinando R(s) incluyen un anillo de hidrocarburo saturado, un anillo de hidrocarburo insaturado, un anillo de hidrocarburo aromático, un heterociclo saturado, un heterociclo insaturado o un heterociclo aromático. También, este anillo de 3 a 8 miembros y un anillo de hidrocarburo aromático no sustituido o sustituido o un heterociclo aromático se pueden combinar para formar un anillo condensado. Los ejemplos del anillo condensado incluyen un anillo de tetrahidronaftaleno, anillo de indano, un anillo de tetrahydroisoquinolina, un anillo de tetrahydrobenzofurano, un anillo de 1,2-benzisotiazol, un anillo de ciclopentapirimidina, y similar.

30

35

En la Fórmula (1), R¹ y R² representan cada uno independientemente un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo de C1-6 no sustituido, o un grupo cicloalquilo de C3-8 no sustituido.

Los ejemplos del grupo alquilo de C1-6 no sustituido y del grupo cicloalquilo de C3-8 no sustituido en R¹ y R² incluyen los grupos respectivos que son los mismos como se describe en Q.

40

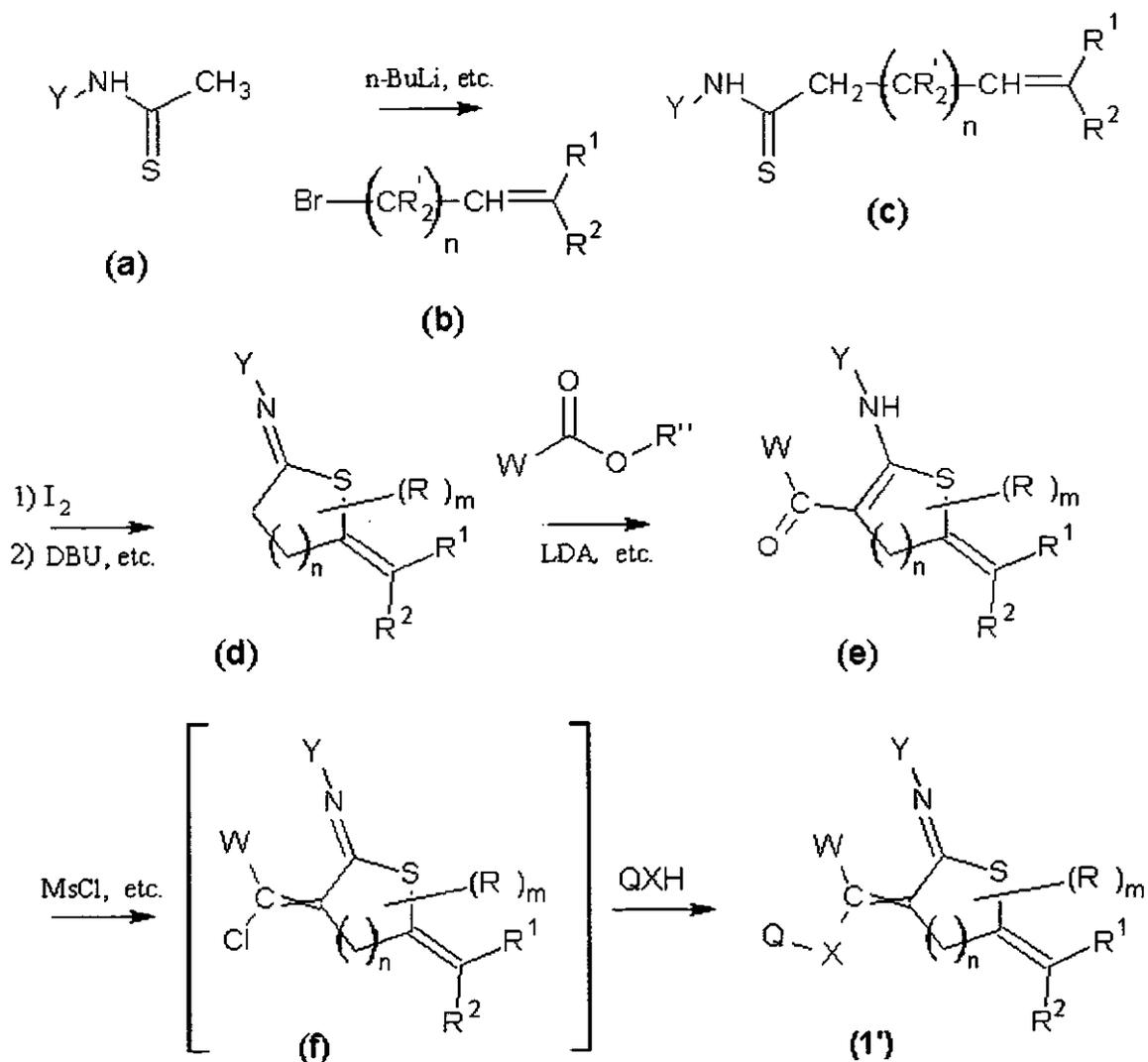
Las sales del derivado de 1-heterodieno según la presente invención son sales agrihortícolamente aceptables del compuesto representado por la Fórmula (1). Sus ejemplos incluyen sales de ácidos inorgánicos tales como ácido clorhídrico, ácido sulfúrico y ácido tetrafluorobórico; sales de ácidos orgánicos tales como ácido acético y ácido láctico; sales de metales alcalinos tales como litio, sodio y potasio; sales de metales alcalino-térreos tales como calcio y magnesio; sales de metales de transición tales como hierro y cobre; sales de bases orgánicas tales como amoníaco, trietilamina, tributilamina, piridina e hidrazina; y similares.

45

50

El derivado de 1-heterodieno según la presente invención y una sal del mismo (en lo sucesivo algunas veces denominados como un “compuesto de la presente invención”) se describirán de forma más específica más abajo por medio de los Ejemplos de Producción del derivado de 1-heterodieno representado por la Fórmula (1). Los Ejemplos de Producción mencionados a continuación son proporcionados únicamente a título ilustrativo y no limitativo del alcance de la invención.

[Fórmula Química 4]



5 En el esquema de reacción mencionado anteriormente, Q, W, Y, n, R, m, R¹ y R² tienen los mismos significados que aquellos en la Fórmula (1). R' representa un átomo de hidrógeno o R. R'' representa un grupo alquilo.

El compuesto representado por la Fórmula (1') se pueden sintetizar, por ejemplo, mediante la siguiente manera.

10 En primer lugar, un compuesto representado por la Fórmula (a) se hace reaccionar con un compuesto representado por la Fórmula (b) en presencia de un compuesto de organolitio, tal como n-butil-litio, para sintetizar un compuesto representado por la Fórmula (c). Después, se añade yodo para formar un anillo, seguido de la desyodación con una base, tal como diazabicicoundeceno, para obtener un compuesto representado por la Fórmula (d). Se le añade un compuesto de éster en presencia de una base, tal como diisopropilamido de litio, para obtener un compuesto representado por la Fórmula (e). Después, el compuesto se hace reaccionar con cloruro de mesilo o cloruro de tosilo para dar un compuesto representado por la Fórmula (f), y de este modo se puede obtener un compuesto representado por la Fórmula (1') añadiendo tiol, alcohol, fenol o similar.

20 En cualquier reacción, si se requiere la purificación del producto después de terminar la reacción y las operaciones subsiguientes de post-tratamiento normales, el compuesto diana se puede aislar mediante purificación usando medios convencionalmente conocidos, tales como destilación, recristalización, o cromatografía en columna.

La estructura del compuesto diana se puede identificar y confirmar por medios de análisis conocidos tales como análisis elemental, espectroscopía de RMN, espectroscopía de IR y espectroscopía de MS.

25 Puesto que los compuestos de la presente invención tienen actividades adulticidas, ninficidas, larvicidas y ovidas, se pueden usar para controlar insectos que dañan a las cosechas, acáridos, insectos sanitarios, insectos de plagas

de granos almacenados, insectos de la ropa, insectos domésticos, y similares. Los organismos específicos que son la diana del control incluyen los siguientes.

5 Las plagas que pertenecen al orden de Lepidoptera tales como *Spodoptera litura*, *Mamestra brassicae*, *Agrotis ipsilon*, green caterpillars, *Autographa nigrisigna*, *Plutella xylostella*, *Adoxophyes honmai*, *Homona magnanima*, *Carposina sasakii*, *Grapholita molesta*, *Phyllocnistis citrella*, *Caloptilia theivora*, *Phyllonorycter ringoniella*, *Lymantria dispar*, *Eu-proctis pseudoconsersa*, *Chilo suppressalis*, *Cnaphalocrocis medinalis*, *Ostrinia nubilalis*, *Hyphantria cunea*, *Cadra cautella*, género *Heliothis*, género *Helicoverpa*, género *Agrothis*, *Tinea translucens*, *Cydia pomonella*, y *Pectinophora gossypiella*; plagas que pertenecen al orden de Hemiptera tales como *Myzus persicae*, *Aphis gossypii*,
10 *Lipaphis erysimi*, *Rhopalosiphum padi*, *Riptortus clavatus*, *Nezara antennata*, *Unaspis yanonensis*, *Pseudococcus comstocki*, *Trialeurodes vaporariorum*, *Bemisia tabaci*, *Bemisia argentifolii*, *Psylla pyrisuga*, *Stephanitis nashi*, *Nilaparvata lugens*, *Laodelphax stratella*, *Sogatella furcifera*, y *Nephotettix cincticeps*; plagas que pertenecen al orden de Coleoptera tales como *Phyllotreta striolata*, *Aulacophora femoralis*, *Leptinotarsa decemlineata*, *Lissorhoptus oryzophilus*, *Sitophilus zeamais*, *Callosobruchus chinensis*, *Popillia japonica*, *Anomala rufocuprea*,
15 género *Diabrotica*, *Lasioderma serricorne*, *Lyctus brunneus*, *Monochamus alternatus*, *Anoplophora malasiaca*, género *Agriotis*, *Epilachna vigintioctopunctata*, *Tenebroides mauritanicus*, y *Anthonomus grandis*; plagas que pertenecen al orden de Diptera tales como *Musca domestica*, *Calliphora lata*, *Boettcherisca peregrine*, *Zeugodacus cucurbitae*, *Bactrocera dorsalis*, *Delia platura*, *Agromyza oryzae*, *Drosophila melanogaster*, *Stomoxys calcitrans*, *Culex tritaeniorhynchus*, *Aedes aegypti*, y *Anopheles sinensis*; plagas que pertenecen al orden de Thysanoptera tales como *Thrips palmi* y *Scirtothrips dorsalis*; plagas que pertenecen al orden de Hymenoptera tales como *Monomorium pharaonis*, *Vespa simillima xanthoptera*, y *Athalia rosae ruficornis*; plagas que pertenecen al orden de Orthoptera tales como *Locusta migratoria*, *Blattella germanica*, *Periplaneta americana*, y *Periplaneta fuliginosa*; plagas que pertenecen al orden de Isoptera tales como *Coptotermes formosanus* y *Reticulitermes speratus speratus*;
20 plagas que pertenecen al orden de Siphonaptera tales como *Pulex irritans* y *Ctenocephalides felis*; plagas que pertenecen al orden de Phthiraptera tales como *Pediculus humanus*; Acarina tales como *Tetranychus urticae*, *Tetranychus cinnabarinus*, *Tetranychus kanzawai*, *Panonychus citri*, *Panonychus ulmi*, *Aculops pelekassi*, *Aculus schlechtendali*, *Polyphagotarsonemus latus*, género *Brevipalpus*, género *Eotetranychus*, *Rhizoglyphus robini*, *Tyrophagus putrescentiae*, *Dermatophagoides farinae*, *Boophilus microplus*, y *Haemaphysalis longicornis*; y nematodos parásitos de plantas, tales como *Meloidogyne incognita*, *Pratylenchus* spp., *Heterodera glycines*, *Aphelenchoides besseyi*, y *Bursaphelenchus xylophilus*.

Las plagas a las que la presente invención se aplica preferiblemente son plagas que pertenecen al orden de Lepidoptera, plagas que pertenecen al orden de Hemiptera, Acarina, plagas que pertenecen al orden de Thysanoptera, y plagas que pertenecen al orden de Coleoptera.

35 Además, los fármacos que también son eficaces para plagas de Acarina que son de línea resistente son deseados puesto que, en años recientes, la resistencia a plaguicidas organofosforados, plaguicidas de carbamato, o acaricidas, desarrollada entre muchas plagas tales como *Plutella xylostella*, *Delphacidae*, *Deltocephalidae*, y *Aphididae* han provocado problemas debido a los efectos insuficientes de estos fármacos. Los compuestos de la presente invención son fármacos que tienen efectos insecticidas y acaricidas excelentes no sólo sobre aquellas de líneas sensibles, sino también sobre plagas de líneas resistentes a plaguicidas organofosforados, plaguicidas de carbamato, y plaguicidas de piretroides, y sobre Acarina de líneas resistentes a acaricidas.

45 Adicionalmente, los compuestos de la presente invención son fármacos que muestran menos lesiones herbicidas, tienen menor toxicidad para los peces y animales de sangre caliente, y tienen una mayor seguridad.

El agente de control de plagas según la presente invención contiene el compuesto representado por la Fórmula (1) de la presente invención como principio activo. El compuesto representado por la Fórmula (1) de la presente invención se puede usar solo, o se pueden usar dos o más tipos de ellos en combinación. Los compuestos de la presente invención se pueden usar directamente sin añadir otros constituyentes en caso de la aplicación directamente. Sin embargo, generalmente se usan mezclándolos con vehículos sólidos, vehículos líquidos, o vehículos gaseosos, o sumergiéndolos en sustratos tales como placas cerámicas porosas y tejidos no tejidos, seguido de la adición de tensioactivos u otros adyuvantes, si es necesario, para formularlos, para el uso como plaguicidas, en forma de plaguicidas convencionales tales como polvos humectables, gránulos, polvos finos, concentrados emulsionables, polvos solubles en agua, suspensiones, polvos humectables granulares, fluides, aerosoles, aerosoles, agentes de transpiración por calor, fumigantes, cebos venenosos, y micropartículas.

60 Cuando los compuestos se usan como agentes sólidos, es posible usar, como aditivos y vehículos, polvos vegetales tales como granos de haba de soja y trigos; polvos impalpables minerales tales como diatomeas, apatitas, yesos, talcos, bentonitas, pirofilitas, y arcillas; compuestos orgánicos o inorgánicos tales como benzoatos de sodio, ureas, y mirabilita.

65 Cuando los compuestos se usan como agentes líquidos, es posible usar, como disolventes, fracciones del petróleo tales como querosenos, xileno, y naftas disolventes; ciclohexanos, ciclohexanonas, dimetilformamidas, dimetilsulfóxidos, alcoholes, acetonas, metilisobutilcetonas, aceites minerales, aceites vegetales, agua y similares.

Es posible usar, como vehículos gaseosos usados para propelentes, gases del butano, LPG, éteres dimetilicos, y gases del ácido carbónico.

5 Es posible usar, como sustratos para cebos venenosos, componentes de cebos tales como polvos de cereales, aceites vegetales, azúcares, y celulosas cristalinas; antioxidantes tales como dibutilhidroxitolueno y ácido nordihidroguayarático; conservantes tales como ácido deshidroacético; agentes para evitar que los niños o las mascotas los coman por error, tales como pimientos en polvo; sabores para atraer a los insectos de las plagas, tales como sabores de queso y sabores de cebolla.

10 Si es necesario, se pueden añadir tensioactivos a estas formulaciones para formar sus conformaciones uniformes y estables. No hay ninguna limitación particular sobre los tensioactivos, y sus ejemplos incluyen tensioactivos no iónicos tales como éteres de alquilo añadidos con polioxietilenos, ésteres de ácidos grasos superiores añadidos con polioxietilenos, ésteres de ácidos grasos superiores con sorbitán añadidos con polioxietilenos, y éteres triesterilfenílicos añadidos con polioxietilenos; sales de ésteres sulfúricos de éteres alquilfenílicos añadidos con polioxietilenos, alquilnaftalenosulfonatos, policarboxilatos, ligninosulfonatos, condensados de formaldehído con alquilnaftalenosulfonatos, copolímeros de isobutileno-anhídridos maleicos, y similares.

15 Cuando los compuestos de la presente invención se usan como agentes de control de plagas para granjas, las cantidades de sus ingredientes activos en la formulación son de 0,01 a 90% en peso, y preferiblemente de 0,05 a 85% en peso. Los compuestos se pueden usar en forma de disoluciones, suspensiones o emulsiones mediante dilución con agua hasta sus concentraciones predeterminadas, en caso de polvos humectables, concentrados emulsionables, suspensiones, agentes fluibles, polvos solubles en agua y polvos humectables granulares, o se pueden usar directamente pulverizando sobre las plantas o suelos en caso de polvos finos y gránulos.

20 Cuando los compuestos de la presente invención se usan como agentes de control de plagas para prevenir epidemias, se pueden usar diluyéndolos con agua hasta sus concentraciones determinadas en caso de concentrados emulsionables, polvos humectables, y agentes fluibles, y los compuestos se pueden usar directamente en caso de disoluciones oleosas, aerosoles, aerosoles, cebos venenosos, y láminas contra ácaros.

25 Los compuestos de la presente invención también se pueden usar como agentes de control de plagas sanitarias, fármacos de animales, y similares. Cuando los compuestos de la presente invención se usan como agentes de control de plagas para prevenir parásitos externos de animales de animales domésticos tales como ganado vacuno y cerdos, o mascotas tales como perros y gatos, las formulaciones de los compuestos de la presente invención se usan generalmente según un método conocido en la técnica veterinaria. Los ejemplos del método incluyen un método para administrarlos para el control sistémico mediante comprimidos, cápsulas, líquidos de inmersión, 30 mezclas con piensos, supositorios, e inyecciones (intramuscular, subcutánea, intravenosa, intraperitoneal, etc.); un método para administrarlos para el control sistémico mediante pulverización, vertido, unción dorsal puntual de formulaciones oleosas o líquidas acuosas; y un método para portar materiales producidos moldeando formulaciones resinosas en formas adecuadas tales como collares y etiquetas de las orejas. En este caso, los compuestos de la presente invención se usan generalmente a una tasa de 0,01 a 1000 mg por 1 kg de animal hospedante.

35 No es necesario decir que los compuestos de la presente invención se pueden usar solos para ejercer sus efectos suficientes. Sin embargo, también se pueden mezclar con, o se pueden usar en combinación con al menos algún otro agente de control de plagas, fungicidas, insecticidas, acaricidas, herbicidas, reguladores del crecimiento vegetal, 40 sinérgicos, fertilizantes, acondicionadores del suelo, y piensos para animales.

45 Los ejemplos típicos de principios activos de los fungicidas, insecticidas, acaricidas, y reguladores del crecimiento vegetal, que se pueden mezclar con, o se pueden usar en combinación con los compuestos de la presente invención se muestran a continuación.

50 Fungicida:

55 captano, folpet, tiuram, ziram, zineb, maneb, mancozeb, propineb, policarbamato, clorotalonilo, quintozeno, captafol, iprodiona, procimidona, fluoroimida, mepronilo, flutolanilo, pencicuron, oxicarboxina, fosetil-aluminio, propamocarb, triadimefon, triadimenol, propiconazol, diclobutorazol, bitertanol, hexaconazol, microbutanilo, flusilazol, etaconazol, flutriamazol, flutriafeño, penconazol, diniconazol, ciproconazol, fenarimol, triflumizol, procloraz, imazalilo, pefurazoato, tridemorf, fenpropimorf, triforina, butiobato, pirifenox, anilazina, polioxina, metalaxilo, oxadixilo, furalaxilo, isoprotilano, probenazol, pirrolnitrina, blastidina S, kasugamicina, balidamicina, sulfato de dihidroestreptomocina, benomilo, carbendazim, tiofanato metilo, himexazol, cloruro de cobre básico, sulfato de cobre básico, acetato de fentina, hidróxido de trifenilestaño, dietofencarb, qinometionato, binapacril, lecitina, hidrogenocarbonato de sodio, ditianón, dinocap, fenaminosulf, diclomezina, guazatina, dodina, IBP, edifenfós, mepanipirim, ferimzona, triclamida, metasulfocarb, fluazinam, etoqinolaco, dimetomorf, piroquilon, tecloftalam, ftalida, óxido de fenazina, tiabendazol, triclazol, vinclozolina, cimoxanilo, ciclobutanilo, guazatina, hidrocioruro de propamocarb, ácido oxalínico, ciflufenamida, iminoctadina, kresoxim-metilo, triazina, fenhexamida, ciazofamida, 60 ciprodinilo, protioconazol, fenbuconazol, trifloxiestrobina, azoxiestrobina, hexaconazol, imibenconazol, tebuconazol, difenoconazol, y carpropamida.

Insecticidas/acaricidas:

5 compuestos a base de organofosfato, tales como profenofós, diclorvos, fenamifós, fenitrotión, EPN, diazinón, clorpirifós-metilo, acefato, protiofós, fostiazato, fosfocarb, cadusafós, disulfotón, clorpirifós, demetón-S-metilo, dimetoato, paratión, BRP, CVMP, CVP, CYAP, DEP, MPP, PAP, isoxatión, etión, etoprofós, quinalfós, clorpirifós, dimetilvinfós, vamidotión, piraclofós, fosalona, malationa, monocrotofós, y AKD-3088; compuestos a base de carbamato, tales como carbarilo, propoxur, aldicarb, carbofurano, tiodicarb, metomilo, oxamilo, etiofencarb, pirimicarb, fenobucarb, carbosulfano, benfuracarb, MIPC, MPMC, MTMC, alanicarb, piridafentiión, pirimfosmetilo, fenotiocarb, furatiocarb, bendiocarb, y XMC; derivados de nereistoxina, tales como cartap, tiociclám, y bensultap; compuestos a base de organocloro, tales como dicofol, tetradifón, y endosulfano; compuestos a base de metales orgánicos, tales como óxido de fenbutatina; compuestos a base de piretroides, tales como fenvalerato, permetrina, cipermetrina, deltametrina, cihalotrina, teflutrina, etofenprox, fenpropatrina, bifentrina, acrinatrina, aletrina, cicoprotrina, halfenprox, flucitrinató, y resmetrina; compuestos a base de benzoilurea, tales como diflubenzurón, clorfluzaurón, teflubenzurón, flufenoxurón, lufenurón, novalurón, bistrifluorón, noviflumurón, y triflumurón; compuestos semejantes de hormonas juveniles, tales como metopreno, piriproxifeno, y fenoxicarb; compuestos a base de piridazinona, tales como piridabeno; compuestos a base de pirazol, tales como fenpiroximato, fipronilo, tebufenpirad, etiprol, tolfenpirad, acetoprol, pirafluprol, y piriprol; neonicotinoides tales como imidacloprida, nitenpiram, acetamiprida, tiacloprida, tiametoxam, clotianidina, y dinotefurano; compuestos a base de hidrazina, tales como tebufenozida, metoxifenoazida, cromafenoazida, y halofenoazida; compuestos a base de dinitro; compuestos organoazufrados; compuestos a base de urea; compuestos a base de triazina; compuestos a base de hidazona; otros compuestos tales como flonicamida, buprofezina, hexitiazox, amitraz, clordimeform, silafluofeno, triazamato, pimetrozina, pirimidifeno, clorfenapir, indoxacarb, acequinocilo, etoxazol, ciromazina, 1,3-dicloropropeno, diafentiurón, benclotiaz, flufenerim, piridaliilo, espiroclorfenol, bifenazato, espiromesifeno, espirotetramat, propargita, clofentezina, fluacirpirim, flubendiamida, ciflumetofeno, cienopirafeno, MNI-0101, fenazaquina, metaflumizona, amidoflumet, CL-900167, DCIP, fenisobromolato, benzomato, metaldehído, clorantraniliprol, ciantraniliprol, espinetoram, y pirifluquinazona; antibióticos o antibióticos semisintéticos tales como avermectina, benzoato de emamectina, milbemectina, espinosad, ivermectina, y lepimectina; productos naturales tales como azadiractina y rotenona; y plaguicidas microbianos tales como BT y virus entomopatógenos, hongos entomopatógenos, y hongos nematófagos.

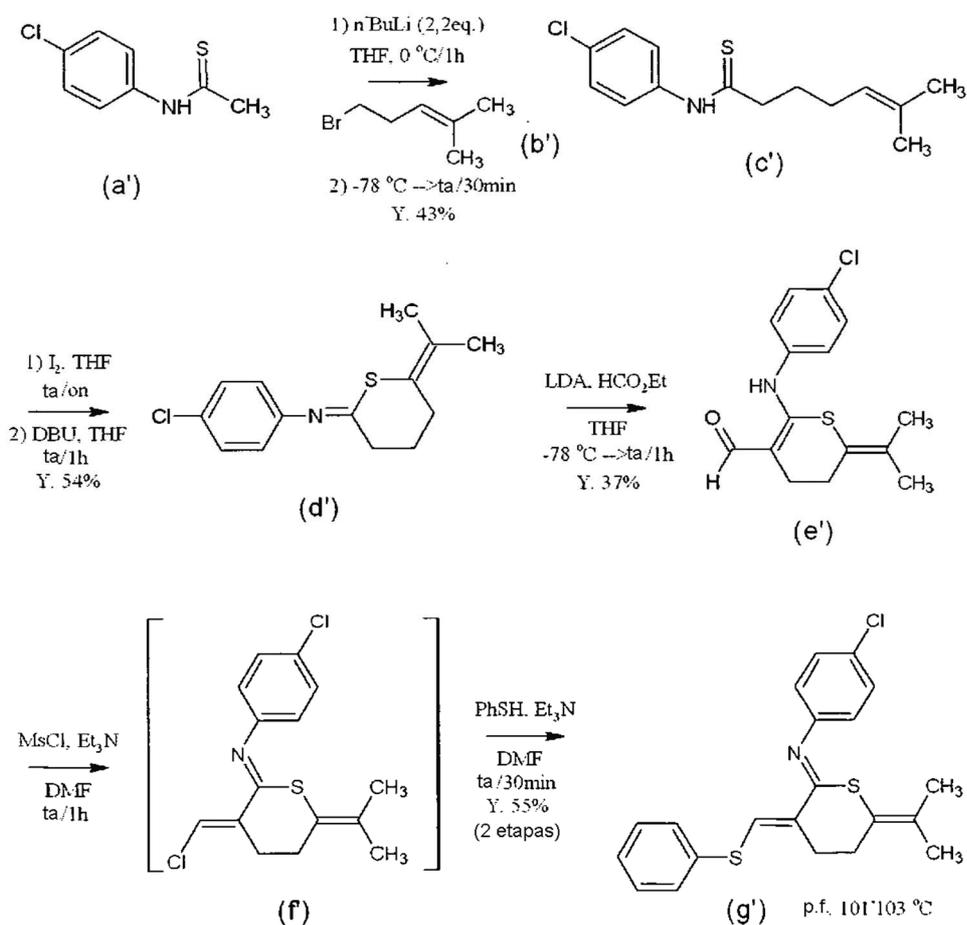
Reguladores del crecimiento vegetal:

35 ácido abscísico, ácido indolbutírico, uniconazol, eticlozato, etefón, cloxifonaco, clorquetat, extracto de chlorella, peróxido de calcio, cianamida, diclorprop, giberelina, daminozida, alcohol decílico, trinexapac-etilo, mepiquat-cloruro, paclobutrazol, parafina, cera, butóxido de piperonilo, piraflufen-etilo, flurprimidol, prohidrojasmona, prohexadiona-calcio, bencilaminopurina, pendimetalina, forclorfenurón, hidrazina maleica potásica, 1-naftilacetamida, 4-CPA, MCPB, colina, sulfato de oxiquinolona, eticlozato, butralina, 1-metilciclopropeno, e hidrocloreto de aviglicina.

40 **Ejemplos**

La presente invención se describirá con mayor detalle a continuación por medio de los Ejemplos, pero la presente invención no está limitada a estos Ejemplos.

[Fórmula Química 5]

5 **Ejemplo 1**

(I) Síntesis de (4-cloro-fenil)-amida del ácido 6-metil-5-heptenotioico (compuesto representado por la fórmula (c'))

En una disolución de tetrahidrofurano deshidratada (35 ml) de N-(4-cloro-fenil)-tioacetamida (3,3 g), se añadieron
 10 gota a gota 27 ml de n-butil-litio (1,59 mol/l, disolución en n-hexano) a 0°C en una atmósfera de nitrógeno. Después
 de agitar a 0°C durante 1 hora, la mezcla se enfrió hasta -78°C. Se le añadió gota a gota una disolución de
 tetrahidrofurano (35 ml) de 5-bromo-2-metil-2-penteno (2,9 g). Después de elevar la temperatura hasta la
 15 temperatura ambiente, y de agitar adicionalmente durante 30 minutos, se añadió una disolución acuosa saturada de
 cloruro de amonio, y después la mezcla de reacción se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con
 disolución salina saturada, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro, se filtró y después se concentró a presión
 reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna en gel de sílice para obtener 2,0 g del
 compuesto diana.

A continuación se muestra la RMN ¹H del compuesto obtenido.20 RMN ¹H (CDCl₃) δ ppm:

1,61 (s, 3H), 1,71 (s, 3H), 1,87 (m, 2H), 2,10 (m, 2H), 2,79 (t, 2H), 5,15 (m, 1H), 7,35 (d, 2H), 7,61 (d, 2H), 8,63 (brs,
 1H)

25 (II) Síntesis de (4-cloro-fenil)-[6-isopropiliden-tetrahidro-tiopiran-2-iliden]-amina (compuesto representado por la
 Fórmula (d'))

30 En una disolución de tetrahidrofurano (40 ml) de (4-cloro-fenil)-amida del ácido 6-metil-5-heptenotioico (2,0 g), se
 añadió gota a gota una disolución de tetrahidrofurano (15 ml) de yodo (2,3 g) a 0°C. La temperatura se elevó hasta la
 temperatura ambiente, seguido de agitación toda la noche. Después de enfriar hasta 0°C, se añadió gota a gota una
 disolución de tetrahidrofurano (5 ml) de diazabicycloundeceno (2,9 g). Después de elevar la temperatura hasta la

temperatura ambiente y de agitar adicionalmente durante 1 hora, se añadió agua, y la mezcla de reacción se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con una disolución salina saturada, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro, se filtró y después se concentró a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna en gel de sílice para obtener 1,1 g del compuesto diana.

5

A continuación se muestra la RMN ^1H del compuesto obtenido.

RMN ^1H (CDCl_3) δ ppm:

10 1,70 (s, 3H), 1,74 (s, 3H), 1,95 (m, 2H), 2,62 (t, 2H), 2,72 (t, 2H), 6,81 (d, 2H), 7,27 (d, 2H)

(III) Síntesis de 2-(4-cloro-fenilamino)-6-isopropiliden-5,6-dihidro-4H-tiopiran-3-carbaldehído (compuesto representado por la Fórmula (e'))

15 En una disolución de tetrahidrofurano deshidratada (20 ml) de (4-cloro-fenil)-[6-isopropiliden-tetrahidro-tiopiran-2-iliden]-amina (1,1 g), se añadieron gota a gota 3,6 ml de diisopropilamido de litio (1,5 mol/l, disolución de tetrahidrofurano/ciclohexánica) a -78°C en una atmósfera de nitrógeno. Después de agitar a -78°C durante 30 minutos, se añadió gota a gota una disolución de tetrahidrofurano (2 ml) de formiato de etilo (0,39 g). Después de elevar la temperatura hasta la temperatura ambiente y de agitar adicionalmente durante 1 hora, se añadió una disolución acuosa saturada de cloruro de amonio, y la mezcla de reacción se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con una disolución salina saturada, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro, se filtró, y después se concentró a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna en gel de sílice para obtener 0,45 g del compuesto diana.

25 A continuación se muestra la RMN ^1H del compuesto obtenido.

RMN ^1H (CDCl_3) δ ppm:

30 1,76 (s, 3H), 1,78 (s, 3H), 2,50-2,60 (m, 4H), 7,22 (d, 2H), 7,31 (d, 2H), 8,89 (s, 1H), 12,93 (brs, 1H)

(IV) Síntesis de (4-cloro-fenil)-{6-isopropiliden-3-[1-fenilsulfanil-(E)-metiliden]-tetrahidro-tiopiran-(2Z)-iliden}-amina (Compuesto representado por la Fórmula (g'))

35 En una disolución de N,N-dimetilformamida (10 ml) de 2-(4-cloro-fenilamino)-6-isopropiliden-5,6-dihidro-4H-tiopiran-3-carbaldehído (0,44 g), se añadieron trietilamina (0,23 g) y cloruro de metanosulfonilo (0,24 g) a 0°C . Después de elevar la temperatura hasta la temperatura ambiente y de agitar adicionalmente durante 1 hora, se añadió agua, y la mezcla de reacción se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua y con una disolución salina saturada, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro, se filtró y después se concentró a presión reducida para obtener un producto bruto de

40 {3-[1-cloro-(E)-metiliden]-6-isopropiliden-tetrahidro-tiopiran-(2Z)-iliden}-(4-cloro-fenil)-amina.

45 En una disolución N de N,N-dimetilformamida (10 ml) de tiofenol (0,17 g), se añadió una disolución de N,N-dimetilformamida (5 ml) de trietilamina (0,23 g) y el producto bruto anterior a 0°C . Después de elevar la temperatura hasta la temperatura ambiente y de agitar adicionalmente durante 30 minutos, se añadió agua, y la mezcla de reacción se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua y con una disolución salina saturada, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro, se filtró y después se concentró a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna en gel de sílice para obtener 0,32 g del compuesto diana.

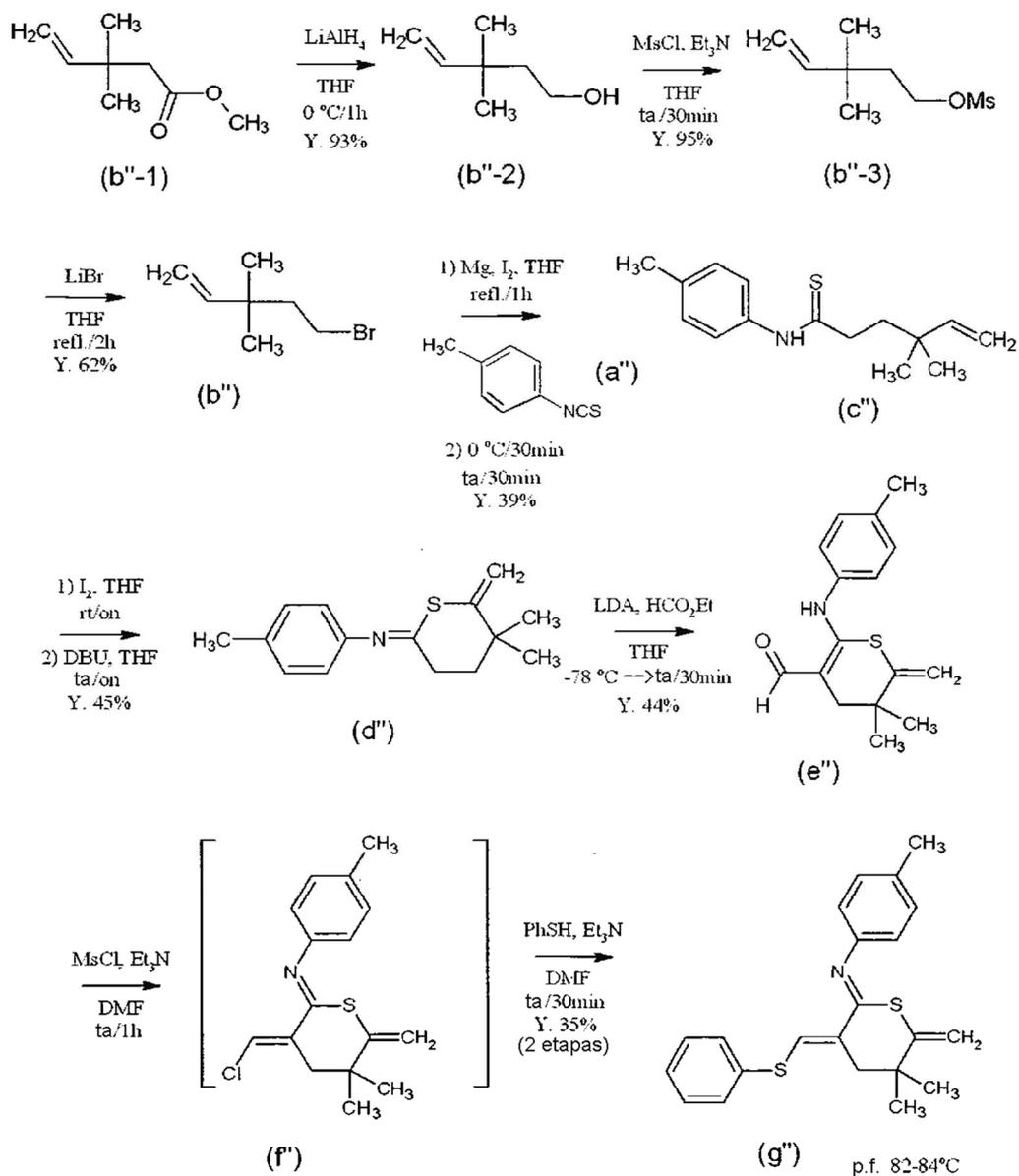
50 A continuación se muestran las propiedades físicas y la RMN ^1H del compuesto obtenido.

Punto de fusión: $101-103^\circ\text{C}$

RMN ^1H (CDCl_3) δ ppm:

55 1,69 (s, 3H), 1,77 (s, 3H), 2,58-2,71 (m, 4H), 6,80 (d, 2H), 7,19-7,31 (m, 5H), 7,47-7,50 (m, 3H)

[Fórmula Química 6]



5 **Ejemplo 2**

(I) Síntesis de 3,3-dimetil-4-penten-1-ol (compuesto representado por la Fórmula (b''-2))

10 Se añadió hidruro de litio y aluminio (1,3 g) a tetrahidrofurano (45 ml) a 0°C. A esta suspensión, se añadió gota a gota una disolución de tetrahidrofurano (20 ml) de 3,3-dimetil-4-pentenoato de metilo (5,0 g) a 0°C. Después de agitar a 0°C durante 1 hora, se añadió gota a gota una disolución acuosa saturada de sulfato de sodio. Después de elevar la temperatura hasta la temperatura ambiente, el precipitado se filtró, y después se secó sobre sulfato de magnesio anhidro. El precipitado se filtró, y después se concentró a presión reducida para obtener 3,6 g del compuesto diana.

15 A continuación se muestra la RMN ¹H del compuesto obtenido.

RMN ¹H (CDCl₃) δ ppm:

20 1,04 (s, 6H), 1,62 (t, 2H), 3,65 (t, 2H), 4,92-4,99 (m, 2H), 5,80-5,90 (m, 1H)

(II) Síntesis de éster 3,3-dimetil-4-pentenílico del ácido metanosulfónico (compuesto representado por la Fórmula

(b"-3))

5 En una disolución de tetrahidrofurano (30 ml) de 3,3-dimetil-4-penten-1-ol (3,6 g), se añadieron trietilamina (4,1 g) y cloruro de metanosulfonilo (4,3 g) a 0°C, seguido del aumento de la temperatura hasta la temperatura ambiente y de agitación adicional durante 30 minutos. Se le añadió agua, y la mezcla de reacción se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con disolución salina saturada, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro, se filtró, y después se concentró a presión reducida para obtener un producto bruto (5,7 g) de éster 3,3-dimetil-4-pentenílico del ácido metanosulfónico. Este producto bruto se sometió a una reacción subsiguiente sin purificarlo.

10 (III) Síntesis de 5-bromo-3,3-dimetil-1-penteno (compuesto representado por la Fórmula (b"))

15 En una disolución de tetrahidrofurano (120 ml) de un producto bruto (5,7 g) de éster 3,3-dimetil-4-pentenílico del ácido metanosulfónico, se añadió bromuro de litio (7,7 g) a temperatura ambiente. La temperatura se elevó, seguido de agitación a reflujo durante 2 horas. Después de enfriar hasta la temperatura ambiente, se añadió agua, y la mezcla de reacción se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con disolución salina saturada, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro, se filtró, y después se concentró a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna en gel de sílice para obtener 3,3 g del compuesto diana.

20 A continuación se muestra la RMN ¹H del compuesto obtenido.

RMN ¹H (CDCl₃) δ ppm:

1,06 (s, 6H), 1,92 (t, 2H), 3,30 (t, 2H), 4,91-5,00 (m, 2H), 5,69-5,79 (m, 1H)

25 (IV) Síntesis de p-tolilamida del ácido 4,4-dimetil-5-hexenotioico (compuesto representado por la Fórmula (c"))

30 Se añadieron magnesio (0,45 g) y una cantidad catalítica de yodo a tetrahidrofurano deshidratado (30 ml), y después se añadió gota a gota una disolución de tetrahidrofurano (30 ml) de 5-bromo-3,3-dimetil-1-penteno (3,3 g) a reflujo. Después de agitar a reflujo durante 1 hora, y enfriar adicionalmente hasta la temperatura ambiente, se obtuvo una disolución de tetrahidrofurano de bromuro de (3,3-dimetil-4-pentenil)magnesio.

35 En una disolución de tetrahidrofurano deshidratada (30 ml) de isotiocianato de p-tolilo (1,8 g), se añadió gota a gota una disolución de tetrahidrofurano del bromuro de (3,3-dimetil-4-pentenil)magnesio anterior a 0°C, seguido de agitación a 0°C durante 30 minutos. Después de elevar la temperatura hasta la temperatura ambiente y de agitar adicionalmente durante 30 minutos, se añadió una disolución acuosa saturada de cloruro de amonio, y la mezcla de reacción se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con disolución salina saturada, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro, se filtró y después se concentró a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna en gel de sílice para obtener 1,2 g del compuesto diana.

40 A continuación se muestra la RMN ¹H del compuesto obtenido.

RMN ¹H (CDCl₃) δ ppm:

45 1,07 (s, 6H), 1,89 (m, 2H), 2,35 (s, 3H), 2,70 (m, 2H), 4,95-5,03 (m, 2H), 5,76-5,85 (m, 1H), 7,20 (d, 2H), 7,48 (d, 2H), 8,53 (brs, 1H)

(V) Síntesis de [5,5-dimetil-6-metilen-tetrahidro-tiopiran-2-iliden]-p-tolil-amina (compuesto representado por la Fórmula (d"))

50 En una disolución de tetrahidrofurano (25 ml) de p-tolilamida del ácido 4,4-dimetil-5-hexenotioico (1,2 g), se añadió gota a gota una disolución de tetrahidrofurano (10 ml) de yodo (1,5 g) a 0°C, seguido del aumento de la temperatura hasta la temperatura ambiente y de agitación adicional toda la noche. Después de enfriar hasta 0°C, se añadió gota a gota una disolución de tetrahidrofurano (3 ml) de DBU (1,8 g). Después de elevar la temperatura hasta la temperatura ambiente y de agitar adicionalmente durante toda la noche, se añadió agua, y la mezcla de reacción se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con una disolución salina saturada, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro, se filtró y después se concentró a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna en gel de sílice para obtener 0,53 g del compuesto diana.

60 A continuación se muestra la RMN ¹H del compuesto obtenido.

RMN ¹H (CDCl₃) δ ppm:

65 1,29 (s, 6H), 1,80 (m, 2H), 2,34 (s, 3H), 2,80 (m, 2H), 5,12 (s, 1H), 5,16 (s, 1H), 6,76 (d, 2H), 7,13 (d, 2H)

(VI) Síntesis de 5,5-dimetil-6-metilen-2-p-tolilamino-5,6-dihidro-4H-tiopiran-3-carbaldehído (compuesto representado por la Fórmula (e"))

En una disolución de tetrahidrofurano deshidratada (15 ml) de [5,5-dimetil-6-metilen-tetrahidro-tiopiran-2-iliden]-p-tolil-amina (0,53 g), se añadieron gota a gota 2,2 ml de diisopropilamido de litio (1,5 mol/l, disolución de tetrahidrofurano/ciclohexánica) a -78°C en una atmósfera de nitrógeno. Después de agitar a -78°C durante 30 minutos, se añadió gota a gota una disolución de tetrahidrofurano (1 ml) de formiato de etilo (0,24 g). Después de elevar la temperatura hasta la temperatura ambiente y de agitar adicionalmente durante 1 hora, se añadió una disolución acuosa saturada de cloruro de amonio, y la mezcla de reacción se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con una disolución salina saturada, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro, se filtró y después se concentró a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna en gel de sílice para obtener 0,26 g del compuesto diana.

A continuación se muestra la RMN ¹H del compuesto obtenido.

RMN ¹H (CDCl₃) δ ppm:

1,23 (s, 6H), 2,34 (m, 5H), 5,04 (s, 1H), 5,15 (s, 1H), 7,12-7,21 (m, 4H), 8,83 (s, 1H), 12,87 (brs, 1H)

(VII) Síntesis de {5,5-dimetil-6-metilen-3-[1-fenilsulfanil-(E)-metiliden]-tetrahidro-tiopiran-(2Z)-iliden}-p-tolil-amina (compuesto representado por la Fórmula (g"))

En una disolución de N,N-dimetilformamida (5 ml) de 5,5-dimetil-6-metilen-2-p-tolilamino-5,6-dihidro-4H-tiopiran-3-carbaldehído (0,26 g), se añadieron trietilamina (0,14 g) y cloruro de metanosulfonilo (0,16 g) a 0°C. Después de elevar la temperatura hasta la temperatura ambiente y de agitar adicionalmente durante 1 hora, se le añadió agua, y la mezcla de reacción se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua y con una disolución salina saturada, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro, se filtró y después se concentró a presión reducida para obtener un producto bruto de

{3-[1-cloro-(E)-metiliden]-5,5-dimetil-6-metilen-tetrahidro-tiopiran-(2Z)-iliden}-p-tolil-amina.

En una disolución de N,N-dimetilformamida (5 ml) de tiofenol (0,11 g), se añadió una disolución de N,N-dimetilformamida (2 ml) de trietilamina (0,14 g) y el producto bruto anterior a 0°C. Después de elevar la temperatura hasta la temperatura ambiente y de agitar adicionalmente durante 30 minutos, se le añadió agua, y la mezcla de reacción se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con agua y con una disolución salina saturada, se secó sobre sulfato de magnesio anhidro, se filtró y después se concentró a presión reducida. El residuo se purificó mediante cromatografía en columna en gel de sílice para obtener 0,12 g del compuesto diana 0,12 g.

A continuación se muestran las propiedades físicas y la RMN ¹H del compuesto obtenido.

Punto de fusión: 82-84°C

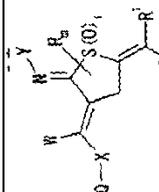
RMN ¹H (CDCl₃) δ ppm:

1,34 (s, 6H), 2,33 (s, 3H), 2,57 (s, 2H), 5,01 (s, 1H), 5,09 (s, 1H), 6,77 (d, 2H), 7,13 (d, 2H), 7,25-7,38 (m, 3H), 7,50 (d, 2H), 7,62 (s, 1H)

Los ejemplos del derivado de 1-heterodieno según la presente invención producidos de la misma manera como se menciona anteriormente se muestran en las Tablas 1 a 18. En las siguientes tablas, 2-(CH₂)₅-2 y 2-C₂H₄OC₂H₄-2 significan respectivamente que un anillo ciclohexánico y un anillo tetrahidropiránico están unidos a la posición 2 como un anillo espiro.

[Tabla 1]

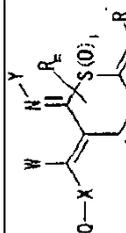
Número de compuesto	Q	X	W	Y	S(O)	R _m	R ¹	R ²	Otros	Propiedades físicas
1-1	Ph	S	H	4-Cl-Ph	S	-	H	H		p.f. 74-75°C
1-2	Ph	S	H	4-Cl-Ph	S	-	Me	Me		p.f. 69-71°C
1-3	Ph	S	H	4-Cl-Ph	S	-	Me	Me	Sal HBF ₄	
1-4	iPr	S	H	4-Me-Ph	S	Me	-(CH ₂) ₅ -	Me		p.f. 112-113°C
1-5	CF ₃	S	H	4-MeO-Ph	S	Et	H	H		-
1-6	MeOCH ₂	S	H	4-CF ₃ -Ph	S	CF ₃	H	H		
1-7	Bn	S	H	4-F-Ph	S	H ₂ C=CH	H	Me		
1-8	CH ₂ =CHCH ₂	S	H	4-NMe ₂ -Ph	S	HC≡C	H	Et		
1-9	MeC≡C	S	H	2-Br-Ph	S	cPr	H	iPr		
1-10	cPh	S	H	3-cPr-Ph	S	cHex	Me	Me		
1-11	4-Cl-cHex	S	H	4-Et-Ph	S	Ph	Et	Et		
1-12	Naftalen-1-ilo	S	H	3,5-F ₂ -Ph	S	4-Cl-Ph	H	cPr		
1-13	4-CF ₃ -Ph	S	H	cPr	S	Piridin-2-ilo	H	CF ₃		
1-14	6-Cl-Piridin-2-ilo	S	H	cPen	S	-	Me	Me		
1-15	Piridin-4-ilo	S	H	cHex	S	-	Me	Me		
1-16	2-Me-Furan-3-ilo	S	H	Furan-3-ilo	S	-	H	H		
1-17	Ph	S	H	Tiofen-2-ilo	S	Me	H	H		
1-18	Tiofen-2-ilo	S	H	Piridin-2-ilo	S	Et	H	H		
1-19	4-Me-Pirimidin-2-ilo	S	H	Ph	S	CF ₃	H	H		
1-20	Ph	O	H	4-Me-Ph	S	H ₂ C=CH	H	H	Sal HCl	
1-21	Ph	O	H	4-MeO-Ph	SO	HC≡C	H	H	Sal H ₂ SO ₄	
1-22	Ph	O	H	4-CF ₃ -Ph	SO	cPr	H	H	Sal HBr	
1-23	Ph	O	H	4-F-Ph	SO	cHex	H	H		
1-24	Ph	SO	H	4-NMe ₂ -Ph	SO	Ph	H	H		
1-25	Ph	SO	H	4-Me-Ph	SO	4-Cl-Ph	H	H		
1-26	Ph	SO	H	4-MeO-Ph	SO	Piridin-2-ilo	H	H		
1-27	Ph	SO ₂	H	4-CF ₃ -Ph	SO ₂	Me ₂	H	H		
1-28	Ph	SO ₂	H	4-F-Ph	SO ₂	-(CH ₂) ₅ -	H	H		
1-29	Ph	SO ₂	H	4-NMe ₂ -Ph	SO ₂	Me	H	H		
1-30	Ph	SO ₂	H	2,4-Me ₂ -Ph	SO ₂	Et	H	H		



Los Ejemplos 1-4, 1-13 hasta 1-18 son ejemplos de referencia.

[Tabla 2]

Número de compuesto	Q	X	W	Y	S(O) _i	R _m	R ¹	R ²	Otros	Propiedades físicas
2-1	Ph	S	H	4-Cl-Ph	S	-	H	H		2,72 (s, 4H), 4,96 (s, 1H), 5,08 (s, 1H), 6,78 (d, 2H), 7,27-7,39 (m, 5H), 7,49 (d, 2H) 7,60 (s, 1H)
2-2	Ph	S	H	4-Cl-Ph	S	-	Me	Me		p.f. 101-103°C
2-3	Ph	S	H	4-Cl-Ph	S	-	Et	H		0,91-0,99 (m, 3H), 1,95-2,12 (m, 2H), 2,66-2,71 (m, 4H) 5,42 (t, 1H), 6,75-7,57 (m, 9H)
2-4	Ph	S	H	4-Me-Ph	S	-	H	H		2,33 (s, 3H), 2,72 (s, 4H), 4,94 (s, 1H), 50,5 (s, 1H), 6,75 (d, 2H), 7,13 (d, 2H), 7,15-7,45 (m, 3H), 7,49 (d, 2H), 7,58 (s, 1H)
2-5	Ph	S	H	4-CF ₃ -Ph	S	-	H	H		2,73 (s, 4H) 4,96 (s, 1H), 5,09 (s, 1H), 6,92 (d, 2H), 7,25-7,34 (m, 3H), 7,50 (d, 2H) 7,57 (d, 2H) 7,65 (s, 1H)
2-6	4-F-Ph	S	H	4-Me-Ph	S	-	H	H		nD ²⁰ 1,6478
2-7	2-Piridin-ilo	S	H	4-Me-Ph	S	-	H	H		nD ²⁰ 1,6818
2-8	Ph	S	H	4-MeO-Ph	S	-	H	H		p.f. 101-103°C
2-9	4-F-Ph	S	H	4-MeO-Ph	S	-	H	H		p.f. 108-110°C
2-10	Ph	S	H	cPn	S	-	H	H		1,54-1,97 (m, 8H), 2,62-2,70 (m, 4H), 3,89 (m, 1H), 5,06 (s, 1H), 5,10 (s, 1H) 7,29-7,48 (m, 6H)
2-11	Ph	S	H	4-Me-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H		p.f. 82-84°C
2-12	Ph	S	H	4-Cl-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H		p.f. 107-109°C
2-13	4-F-Ph	S	H	4-Cl-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H		p.f. 110-112°C
2-14	Ph	S	H	4-Me-Ph	S	-	H	H	Sal HBF ₄	p.f. 140-142°C



[Tabla 3]

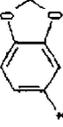
2-15	Ph	S	H	4-Me-Ph	S	2-Ph	H	H		2,33 (s, 3H), 3,00-3,16 (m, 2H), 3,98-4,03 (m, 1H), 4,79 (s, 1H), 5,11 (s, 1H), 6,75 (d, 2H), 7,14 (d, 2H), 7,25-7,44 (m, 10H), 7,59 (s, 1H)
2-16	Ph	S	H	4-MeO-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H		p.f. 71-73°C
2-17	Ph	S	H	4-Me-Ph	S	2-(CH ₂) ₅ -2	H	H		p.f. 117-119°C
2-18	4-MeO-Ph	S	H	4-Me-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H		p.f. 86-88°C
2-19	2-MeO-Ph	S	H	4-Me-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H		p.f. 86-88°C
2-20	3-MeO-Ph	S	H	4-Me-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H		1,34 (s, 6H), 2,33 (s, 3H), 2,56 (s, 2H), 3,81 (s, 3H), 5,00 (s, 1H), 5,09 (s, 1H), 6,75-6,85 (m, 3H), 7,01-7,28 (m, 5H), 7,62 (s, 1H)
2-21	4-AcNH-Ph	S	H	4-Me-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H		p.f. 1,46-1,48°C
2-22	4-F-Ph	S	H	4-MeO-Ph	S	-	Me	Me		1,70 (s, 3H), 1,77 (s, 3H), 2,63-2,74 (m, 4H), 3,80 (s, 3H), 6,81-6,91 (m, 4H), 7,06 (t, 2H), 7,33 (s, 1H), 7,47 (dt, 2H)
2-23	Ph	S	H	4-MeO-Ph	S	-	Me	Me		p.f. 147-150°C
2-24	4-F-Ph	S	H	4-Me-Ph	S	2-(CH ₂) ₅ -2	H	H		p.f. 121-122°C
2-25	Ph	S	H	3-MeO-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H		1,34 (s, 6H), 2,57 (s, 2H), 3,79 (s, 3H), 5,02 (s, 1H), 5,10 (s, 1H), 6,43-6,48 (m, 2H), 6,65 (dd, 1H), 7,20-7,37 (m, 5H), 7,49 (d, 2H), 7,63 (s, 1H)
2-26	Ph	S	H	2-Cl-4 Me-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H		1,34 (s, 6H), 2,34 (s, 3H), 2,56 (s, 2H), 5,03 (s, 1H), 5,11 (s, 1H), 6,68 (dd, 1H), 6,89 (d, 1H), 7,16 (d, 1H), 7,27-7,38 (m, 3H), 7,48 (d, 2H), 7,62 (s, 1H)
2-27	Ph	S	H	2-MeO-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H		1,35 (s, 6H), 2,57 (s, 2H), 3,80 (s, 3H), 4,98 (s, 1H), 5,09 (s, 1H), 6,78 (dd, 1H), 6,95 (m, 2H), 7,09 (dt, 1H), 7,26-7,36 (m, 3H), 7,49 (d, 2H), 7,69 (s, 1H)

[Tabla 4]

2-28	Ph	S	H	3,4-MeO ₂ -Ph	S	2,2-Me ₂	H	H	1,35 (s, 6H), 2,58 (s, 2H), 3,86 (s, 3H), 3,87 (s, 3H), 5,04 (s, 1H), 5,11 (s, 1H), 6,44-6,50 (m, 2H) 6,83 (d, 1H), 7,28-7,38 (m, 3H), 7,49 (d, 2H), 7,61 (s, 1H)
2-29	Ph	S	H	3-Cl-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H	1,34 (s, 6H), 2,57 (s, 2H), 5,03 (s, 1H), 5,12 (s, 1H), 6,74 (dd, 1H), 6,87 (s, 1H) 7,07 (dd, 1H), 7,24-7,38 (m, 4H), 7,48 (d, 2H), 7,65 (s, 1H)
2-30	Ph	S	H	2,4-M ₂ O ₂ -Ph	S	2,2-Me ₂	H	H	1,34 (s, 6H), 2,57 (s, 2H), 3,78 (s, 3H) 3,82 (s, 3H), 4,99 (s, 1H), 5,07 (s, 1H), 6,44-6,49 (m, 2H), 6,72 (d, 1H) 7,27-7,36 (m, 3H), 7,49 (d, 2H), 7,65 (s, 1H)
2-31	Ph	S	H	2,6-F ₂ -Ph	S	2,2-Me ₂	H	H	1,35 (s, 6H), 2,58 (s, 2H), 5,01 (s, 1H), 5,13 (s, 1H), 6,67-7,03 (m, 3H), 7,28-7,38 (m, 3H), 7,49 (d, 2H), 7,82 (s, 1H)
2-32	Ph	S	H	3,5-Cl ₂ -Ph	S	2,2-Me ₂	H	H	1,34 (s, 6H), 2,55 (s, 2H), 5,05 (s, 1H), 5,14 (s, 1H), 6,76 (s, 2H), 7,06 (s, 1H), 7,39 (m, 3H), 7,48 (d, 2H), 7,65 (s, 1H)
2-33	Ph	S	H	2-F-4 -MeO-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H	1,34 (s, 6H), 2,57 (s, 2H), 3,78 (s, 3H), 5,02 (s, 1H), 5,11 (s, 1H), 6,64-6,70 (m, 2H), 6,82 (t, 1H), 7,26-7,38 (m, 3H), 7,49 (d, 2H), 7,69 (s, 1H)
2-34	Ph	S	H	4-MeO-3-Me-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H	1,34 (s, 6H), 2,23 (s, 3H), 2,57 (s, 2H), 2,57 (s, 2H), 2,57 (s, 2H), 3,81 (s, 3H), 5,01 (s, 1H), 5,09 (s, 1H), 6,6-6,83 (m, 3H), 7,27-7,37 (m, 3H), 7,49 (d, 1H), 7,59 (s, 1H)
2-35	Ph	S	H	3,4-Cl ₂ -Ph	S	2,2-Me ₂	H	H	1,34 (s, 6H), 2,56 (s, H), 5,03 (s, 1H), 5,13 (s, 1H), 6,71 (dd, 1H), 6,98 (s, 1H), 7,27-7,38 (m, 4H), 7,49 (d, 2H), 7,65 (s, 1H)

El Ejemplo 2-39 es un ejemplo de referencia.

[Tabla 5]

2-36	Ph	S	H	3-CF ₃ -Ph	S	2,2-Me ₂	H	H	1,35 (s, 6H), 2,56 (s, 2H) 5,02 (s, 1H), 5,13 (s, 1H), 5,13 (s, 1H), 7,04 (d, 1H), 7,13 (s, 1H), 7,27-7,45 (m, 5H), 7,49 (d, 1H), 7,72 (s, 1H)
2-37	Ph	S	H	2,3-Cl ₂ -Ph	S	2,2-Me ₂	H	H	1,35 (s, 6H), 2,58 (s, 2H), 5,00 (s, 1H), 5,12 (s, 1H), 6,77 (dd, 1H), 7,11-7,39 (m, 5H), 7,49 (d, 2H), 7,80 (s, 1H)
2-38	Ph	S	H	3,5-MeO-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H	1,34 (s, 6H), 2,57 (s, 2H), 3,77 (s, 3H), 5,03 (s, 1H), 5,10 (s, 1H), 6,05 (s, 2H), 6,23 (s, 1H), 7,26-7,38 (m, 3H), 7,49 (d, 2H), 7,62 (s, 1H)
2-39	Ph	S	H		S	2,2-Me ₂	H	H	1,34 (s, 6H), 2,56 (s, 2H), 5,04 (s, 1H), 5,11 (s, 1H), 5,95 (s, 2H), 6,33 (d, 1H), 6,45 (s, 1H), 6,77 (d, 1H), 7,25-7,37 (m, 3H), 7,49 (d, 2H), 7,59 (s, 1H)
2-40	Ph	S	H	4-MeO-2-Me-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H	1,34 (s, 6H), 2,10 (s, 3H), 2,58 (s, 2H), 3,80 (s, 3H), 4,99 (s, 1H), 5,08 (s, 1H), 6,65-6,76 (m, 3H), 7,25-7,38 (m, 3H), 7,49 (d, 2H), 7,68 (s, 1H)
2-41	4-F-Ph	S	H	4-MeO-2-Me-Ph	s	2,2-Me ₂	H	H	1,34 (s, 6H), 2,09 (s, 3H), 2,55 (s, 2H), 3,80 (s, 3H), 4,99 (s, 1H), 5,08 (s, 1H), 6,65-6,76 (m, 3H), 7,05 (t, 2H), 7,46 (dd, 2H), 7,60 (s, 1H)
2-42	4-MeO-Ph	S	H	4-MeO-2 Me-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H	1,34 (s, 6H), 2,09 (s, 3H), 2,55 (s, 2H), 3,78 (s, 3H), 3,80 (s, 3H), 4,98 (s, 1H), 5,7 (s, 1H), 6,63-6,75 (m, 3H), 6,86 (d, 2H), 7,43 (d, 2H), 7,57 (s, 1H)
2-43	Pyrimidin-2-ilo	S	H	4-MeO-Ph	S	-	Me	Me	p.f. 129-131°C
2-44	Ph	S	H	2,5-Cl ₂ -Ph	S	2,2-Me ₂	H	H	1,35 (s, 6H), 2,57 (s, 2H), 5,02 (s, 1H), 5,13 (s, 1H), 6,87 (s, 1H), 7,00 (d, 1H), 7,51 (m, 6H), 7,78 (s, 1H)

[Tabla 6]

2-45	Ph	S	H	2,5-MeO ₂ -Ph	S	2,2-Me ₂	H	H	1,34 (s, 6H), 2,57 (s, 2H), 3,78 (s, 6H), 4,99 (s, 1H), 5,08 (s, 1H), 6,40 (d, 1H), 6,60 (dd, 1H), 6,83 (d, 1H), 7,25-7,36 (m, 3H), 7,48 (d, 2H), 7,69 (s, 1H)
2-46	4-F-Ph	S	H	4-MeO-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H	1,34 (s, 6H), 2,55 (s, 2H), 3,80 (s, 3H), 5,02 (s, 1H), 5,10 (s, 1H), 6,81-6,89 (m, 4H), 7,02 (t, 2H), 7,45-7,48 (m, 2H), 7,49 (s, 1H)
2-47	Pyrimidin-2-ilo	S	H	4-MeO-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H	1,33 (s, 6H), 2,59 (s, 2H), 3,82 (s, 3H), 5,01 (s, 1H), 5,08 (s, 1H), 6,91 (s, 4H), 7,06 (t, 1H), 8,43 (s, 1H), 8,59 (d, 2H)
2-48	4-F-Ph	S	H	4-Me-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H	p.f. 79-82°C
2-49	2-MeO-Ph	S	H	4-MeO-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H	p.f. 108-111°C
2-50	Pyridin-2-ilo	S	H	4-MeO-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H	p.f. 137-138°C
2-51	Tiofen-2-ilo	S	H	4-MeO-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H	p.f. 87-89°C
2-52	Ph	S	H	Tiofen-3-ilo	S	-	H	H	p.f. 75-77°C
2-53	Ph	S	H	Ph	S	2,2-Me ₂	H	H	p.f. 91-94°C
2-54	4-F-Ph	S	H	Ph	S	2,2-Me ₂	H	H	1,34 (s, 6H), 2,56 (s, 2H), 5,00 (s, 1H), 5,10 (s, 1H), 6,85 (d, 2H), 6,98-7,13 (m, 3H), 7,30 (t, 2H), 7,42-7,53 (m, 3H)
2-55	Ph	O	H	4-MeO-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H	1,32 (s, 6H), 2,63 (s, 2H), 3,80 (s, 3H), 5,03 (s, 1H), 5,09 (s, 1H), 6,87 (s, 4H), 7,09-7,14 (m, 3H), 7,36 (t, 2H), 7,72 (s, 1H)
2-56	Ph	S	H	4-Me-Ph	S	2-C ₂ H ₄ OC ₂ H ₄ -2	H	H	p.f. 134-136°C
2-57	4-F-Ph	S	H	4-Me-Ph	S	2-C ₂ H ₄ OC ₂ H ₄ -2	H	H	p.f. 124-126°C
2-58	cPn	S	H	4-MeO-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H	1,28 (s, 6H), 1,59-1,84 (m, 8H), 2,43 (s, 2H), 3,48 (m, 1H), 3,80 (s, 3H), 4,98 (s, 1H), 5,05 (s, 1H), 6,82-6,91 (m, 4H), 7,52 (s, 1H)

El Ejemplo 2-52 es un ejemplo de referencia.

[Tabla 7]

2-59	Ph	S	H	2-MeO/4 Me-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H	1,34 (s, 6H), 2,35 (s, 3H), 2,57 (s, 2H), 3,78 (s, 3H), 4,98 (s, 1H) 5,06 (s, 1H), 6,66-6,80 (m, 3H), 7,25-7,36 (m, 3H), 7,48 (d, 2H), 7,66 (s, 1H)
2-60	5-Me-1,3,4-Tiadiazol-2-ilo	S	H	4-MeO-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H	p.f. 112-114°C
2-61	Ph	S	H	4-iPrO-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H	1,31-1,34 (m, 12H), 2,57 (s, 2H), 4,50 (m, 1H), 5,02 (s, 1H), 5,10 (s, 1H), 6,80-6,88 (m, 4H), 7,26-7,37 (m, 3H), 7,48 (d, 2H), 7,60 (s, 1H)
2-62	Ph	S	H	2,6-Me ₂ -Ph	S	2,2-Me ₂	H	H	1,34 (s, 6H), 2,09 (s, 6H), 2,58 (s, 2H), 4,95 (s, 1H), 5,06 (s, 1H), 6,90-7,51 (m, 8H), 7,80 (s, 1H)
2-63	Ph	S	H	2,4,6-Me ₃ -Ph	S	2,2-Me ₂	H	H	1,33 (s, 6H), 2,05 (s, 6H), 2,26 (s, 3H), 2,58 (s, 2H), 4,96 (s, 1H), 5,06 (s, 1H), 6,84 (s, 2H), 7,27-7,38 (m, 3H), 7,47 (d, 2H), 7,77 (s, 1H)
2-64	Ph	S	H	2,4-Me ₂ -Ph	S	2,2-Me ₂	H	H	1,34 (s, 6H), 2,09 (s, 3H), 2,30 (s, 3H), 2,58 (s, 2H), 4,98 (s, 1H), 5,07 (s, 1H), 6,63 (d, 1H), 6,95-7,00 (m, 2H), 7,27-7,38 (m, 3H), 7,48 (m, 2H), 7,69 (s, 1H)
2-65	Ph	S	H	2,6-F ₂ -4-MeO-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H	p.f. 121-123°C
2-66	Tiofen-2-ilo	S	H	2,4,6-Me ₃ -Ph	S	2,2-Me ₂	H	H	1,34 (s, 6H), 2,02 (s, 6H), 2,25 (s, 3H), 2,54 (s, 2H), 4,94 (s, 1H), 5,05 (s, 1H), 6,83 (s, 2H) 7,01(fH), 7,23 (d, 1H), 7,40 (d, 1H), 7,55 (s, 1H)
2-67	Ph	S	H	4-MeO-2,6-Me ₂ -Ph	S	2,2-Me ₂	H	H	1,34 (s, 6H), 2,06 (s, 6H), 2,58 (s, 2H), 3,77 (s, 3H), 4,96 (s, 1H), 5,06 (s, 1H), 6,60 (s, 2H), 7,26-7,38 (m, 3H), 7,47 (d, 2H), 7,77 (s, 1H)

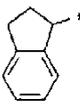
[Tabla 8]

2-68	Ph	S	H	4-Me-Ph	S	2-Et	H	H	0,97 (t, 3H), 1,58 (m, 1H), 1,71 (m, 1H), 2,32 (s, 3H), 2,65 (m, 1H), 2,73 (m, 2H), 4,98 (s, 1H), 5,06 (s, 1H), 6,76 (d, 2H) 7,15 (d, 2H), 7,28-7,37 (m, 3H), 7,49 (d, 2H), 7,62 (s, 1H)
2-69	4,5-Me ₂ -Tiazol-2-ilo	S	H	4-MeO-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H	1,26 (s, 6H), 2,32 (s, 6H), 2,59 (s, 2H), 4,99 (s, 1H), 5,07 (s, 1H), 6,87-7,00 (m, 4H), 7,26 (s, 1H)
2-70	4-CN-Ph	S	H	4-MeO-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H	1,33 (s, 6H), 2,60 (s, 2H), 3,81 (s, 3H), 5,05 (s, 1H), 5,12 (s, 1H), 6,84-6,92 (m, 4H), 7,50-7,63 (m, 5H)
2-71	Tiofen-2-ilo	S	H	4-Me-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H	p.f. 136-138°C
2-72	4-CN-Ph	S	H	4-Me-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H	1,33 (s, 6H), 2,35 (s, 3H), 2,60 (s, 2H), 5,04 (s, 1H), 5,11 (s, 1H), 6,80 (d, 2H), 7,16 (d, 2H), 7,52 (d, 2H), 7,59 (s, 1H), 7,61, (d, 2H)
2-73	Tiazol-2-ilo	S	H	4-Me-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H	p.f. 118-122°C
2-74	tBu	S	H	4-Me-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H	p.f. 116-117°C
2-75	Ph	S	H	4-Me-Ph	S	2-nPr	H	H	0,95 (t, 3H), 1,39 (q, 2H), 1,45-1,69 (m, 2H), 2,33 (s, 3H), 2,71 (m, 3H), 4,97 (s, 1H), 5,05 (s, 1H), 6,77 (d, 2H), 7,13 (d, 2H), 7,26-7,37 (m, 3H), 7,50 (d, 2H), 7,62 (s, 1H)
2-76	Ph	S	H	4-Me-Ph	S	2-Me	H	H	1,30 (d, 3H), 2,32 (s, 3H), 2,50 (m, 1H), 2,74-2,87 (m, 2H), 4,99 (s, 1H), 5,08 (s, 1H), 6,77 (d, 2H), 7,12 (d, 2H), 7,26-7,37 (m, 3H), 7,49 (d, 2H), 7,59 (s, 1H)
2-77	Tiofen-2-ilo	S	H	4-Me-Ph	S	2-Me	H	H	p.f. 65-68°C
2-78	Tiofen-3-ilo	S	H	4-Me-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H	p.f. 98-100°C
2-79	5-Me-Tiofen-2-ilo	S	H	4-Me-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H	p.f. 102-104°C
2-80	5-MeO-Tiofen-2-ilo	S	H	4-Me-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H	p.f. 94-96°C
2-81	Tiofen-3-ilo	S	H	4-MeO-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H	p.f. 84-86°C

[Tabla 9]

2-82	4-CHO-Ph	S	H	4-MeO-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H	1,34 (s, 6H), 2,62 (s, 2H), 3,81 (s, 3H), 5,06 (s, 1H), 5,12 (s, 1H), 6,89 (m, 4H), 7,58 (d, 2H), 7,66 (s, 1H), 7,84 (d, 2H), 9,97 (s, 1H)
2-83	5-Me-Tiofen-2-ilo	S	H	4-MeO-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H	p.f. 65-68°C
2-84	3-F-Ph	S	H	4-Me-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H	p.f. 80-82°C
2-85	2-F-Ph	S	H	4-Me-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H	p.f. 87-90°C
2-86	4-Me-Ph	S	H	4-Me-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H	p.f. 96-97°C
2-87	4-Cl-Ph	S	H	4-Me-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H	p.f. 96-97°C
2-88	Naftalen-2-ilo	S	H	4-Me-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H	p.f. 120-122°C
2-89	Naftalen-1-ilo	S	H	4-Me-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H	p.f. 124-126°C
2-90	4-CF ₃ -Ph	S	H	4-Me-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H	nD224 1,6159
2-91	6-Cl-Piridin-2-ilo	S	H	4-Me-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H	p.f. 102-104°C
2-92	Piridin-4-ilo	S	H	4-Me-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H	nD225 1,6594
2-93	2-Me-Furan-3-ilo	S	H	4-Me-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H	p.f. 69-71°C
2-94		S	H	4-Me-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H	p.f. 80-82°C
2-95	5-CF ₃ -Piridin-2-ilo	S	H	4-MeO-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H	1,33 (s, 6H), 259 (s, 2H), 3,83 (s, 3H) 5,06 (s, 1H), 5,12 (s, 1H) 6,93 (m, 4H), 7,43 (d, 1H), 7,78 (dd, 1H), 8,35 (s, 1H), 8,76 (s, 1H)
2-96	2-CH ₂ OH-Ph	S	H	4-Me-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H	1,36 (s, 6H), 2,33 (s, 3H), 3,22 (s, 2H), 4,82 (d, 2H), 5,02 (s, 1H), 5,10 (s, 1H), 6,76 (d, 2H), 7,13 (d, 2H), 7,34 (m, 2H), 7,46 (m, 2H), 7,56 (m, 1H)
2-97	4-NMe ₂ -Ph	S	H	4-Me-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H	p.f. 134-136°C
2-98	4-CF ₃ -Pirimidin-2-ilo	S	H	4-Me-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H	p.f. 105-108°C
2-99	3-CF ₃ -Ph	S	H	4-Me-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H	nD222 1,5980
2-100	2-CF ₃ -Ph	S	H	4-Me-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H	nD222 1,6016

[Tabla 10]

2-101	3-Br-Ph	S	H	4-Me-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H		1,33 (s, 6H), 2H), 5,03 (s, 1H), 5,10 (s, 1H), 6,91 (d, 2H), 7,14-7,24 (m, 3H), 7,40 (dd, 2H), 7,55 (s, 1H), 7,62 (s, 1H)
2-102	2-Br-Ph	S	H	4-Me-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H		1,34 (s, 6H), 2,34 (s, 3H), 2,63 (s, 2H) 5,03 (s, 1H), 5,10 (s, 1H), 6,79 (d, 2H), 7,10-7,20 (m, 4H), 7,33 (m, 1H), 7,49-7,60 (m, 2H)
2-103	5-SiMe ₃ -Tiofen-2-ilo	S	H	4-MeO-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H		p.f. 114-117°C
2-104	3-Me-Tiofen-2-ilo	S	H	4-Me-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H		p.f. 107-109°C
2-105	3-Ac-Ph	S	H	4-Me-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H		1,34 (s, 6H), 2,34 (s, 3H), 2,58 (s, 2H), 2,61 (s, 3H), 5,03 (s, 1H), 5,10 (s, 1H), 6,78 (d, 2H), 7,13 (d, 2H), 7,46 (m, 1H), 7,57 (s, 1H), 7,68 (d, 1H), 7,86 (d, 1H), 8,05 (d, 1H)
2-106	3-CN-Ph	S	H	4-Me-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H		p.f. 107-109°C
2-107	4-(3,5-F ₂ -Ph)-Pirimidin-2-ilo	S	H	4-MeO-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H		p.f. 133-135°C
2-103	4-(Piridin-2-ilo)-Pirimidin-2-ilo	S	H	4-MeO-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H		p.f. 160-162°C
2-109	3-PhO-Ph	S	H	4-MeO-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H		p.f. 96-98°C
2-110	3-Me-Ph	S	H	4-Me-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H		nD ₂₀ ²⁵ 1,6376
2-111	2-Me-Ph	S	H	4-Me-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H		p.f. 71-74°C
2-112	Bn	S	H	4-Me-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H		p.f. 111-112°C
2-113	Quinolin-2-ilo	S	H	4-Me-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H		p.f. 112-113°C
2-114	2,6-F ₂ -Ph	S	H	4-Me-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H		p.f. 103-105°C
2-115		S	H	4-Me-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H		1,29 (s, 6H), 2,28 (m, 1H), 2,34 (s, 3H), 2,45 (s, 2H), 2,66 (m, 1H), 2,89 (m, 1H), 3,12 (m, 1H), 4,72 (m, 1H), 4,98 (s, 1H), 5,05 (s, 1H), 6,79 (d, 2H) 7,15 (d, 2H), 7,19-7,25 (m, 3H), 7,39 (m, 1H), 7,61 (s, 1H)
2-115	3-MeO-Tiofen-2-ilo	S	H	4-Me-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H		p.f. 93-95°C
2-117	5-Br-Tiofen-2-ilo	S	H	4-MeO-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H		p.f. 103-105°C
2-118	Ph	S	H	4-MeO-Ph	S	1,2,2-Me ₃	H	H		p.f. 96-98°C
2-119	2,6-Me ₂ -Ph	S	H	4-Me-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H		p.f. 122-124°C

[Tabla 11]

2-120	6-CF ₃ -Piridin-2-ilo	S	H	4-Me-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H	1,33 (s, 6H), 2,59 (s, 2H), 5,04 (s, 1H), 5,10 (s, 1H), 6,84 (d, 2H), 7,17 (d, 2H), 7,50 (m, 1H), 7,80 (m, 2H), 8,23 (s, 1H)
2-121	4-Me-Pirimidin-2-ilo	S	H	4-Me-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H	p.f. 128-131°C
2-122	HC≡CCH ₂	S	H	4-Me-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H	1,29 (s, 6H), 2,30 (s, 1H), 232 (s, 3H), 2,45 (s, 2H), 3,57 (s, 2H), 4,99 (s, 1H), 5,06 (s, 1H), 6,78 (d, 2H), 7,15 (d, 2H), 7,51 (s, 1H)
2-123	2,5-Me ₂ -Furan-3-ilo	S	H	4-Me-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H	1,33 (s, 6H), 2,23 (s, 3H), 2,29 (s, 3H) 2,34 (s, 3H), 2,53 (s, 2H), 5,00 (s, 1H), 5,08 (s, 1H), 6,01 (s, 1H), 6,76 (d, 2H), 6,91 (d, 2H), 7,29 (s, 1H)
2-124	2,4-F ₂ -Ph	S	H	4-Me-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H	p.f. 82-84°C
2-125	4-tBu-Ph	S	H	4-Me-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H	p.f. 107-108°C
2-126	4-CF ₃ -Piridin-2-ilo	S	H	4-Me-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H	p.f. 106-108°C
2-127	4-Me-Pirimidin-2-ilo	S	H	4-MeO-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H	p.f. 122-124°C
2-128	4-Me-Pirimidin-2-ilo	S	H	Ph	S	2,2-Me ₂	H	H	p.f. 113-115°C
2-129	Tiofen-2-ilo	S	H	Ph	S	2,2-Me ₂	H	H	p.f. 98-100°C
2-130	Ph	S	H	4-MeO-Ph	S	2-Me-2-Me ₂ C=CHC ₂ H ₄	H	H	1,31 (s, 3H), 1,48-1,77 (m, 8H), 2,00 (m, 2H), 2,46 (d, 1H), 2,70 (d, 1H), 3,80 (s, 3H), 5,09 (m, 3H), 6,85 (m, 4H), 6,85 (m, 4H), 7,28-7,37 (m, 3H), 7,48 (d, 2H), 7,63 (s, 1H)
2-131	3,6-Me ₂ -Pirazin-2-ilo	S	H	Ph	S	2,2-Me ₂	H	H	p.f. 115-117°C
2-132	4-Me-Pirimidin-2-ilo	S	H	3,4-Me ₂ -Ph	S	2,2-Me ₂	H	H	p.f. 151-153°C
2-133	4-MeO-Pirimidin-2-ilo	S	H	4-Me-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H	1,33 (s, 6H), 2,35 (s, 3H), 2,65 (s, 2H) 4,00 (s, 3H), 5,02 (s, 1H), 5,09 (s, 1H), 6,48 (d, 1H), 7,15 (d, 1H), 8,28 (d, 1H), 8,50 (s, 1H)
2-134	4-Cl-Pirimidin-2-ilo	S	H	4-Me-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H	
2-135	4,6-Me ₂ -Pirimidin-2-ilo	S	H	4-Me-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H	p.f. 159-161°C
2-136	5-CF ₃ -Pirimidin-2-ilo	S	H	4-Me-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H	
2-137	1-Me-Tetrazol-5-ilo	S	H	4-Me-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H	p.f. 97-99°C
2-138	2-Me-Pirimidin-4-ilo	S	H	4-Me-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H	
2-139	2-CF ₃ -Pirimidin-5-ilo	S	H	4-Me-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H	

[Tabla 12]

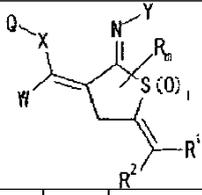
2-140	2-Me-Tiofen-3-ilo	S	H	4-Me-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H		p.f. 83-85°C
2-141	4-Me-Tiofen-3-ilo	S	H	4-Me-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H		
2-142	4-Br-Tiofen-3-ilo	S	H	4-Me-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H		
2-143	4-Br-Tiofen-2-ilo	S	H	4-Me-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H		
2-144	Furan-2-ilo	S	H	4-Me-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H		
2-145	5-Me-Furan-2-ilo	S	H	4-Me-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H		
2-146	4-MeO-Furan-2-ilo	S	H	4-Me-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H		
2-147	Quinolin-8-ilo	S	H	4-Me-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H		
2-148	Ph	S	H	3,4-Me ₂ -Ph	S	2,2-Me ₂	H	H		p.f. 86-88°C
2-149	Tiofen-2-ilo	S	H	3,4-Me ₂ -Ph	S	2,2-Me ₂	H	H		p.f. 122-125°C
2-150	4-F-Ph	S	H	3,4-Me ₂ -Ph	S	2,2-Me ₂	H	H		p.f. 103-105°C
2-151	4-iPr-Ph	S	H	4-Me-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H		p.f. 79-81°C
2-152	Ph	S	H	4-Me-Ph	S	1,2,2-Me ₃	H	H		
2-153	Tiofen-2-ilo	S	H	4-Me-Ph	S	1,2,2-Me ₃	H	H		
2-154	4-Me-Pirimidin-2-ilo	S	H	4-Me-Ph	S	1,2,2-Me ₃	H	H		
2-155	Ph	S	H	4-Me-Ph	S	1,1-Me ₂	H	H		
2-156	Ph	S	H	4-Me-Ph	S	1,1,2,2-Me ₄	H	H		
2-157	Ph	S	H	4-Me-Ph	S	1-Et-2,2-Me ₂	H	H		
2-158	H ₂ C=CH	SO	H	Piridin-2-ilo	SO	2-cPr	Me	Me		
2-159	HC≡CCH ₂	SO ₂	H	Tiofen-3-ilo	SO ₂	1-Ph	H	cHex		
2-160	4-Me-Ph	O	H	Naftalen-2-ilo	SO ₂	1,2-Me ₂	H	H		

Los Ejemplos 2-158 hasta 2-160 son ejemplos de referencia.

5

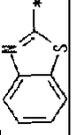
[Tabla 13]

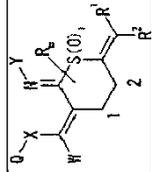
Número de compuesto	Q	X	W	Y	S(O) _i	R _m	R ¹	R ²
3-1	Ph	S	H	4-Cl-Ph	S	-	H	H
3-2	Ph	S	H	4-Cl-Ph	S	-	Me	Me
3-3	Ph	S	H	4-Cl-Ph	S	-	Me	Me
3-4	iPr	S	H	4-Me-Ph	S	Me	-(CH ₂) ₅ -	
3-5	CF ₃	S	H	4-MeO-Ph	S	Et	H	H
3-6	MeOCH ₂	S	H	4-CF ₃ -Ph	S	CF ₃	H	H
3-7	Bn	S	H	4-F-Ph	S	H ₂ C=CH	H	Me
3-8	CH ₂ =CHCH ₂	S	H	4-NMe ₂ -Ph	S	HC≡C	H	Et
3-9	MeC≡C	S	H	2-Br-Ph	S	cPr	H	iPr
3-10	cPn	S	H	3-cPr-Ph	S	cHex	Me	Me
3-11	4-Cl-cHex	S	H	4-Et-Ph	S	Ph	Et	Et
3-12	Naftalen-1-ilo	S	H	3,5-F ₂ -Ph	S	4-Cl-Ph	H	cPr
3-13	4-CF ₃ -Ph	S	H	cPr	S	Piridin-2-ilo	H	CF ₃
3-14	6-Cl-Piridin-2-ilo	S	H	cPen	S	-	Me	Me
3-15	Piridin-4-ilo	S	H	cHex	S	-	Me	Me
3-16	2-Me-Furan-3-ilo	S	H	Furan-3-ilo	S	-	H	H
3-17	Ph	S	H	Tiofen-2-ilo	S	Me	H	H

								
Número de compuesto	Q	X	W	Y	S(O) _l	R _m	R ¹	R ²
3-18	Tiofen-2-ilo	S	H	Piridin-2-ilo	S	Et	H	H
3-19	4-Me-Pirimidin-2-ilo	S	H	Ph	S	CF ₃	H	H
3-20	Ph	O	H	4-Me-Ph	S	H ₂ C=CH	H	H
3-21	Ph	O	H	4-MeO-Ph	SO	HC≡C	H	H
3-22	Ph	O	H	4-CF ₃ -Ph	SO	cPr	H	H
3-23	Ph	O	H	4-F-Ph	SO	cHex	H	H
3-24	Ph	SO	H	4-NMe ₂ -Ph	SO	Ph	H	H
3-25	Ph	SO	H	4-Me-Ph	SO	4-Cl-Ph	H	H
3-26	Ph	SO	H	4-MeO-Ph	SO	Piridin-2-ilo	H	H
3-27	Ph	SO ₂	H	4-CF ₃ -Ph	SO ₂	Me ₂	H	H
3-28	Ph	SO ₂	H	4-F-Ph	SO ₂	-(CH ₂) ₅ -	H	H
3-29	Ph	SO ₂	H	4-NMe ₂ -Ph	SO ₂	Me	H	H
3-30	Ph	SO ₂	H	2,4-Me ₂ -Ph	SO ₂	Et	H	H

Los Ejemplos 3-4, 3-13 hasta 3-18 son ejemplos de referencia.

[Tabla 14]

Número de compuesto	Q	X	W	Y	S(O) _i	R _m	R ¹	R ²	Propiedades físicas
4-1	4-Fluorpiridin-2-ilo	S	H	4-Me-Ph	S	-	H	H	p.f. 123-124°C
4-2	4-Metoxipiridin-2-ilo	S	H	4-MeO-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H	p.f. 94-95°C
4-3	2-Metiltiazol-2-ilo	S	H	4-Me-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H	p.f. 93-96°C
4-4	2-Metiltiofen-2-ilo	S	H	4-MeO-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H	126 (s, 6H), 2,47 (s, 2H), 3,82 (s, 3H), 5,00 (s, 1H), 5,07 (s, 1H), 6,58 (s, 1H), 6,90-7,03 (m, 4H), 7,18 (d, 1H), 7,37 (m, 2H)
4-5	2-Metiltiofen-2-ilo	S	H	4-MeO-Ph	SO	2,2-Me ₂	H	H	1,29 (s, 3H), 1,35 (s, 3H), 2,35 (d, 1H), 2,68 (d, 1H), 3,82 (s, 3H), 5,10 (s, 1H), 5,18 (s, 1H), 6,46 (s, 1H), 6,90-6,97 (m, 4H), 7,05 (dd, 1H), 7,47 (d, 1H), 7,56 (d, 1H)
4-6		S	H	4-Me-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H	p.f. 142-144°C
4-7	4-(Trifluorometil)piridin-2-ilo	S	H	4-Me-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H	1,28 (s, 6H), 2,37 (s, 3H), 2,67 (s, 2H), 4,99 (s, 1H), 5,07 (s, 1H), 6,90 (d, 2H), 7,20 (d, 2H), 7,27 (d, 1H), 7,49 (s, 1H), 7,89 (s, 1H), 8,68 (d, 1H)
4-8	Phenil	S	H	3,4-Dimetilfenil	S	2,2-Me ₂	H	H	
4-9	Tiofen-2-ilo	S	H	3,4-Dimetilfenil	S	2,2-Me ₂	H	H	
4-10	4-Fluorfenil	S	H	3,4-Dimetilfenil	S	2,2-Me ₂	H	H	



[Tabla 15]

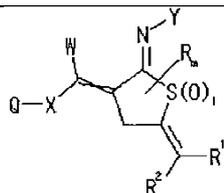
4-11	4-iPr-Ph	S	H	4-Me-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H
4-12	Ph	S	H	4-Me-Ph	S	1,2,2-Me ₃	H	H
4-13	Tiofen-2-ilo	S	H	4-Me-Ph	S	1,2,2-Me ₃	H	H
4-14	4-Me-Pirimidin-2-ilo	S	H	4-Me-Ph	S	1,2,2-Me ₃	H	H
4-15	Ph	S	H	4-Me-Ph	S	1,1-Me ₂	H	H
4-16	Ph	S	H	4-Me-Ph	S	1,1,2,2-Me ₄	H	H
4-17	Ph	S	H	4-Me-Ph	S	1-Et-2,2-Me ₂	H	H
4-18	H ₂ C=CH	SO	H	Piridin-2-ilo	SO	2-cPr	Me	Me
4-19	HC≡CCH ₂	SO ₂	H	Tiofen-3-ilo	SO ₂	1-Ph	H	cHex
4-20	4-Me-Ph	O	H	Naftalen-2-ilo	SO ₂	1,2-Me ₂	H	H
4-21	4-Cl-cHex	S	H	4-Et-Ph	S	1-Ph	Et	Et
4-22	Naftalen-1-ilo	S	H	3,5-F ₂ -Ph	S	1,2-Ph ₂	H	cPr
4-23	4-CF ₃ -Ph	S	H	cPr	S	1,1,2,2-Me ₄	H	CF ₃
4-24	6-Cl-Piridin-2-ilo	S	H	cPen	S	-	Me	Me
4-25	Piridin-4-ilo	S	H	cHex	S	-	Me	Me
4-26	2-Me-Furan-3-ilo	S	H	Furan-3-ilo	S	-	H	H
4-27	Ph	S	H	Tiofen-2-ilo	S	1-Me	H	H
4-28	Tiofen-2-ilo	S	H	Piridin-2-ilo	S	2-Et	H	H
4-29	4-Me-Pirimidin-2-ilo	S	H	Ph	S	2-CF ₃	H	H
4-30	Ph	S	H	4-MeO-Ph	S	-	Me	Et

Los Ejemplos 4-18 hasta 4-20, 4-23 hasta 4-28 son ejemplos de referencia.

5

[Tabla 16]

Número de compuesto	Q	X	W	Y	S(O) _l	R _m	R ¹	R ²
5-1	Ph	S	H	4-Cl-Ph	S	-	H	H
5-2	Ph	S	H	4-Cl-Ph	S	-	Me	Me
5-3	Ph	S	H	4-Cl-Ph	S	-	Me	Me
5-4	iPr	S	H	4-Me-Ph	S	Me	-(CH ₂) ₅ -	
5-5	CF ₃	S	H	4-MeO-Ph	S	Et	H	H
5-6	MeOCH ₂	S	H	4-CF ₃ -Ph	S	CF ₃	H	H
5-7	Bn	S	H	4-F-Ph	S	H ₂ C=CH	H	Me
5-8	CH ₂ =CHCH ₂	S	H	4-NMe ₂ -Ph	S	HC≡C	H	Et
5-9	MeC≡C	S	H	2-Br-Ph	S	cPr	H	iPr
5-10	cPn	S	H	3-cPr-Ph	S	cHex	Me	Me
5-11	4-Cl-cHex	S	H	4-Et-Ph	S	Ph	Et	Et
5-12	Naftalen-1-ilo	S	H	3,5-F ₂ -Ph	S	4-Cl-Ph	H	cPr
5-13	4-CF ₃ -Ph	S	H	cPr	S	Piridin-2-ilo	H	CF ₃
5-14	6-Cl-Piridin-2-ilo	S	H	cPen	S	-	Me	Me
5-15	Piridin-4-ilo	S	H	cHex	S	-	Me	Me
5-16	2-Me-Furan-3-ilo	S	H	Furan-3-ilo	S	-	H	H
5-17	Ph	S	H	Tiofen-2-ilo	S	Me	H	H
5-18	Tiofen-2-ilo	S	H	Piridin-2-ilo	S	Et	H	H
5-19	4-Me-Pirimidin-2-ilo	S	H	Ph	S	CF ₃	H	H
5-20	Ph	O	H	4-Me-Ph	S	H ₂ C=CH	H	H
5-21	Ph	O	H	4-MeO-Ph	SO	HC≡C	H	H
5-22	Ph	O	H	4-CF ₃ -Ph	SO	cPr	H	H
5-23	Ph	O	H	4-F-Ph	SO	cHex	H	H
5-24	Ph	SO	H	4-NMe ₂ -Ph	SO	Ph	H	H
5-25	Ph	SO	H	4-Me-Ph	SO	4-Cl-Ph	H	H
5-26	Ph	SO	H	4-MeO-Ph	SO	Piridin-2-ilo	H	H



Número de compuesto	Q	X	W	Y	S(O) _l	R _m	R ¹	R ²
5-27	Ph	SO ₂	H	4-CF ₃ -Ph	SO ₂	Me ₂	H	H
5-28	Ph	SO ₂	H	4-F-Ph	SO ₂	-(CH ₂) ₅ -	H	H
5-29	Ph	SO ₂	H	4-NMe ₂ -Ph	SO ₂	Me	H	H
5-30	Ph	SO ₂	H	2,4-Me ₂ -Ph	SO ₂	Et	H	H

Los Ejemplos 5-4, 5-13 hasta 5-18 son ejemplos de referencia.

[Tabla 17]

Número de compuesto	Q	X	W	Y	S(O)	R _m	R ¹	R ²	Propiedades físicas
6-1	Ph	S	H	4-Me-Ph	S	-	Me	Me	nD ^{22,7} 1,6565
6-2	4-F-Ph	S	H	4-Me-Ph	S	-	Me	Me	1,67-1,77 (m, 6H), 2,33 (d, 3H), 2,67-2,71 (m, 4H), 6,60-7,50 (m, 9H)
6-3	4-MeON=CH-Ph	S	H	4-MeO-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H	1,31 (s, 3H), 1,34 (s, 3H), 2,54 (s, 1H), 2,58 (s, 1H) 3,80 (s, 1,5H), 3,82 (s, 5H), 3,87 (s, 1,5H), 3,88(1,5H), 5,02 (s, 0,5H), 5,04 (s, 0,5H), 5,08 (s, 0,5H), 5,10 (s, 0,5H), 6,69 (s, 0,5H), 6,81-6,99 (m, 4H), 7,35 (m, 1H), 7,47-7,51 (m, 2H),
6-4	4-NO ₂ -Ph	S	H	4-Me-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H	1,22 (s, 1,8H), 1,34 (s, 4,2H), 2,36 (s, 4,4H), 2,62 (s, 0,6H), 4,93 (s, 0,3H), 5,01 (s, 0,3H), 5,05 (s, 0,7H), 5,12 (s, 0,7H), 6,80-8,21 (m, 9H)
6-5	cHex	S	H	4-Me-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H	nD ^{22,4} 1,6183
6-6	Piridin-3-ilo	S	H	4-Me-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H	p.f. 81-90°C
6-7	2,4-F ₂ -Ph	S	H	4-Me-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H	1,29 (s, 3H), 1,33 (s, 3H), 2,34 (s, 1,5H), 2,36 (s, 1,5H), 2,54 (s, 1H) 2,57 (s, 1H), 5,01 (s, 0,5H), 5,03 (s, 0,5H), 5,08 (s, 0,5H), 5,10 (s, 0,5H), 6,61 (s, 0,5H), 6,72 (m, 1H), 6,79 (d, 1H), 6,90 (d, 1 H), 7,00 (m, 2H), 7,17 (m, 1H), 7,54 (s, 0,5H)

Los Ejemplos 6-16 hasta 6-19, 6-22 hasta 6-24, y 6-26 hasta 6-29 son ejemplos de referencia.

[Tabla 18]

6-8	Benzotiofen-2-ilo	S	H	4-Me-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H	1,26 (s, 4H), 1,32 (s, 2H), 2,32 (s, 1H), 2,36 (s, 2H), 2,50 (s, 1,33H), 2,57 (s, 0,67H), 5,00 (s, 0,67H), 5,02 (s, 0,33H), 5,07 (s, 0,67H), 5,10 (s, 0,33H), 6,75 (m, 1,33H), 6,93 (d, 1,33H), 7,11-7,45 (m, 6,34H), 7,56 (s, 0,33H), 7,70-7,78 (m, 2H)
6-9	3,6-Me ₂ -Pirazin-2-ilo	S	H	4-Me-Ph	S	2,2-Me ₂	H	H	1,29 (s, 3H), 1,34 (s, 3H), 2,37 (m, 3H), 2,52 (m, 6H), 2,62 (s, 1H), 2,68 (s, 1H), 5,00 (s, 0,5H), 5,03 (s, 0,5H), 5,07 (s, 0,5H), 5,10 (s, 0,5H), 6,85 (d, 1H), 6,90 (d, 1H), 7,19 (m, 2H), 7,88 (s, 0,5H), 8,08 (s, 1H), 8,47 (s, 0,5H)
6-10	Me	SO	H	4-F-Ph	SO	2,2-Me ₂	H	H	
6-11	CF ₃	SO	H	3,5-Me ₂ -Ph	SO	2,2-Me ₂	H	H	
6-12	Bn	SO	H	4-MeO-Ph	SO	1,2,2-Me ₃	H	H	
6-13	cPr	SO	H	2-F-Ph	SO	1,2,2-Me ₃	H	H	
6-14	cHex	SO	H	2-Br-Ph	SO	1,2,2-Me ₃	H	H	
6-15	Ph	SO	H	4-Me-Ph	SO	1,1-Me ₂	H	H	
6-16	Ph	SO ₂	H	cPr	SO ₂	1,1,2,2-Me ₄	H	H	
6-17	Ph	SO ₂	H	cBu	SO ₂	1-Et-2,2-Me ₂	H	H	
6-18	Ph	SO ₂	H	cPen	SO ₂	2-cPr	H	H	
6-19	Ph	SO ₂	H	cHex	SO ₂	1-Ph	H	H	
6-20	Ph	SO ₂	H	Ph	SO ₂	1,2-Me ₂	Me	Me	
6-21	Ph	SO ₂	H	Ph	SO ₂	2,2-Me ₂	H	cHex	
6-22	Ph	SO ₂	H	Pindin-2-ilo	SO ₂	1,2,2-Me ₃	H	H	
6-23	Ph	SO ₂	H	Pirazin-2-ilo	SO ₂	1,2,2-Me ₃	H	H	
6-24	Ph	SO ₂	H	Furan-2-ilo	SO ₂	1,2,2-Me ₃	H	H	
6-25	Ph	SO ₂	H	4-NO ₂ -Ph	SO ₂	1,1-Me ₂	Me	Me	
6-26	Ph	O	H	cPr	SO ₂	1,1,2,2-Me ₄	H	cHex	
6-27	Ph	O	H	cBu	SO ₂	1-Et-2,2-Me ₂	H	H	
6-28	Ph	O	H	cPen	SO ₂	2-cPr	H	H	
6-29	Ph	O	H	cHex	SO ₂	1-Ph	H	H	
6-30	Ph	O	H	Ph	SO ₂	1,2-Me ₂	H	H	

Ejemplos de Formulación

5 Los ejemplos de las composiciones de la presente invención se mostrarán a continuación, y los aditivos y proporciones de adición son intercambiables a lo largo de un amplio intervalo sin estar limitados a estos Ejemplos. Las partes en los Ejemplos de Formulación muestran partes en peso.

Ejemplo 1 de Formulación: Polvo humectable

Compuesto de la presente invención	40 partes
Tierra de diatomeas	53 partes
Éster de sulfato de alcohol superior	4 partes
Sal de alquilnaftalenosulfonato	3 partes

10 Los componentes anteriores se mezclaron homogéneamente y se molieron finamente para obtener un polvo humectable con 40% del principio activo.

Ejemplo 2 de Formulación: Concentrado emulsionable

Compuesto de la presente invención	30 partes
Xileno	33 partes
Dimetilformamida	30 partes
Polioxietilen alquil alil éter	7 partes

15 Los componentes anteriores se mezclaron y disolvieron para obtener un concentrado emulsionable con 30% de principio activo.

Ejemplo 3 de Formulación: Polvo fino

Compuesto de la presente invención	10 partes
Talco	89 partes
Polioxietilen alquil alil éter	1 parte

20 Los componentes anteriores se mezclaron homogéneamente y se molieron finamente para obtener un polvo fino con 10% de principio activo.

Ejemplo 4 de Formulación: Gránulos

Compuesto de la presente invención	5 partes
Arcilla	73 partes
Bentonita	20 partes
Sal sódica de dioctilsulfosuccinato	1 parte
Fosfato de sodio	1 parte

25 Los componentes anteriores se mezclan y muelen bien, y, tras añadirles agua y amasarlos, se granulan y se secan para obtener gránulos con 5% de principio activo.

Ejemplo 5 de Formulación: Suspensión

Compuesto de la presente invención	10 partes
Ligninosulfonato de sodio	4 partes
Dodecibencenosulfonato de sodio	1 parte
Goma de xantana	0,2 partes
Agua	84,8 partes

35 Los componentes anteriores se mezclaron y se sometieron a molienda en húmedo hasta que se logró el tamaño de granos de 1 µm o menos, para obtener un agente de suspensión con 10% de principio activo.

Los Ejemplos de Ensayo del agente de control de plagas así obtenido según la presente invención se muestran a continuación. En los Ejemplos de Ensayo respectivos, el porcentaje insecticida (%) se determinó mediante la siguiente ecuación de cálculo.

40 $\text{Porcentaje insecticida (\%)} = (\text{número de plagas muertas} / \text{número de plagas liberadas}) \times 100$

Ejemplo 1 de Ensayo: Ensayos de confirmación y eficacia frente a oruga del corte del arroz (Mythimna Separata)

5 El concentrado emulsionable obtenido según la Formulación del Ejemplo 2 de Formulación se diluyó con agua para controlar la concentración del compuesto a 125 ppm. Se sumergieron hojas de maíz en esta disolución diluida durante 30 segundos, y después se secaron al aire. Las hojas se colocaron en una cápsula de Petri sobre la que se coloca un papel de filtro, y después se inocularon cinco larvas de la oruga del corte del arroz de segunda fase. Tras cubrir la cápsula de Petri con una tapa de vidrio, la cápsula de Petri se colocó en una habitación de temperatura controlada a una temperatura de 25°C y a una humedad del 65%. Después de 5 días, se examinó la vida y la muerte, y se determinó el porcentaje insecticida. El ensayo se repitió dos veces.

En el presente ensayo, los siguientes compuestos mostraron el porcentaje insecticida de 100%.

15 Compuestos números 1-2, 1-3, 2-1, 2-2, 2-3, 2-4, 2-5, 2-6, 2-7, 2-8, 2-9, 2-11, 2-12, 2-13, 2-14, 2-15, 2-16, 2-17, 2-18, 2-19, 2-20, 2-21, 2-22, 2-24, 2-25, 2-26, 2-27, 2-29, 2-30, 2-31, 2-33, 2-34, 2-35, 2-36, 2-37, 2-39, 2-40, 2-41, 2-42, 2-43, 2-44, 2-46, 2-47, 2-48, 2-49, 2-50, 2-51, 2-52, 2-53, 2-54, 2-55, 2-56, 2-57, 2-58, 2-59, 2-62, 2-63, 2-64, 2-65, 2-66, 2-67, 2-68, 2-70, 2-71, 2-72, 2-73, 2-74, 2-75, 2-76, 2-77, 2-78, 2-79, 2-80, 2-81, 2-82, 2-83, 2-84, 2-85, 2-86, 2-87, 2-88, 2-89, 2-90, 2-91, 2-92, 2-93, 2-94, 2-95, 2-96, 2-97, 2-98, 2-99, 2-100, 2-101, 2-102, 2-103, 2-104, 2-105, 2-106, 2-110, 2-111, 2-112, 2-113, 2-114, 2-115, 2-116, 2-117, 2-118, 2-119, 2-121, 2-122, 2-123, 2-124, 2-126, 2-127, 2-128, 2-129, 2-130, 2-131, 2-132, 2-133, 2-148, 2-149, 2-150, 2-151, 4-1, 4-2, 4-4, 4-7, 6-1, 6-2, 6-3, 6-4, 6-5, 6-6, 6-7, 6-8, y 6-9.

Ejemplo 2 de Ensayo: Ensayos de confirmación y eficacia frente a áfido de algodón (Aphis Gossypii)

25 El concentrado emulsionable obtenido según la Formulación del Ejemplo 2 de Formulación se diluyó con agua para controlar la concentración del compuesto a 125 ppm. Se inocularon adultos de áfidos de algodón a una planta de pepino (aproximadamente 10 días después de brotar) sembrada en una maceta de 3 sol/tamaño (9 cm). Después de 1 día, los áfidos adultos se retiraron, y la disolución diluida se pulverizó sobre la planta de pepino sobre la que las ninfas suministradas son parásitas. La maceta se colocó en una habitación de temperatura controlada a una temperatura de 25°C y una humedad de 65%. Después de 5 días, se examinó la vida y la muerte, y se determinó el porcentaje insecticida. El ensayo se repitió dos veces.

En el presente ensayo, los siguientes compuestos mostraron el porcentaje insecticida de 100%.

35 Compuestos números 2-2, 2-3, 2-4, 2-6, 2-7, 2-8, 2-9, 2-11, 2-12, 2-13, 2-14, 2-15, 2-16, 2-17, 2-18, 2-19, 2-20, 2-22, 2-23, 2-25, 2-26, 2-29, 2-30, 2-31, 2-33, 2-34, 2-35, 2-36, 2-37, 2-39, 2-40, 2-41, 2-42, 2-46, 2-47, 2-48, 2-49, 2-50, 2-51, 2-52, 2-53, 2-54, 2-55, 2-56, 2-57, 2-58, 2-62, 2-63, 2-64, 2-65, 2-66, 2-67, 2-68, 2-70, 2-71, 2-72, 2-73, 2-75, 2-76, 2-77, 2-78, 2-79, 2-80, 2-81, 2-83, 2-84, 2-85, 2-86, 2-87, 2-89, 2-90, 2-91, 2-93, 2-94, 2-97, 2-98, 2-99, 2-100, 2-103, 2-110, 2-112, 2-117, 2-118, 2-121, 2-122, 2-124, 2-126, 2-127, 2-128, 2-129, 2-132, 2-148, 2-149, 2-150, 4-4, y 6-1.

Ejemplo 3 de Ensayo: Ensayos de confirmación y eficacia frente a la mosca blanca de la batata (Bemisia Tabaci)

45 El concentrado emulsionable obtenido según la Formulación del Ejemplo 2 de Formulación se diluyó con agua para controlar la concentración del compuesto a 125 ppm. La disolución diluida se pulverizó sobre una hoja de tomate obtenida cortándola, y después se secó al aire. Usando algodón absorbente, la hoja se fijó a un matraz de manera que la superficie frontal de la hoja mira hacia arriba. Se inocularon en este recipiente siete pares de adultos de mosca blanca de la batata (tipo B), y el recipiente se colocó en una habitación de temperatura controlada a una temperatura de 25°C y una humedad de 65%. Después de 2 días, se examinó la vida y la muerte, y se determinó el porcentaje insecticida. El ensayo se repitió dos veces.

En el presente ensayo, los siguientes compuestos mostraron el porcentaje insecticida de 100%.

55 Compuestos números 1-2, 1-3, 2-1, 2-2, 2-3, 2-4, 2-5, 2-6, 2-8, 2-9, 2-11, 2-12, 2-13, 2-14, 2-15, 2-16, 2-17, 2-18, 2-19, 2-20, 2-22, 2-24, 2-25, 2-26, 2-27, 2-29, 2-31, 2-33, 2-34, 2-35, 2-36, 2-37, 2-38, 2-39, 2-40, 2-41, 2-42, 2-44, 2-46, 2-47, 2-48, 2-49, 2-50, 2-51, 2-52, 2-53, 2-54, 2-55, 2-56, 2-57, 2-58, 2-59, 2-62, 2-63, 2-64, 2-65, 2-66, 2-67, 2-68, 2-70, 2-71, 2-72, 2-73, 2-74, 2-75, 2-76, 2-77, 2-78, 2-79, 2-80, 2-81, 2-83, 2-84, 2-85, 2-86, 2-87, 2-88, 2-89, 2-90, 2-91, 2-92, 2-93, 2-94, 2-95, 2-97, 2-98, 2-99, 2-100, 2-101, 2-102, 2-103, 2-104, 2-106, 2-109, 2-110, 2-112, 2-114, 2-115, 2-116, 2-117, 2-118, 2-119, 2-121, 2-122, 2-123, 2-124, 2-127, 2-128, 2-129, 2-130, 2-131, 2-132, 2-133, 2-148, 2-149, 2-150, 2-151, 4-3, 4-4, 6-1, 6-2, 6-5, 6-6, 6-7, 6-8, y 6-9.

Ejemplo 4 de Ensayo: Ensayos de confirmación y eficacia frente al ácaro de araña de dos puntos (Tetranychus Urticae Koch)

El polvo humectable obtenido según la Formulación del Ejemplo 1 de Formulación se diluyó con agua para controlar la concentración del compuesto a 125 ppm. Se inocularon diecisiete adultos hembra de araña de dos puntos con resistencia a un agente organofosforado sobre una primera hoja verdadera de una planta de alubia roja (aproximadamente 7 a 10 días después de brotar) sembrada en una maceta de 3 sol/tamaño (9 cm). Se pulverizó la disolución diluida. La maceta se colocó en una habitación de temperatura controlada a una temperatura de 25°C y una humedad de 65%. Después de 3 días, se examinó el porcentaje adulticida. El ensayo se repitió dos veces.

En el presente ensayo, los siguientes compuestos mostraron el porcentaje adulticida de 100%.

Compuestos números 2-2, 2-3, 2-4, 2-6, 2-11, 2-12, 2-13, 2-14, 2-15, 2-17, 2-20, 2-27, 2-34, 2-35, 2-36, 2-38, 2-40, 2-41, 2-46, 2-48, 2-49, 2-50, 2-51, 2-56, 2-59, 2-64, 2-68, 2-70, 2-71, 2-72, 2-73, 2-75, 2-76, 2-77, 2-78, 2-79, 2-80, 2-81, 2-83, 2-84, 2-85, 2-86, 2-87, 2-89, 2-90, 2-92, 2-94, 2-99, 2-100, 2-101, 2-102, 2-103, 2-104, 2-105, 2-106, 2-110, 2-111, 2-113, 2-114, 2-117, 2-118, 2-119, 2-124, 2-148, 2-149, 2-150, 2-151, 4-4, 6-1, 6-2, 6-6, y 6-7.

Ejemplo 5 de Ensayo: Ensayos de confirmación y eficacia frente al mosquito doméstico autógeno (Culex Pipiens Molestus Forskal)

En una microplaca de 96 pocillos, se cargaron cinco a diez larvas de mosquitos domésticos autógenos (1 día después de la eclosión) y 0,225 ml de agua destilada que contiene 0,5 mg de una dieta para peces de acuario (Tetramin, fabricado por Tetra Japan & Spectrum Brands, Inc.). Se preparó una disolución al 1% del compuesto usando dimetilsulfóxido (que contiene 0,5% de Tween 20), y entonces se diluyó hasta 0,01% con agua destilada. Esta disolución química diluida (0,025 ml) se agitó y se añadió a la microplaca que incluye los mosquitos domésticos autógenos en ella (concentración final del compuesto: 0,001%). La microplaca se dejó reposar a una temperatura de 25°C. Después de 2 días, se examinó el porcentaje insecticida. El ensayo se repitió dos veces.

En el presente ensayo, los siguientes compuestos mostraron el porcentaje insecticida de 90% o más, y de este modo los compuestos son eficaces.

Compuestos números 1-1, 1-2, 1-3, 2-1, 2-2, 2-3, 2-4, 2-5, 2-6, 2-7, 2-8, 2-9, 2-10, 2-11, 2-12, 2-13, 2-14, 2-15, 2-16, 2-17, 2-18, 2-19, 2-20, 2-21, 2-22, 2-23, 2-24, 2-25, 2-26, 2-27, 2-28, 2-29, 2-30, 2-31, 2-33, 2-34, 2-35, 2-36, 2-37, 2-38, 2-39, 2-40, 2-41, 2-42, 2-43, 2-45, 2-46, 2-47, 2-48, 2-49, 2-50, 2-51, 2-52, 2-53, 2-54, 2-56, 2-57, 2-58, 2-59, 2-60, 2-61, 2-62, 2-63, 2-64, 2-65, 2-66, 2-67, 2-68, 2-69, 2-70, 2-71, 2-72, 2-73, 2-74, 2-75, 2-76, 2-77, 2-78, 2-79, 2-80, 2-81, 2-82, 2-83, 2-84, 2-85, 2-86, 2-87, 2-88, 2-89, 2-90, 2-91, 2-92, 2-93, 2-94, 2-95, 2-96, 2-97, 2-99, 2-100, 2-101, 2-102, 2-103, 2-104, 2-105, 2-106, 2-108, 2-109, 2-110, 2-111, 2-112, 2-113, 2-114, 2-115, 2-116, 2-117, 2-118, 2-119, 2-120, 2-121, 2-122, 2-123, 2-124, 2-125, 2-126, 2-127, 2-128, 2-130, 2-131, 2-132, 2-133, 2-148, 2-149, 2-150, 2-151, 4-1, 4-2, 4-3, 4-4, 4-5, 4-7, 6-1, 6-2, 6-3, 6-4, 6-5, 6-6, 6-7, 6-8, y 6-9.

Ejemplo 6-1 de Ensayo: Ensayos de confirmación y eficacia frente a la cucaracha alemana (Blattella Germanica)

El compuesto de la presente invención se diluyó con acetona para preparar una disolución química que tiene la concentración de 2000 ppm. Esta disolución química (250 µl) se añadió gota a gota a 0,5 g de una dieta artificial para rata, seguido del secado por aire. La dieta artificial para rata tratada con la disolución química se colocó en un recipiente de plástico hecho de plástico, y se liberaron diez larvas recién nacidas (en un estado de machos y hembras mixtos) de cucarachas alemanas, y, después de cubrirlo, el recipiente de plástico se introdujo en una habitación de temperatura controlada a 25°C. Después de 5 días, se determinó el porcentaje insecticida (%).

En el presente ensayo, los siguientes compuestos mostraron el porcentaje insecticida de 80% o más, y de este modo los compuestos son eficaces.

Compuestos números 2-2, 2-6, 2-11, 2-16, 2-17, 2-18, 2-19, 2-20, 2-23, 2-26, 2-29, 2-33, 2-48, 2-51, 2-53, 2-54, 2-62, 2-63, 2-64, 2-66, 2-68, 2-75, 2-76, 2-78, 2-79, 2-80, 2-81, 2-83, 2-85, 2-86, 2-87, 2-91, y 2-93.

Ejemplo 6-2 de Ensayo: Ensayos de confirmación y eficacia frente a la cucaracha alemana (Blattella Germanica)

El compuesto de la presente invención se diluyó con DMSO para preparar una disolución química que tiene la concentración de 2000 ppm. Esta disolución química (10 µl), 500 µl de agua azucarada al 10%, y 500 µl de una disolución acuosa de agar al 2% se mezcló para preparar un cebo venenoso de tipo jalea. El cebo venenoso de tipo jalea se colocó en un recipiente de plástico y se liberaron diez larvas recién nacidas (en un estado de machos y hembras mixtos) de cucarachas alemanas, y, después de cubrirlo, el recipiente de plástico se introdujo en una habitación de temperatura controlada a 25°C. Después de 5 días, se determinó el porcentaje insecticida (%).

En el presente ensayo, los siguientes compuestos mostraron el porcentaje insecticida de 80% o más, y de este modo los compuestos son eficaces.

Compuestos números 2-11, 2-39, 2-40, 2-41, 2-46, 2-51, y 6-1.

Ejemplo 7 de Ensayo: Ensayos de confirmación y eficacia frente a mosca doméstica (*Musca Domestica*)

Un concentrado emulsionable al 5% del compuesto de la presente invención se diluyó con agua azucarada al 10% para preparar una disolución química que tiene la concentración de 125 ppm. Un algodón absorbente impregnado con 8 ml de la disolución química se colocó en un recipiente de plástico y se liberaron diez adultos hembra de moscas domésticas, y, tras cubrirlo, el recipiente de plástico se alojó en una habitación de temperatura controlada a 25°C. Después de 3 días, se determinó el porcentaje insecticida (%).

En el presente ensayo, los siguientes compuestos mostraron el porcentaje insecticida de 80% o más, y de este modo los compuestos son eficaces.

Compuestos números 2-2, 2-6, 2-11, 2-16, 2-17, 2-18, 2-19, 2-20, 2-23, 2-26, 2-29, 2-33, 2-39, 2-40, 2-41, 2-42, 2-46, 2-48, 2-51, 2-53, 2-54, 2-62, 2-63, 2-64, 2-66, 2-68, 2-75, 2-76, 2-78, 2-79, 2-80, 2-81, 2-83, 2-85, 2-86, 2-87, 2-91, 2-93, y 6-1.

Ejemplo 7 de Ensayo: Ensayos de confirmación y eficacia frente a garrapata de los matorrales (*Haemaphysalis Longicornis*)

El compuesto de la presente invención se diluyó con acetona para preparar una disolución química que tiene la concentración de 400 ppm. Después de aplicar 118 μ l de la disolución química a una superficie interna de un vial de vidrio de 20 ml de volumen, la acetona se vaporizó para formar una película delgada del compuesto de la presente invención sobre la superficie interna del vial de vidrio. Puesto que el vial de vidrio usado tiene la superficie interna de 47 cm², la cantidad tratante de un compuesto químico es 1 μ g/cm². Se colocaron diez larvas de garrapatas de matorrales en el vial de vidrio y, tras cubrirlo, el recipiente de plástico se alojó en una habitación de temperatura controlada a 25°C. Después de 5 días, se determinó el porcentaje insecticida (%).

En el presente ensayo, los siguientes compuestos mostraron el porcentaje insecticida de 80% o más, y de este modo los compuestos son eficaces.

Compuestos números 2-2, 2-6, 2-11, 2-51, 2-68, 2-76, 2-78, 2-79, 2-81, y 2-85.

Ejemplo 9 de Ensayo: Ensayos de confirmación y eficacia frente a la pulga del gato (*Ctenocephalides felis*)

El compuesto de la presente invención se diluyó con acetona para preparar una disolución química que tiene la concentración de 40 ppm. Después de aplicar 118 μ l de la disolución química a una superficie interna de un vial de vidrio de 20 ml de volumen, la acetona se vaporizó para formar una película delgada del compuesto de la presente invención sobre la superficie interna del vial de vidrio. Puesto que el vial de vidrio usado tiene la superficie interna de 47 cm², la cantidad tratante de un compuesto químico es 0,1 μ g/cm². Se colocaron cinco larvas de pulga de gato en el vial de vidrio y, tras cubrirlo, el recipiente de plástico se alojó en una habitación de temperatura controlada a 25°C. Después de 2 días, se determinó el porcentaje insecticida (%).

En el presente ensayo, los siguientes compuestos mostraron el porcentaje insecticida de 80% o más, y de este modo los compuestos son eficaces.

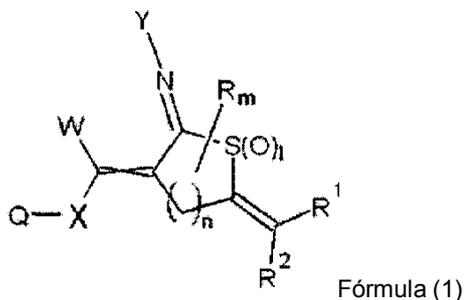
Compuestos números 2-2, 2-6, 2-11, 2-51, 2-68, 2-76, 2-78, 2-79, 2-81, y 2-85.

[Aplicabilidad Industrial]

Según la presente invención, es posible proporcionar un derivado de 1-heterodieno que tiene una nueva estructura, o una sal del mismo. La presente invención también puede proporcionar un agente de control de plagas que incluye, como principio activo, el derivado de 1-heterodieno o una sal del mismo, que tiene excelente actividad biológica, particularmente excelente actividad biológica frente a insectos y ácaridos, y también tiene una seguridad elevada.

REIVINDICACIONES

1. Derivado de 1-heterodieno representado por la Fórmula (1):



5

10

en el que Q en la Fórmula (1) representa un grupo alquilo de C1-6 sustituido o no sustituido, un grupo alqueno de C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo alquino de C2-6 sustituido o no sustituido, un grupo cicloalquilo de C3-8 sustituido o no sustituido, un grupo cicloalqueno de C4-8 sustituido o no sustituido, un grupo arilo de C6-10 sustituido o no sustituido, o un grupo heterocíclico sustituido o no sustituido;

W representa un átomo de hidrógeno, o un grupo alquilo de C1-6 no sustituido;

15

Y representa un grupo arilo de C6-10 sustituido o no sustituido;

X representa un átomo de oxígeno, un átomo de azufre, un grupo sulfinilo, o un grupo sulfonilo;

l representa el número de átomos de oxígeno en paréntesis, y es cualquier número entero de 0 a 2;

20

n representa el número de repeticiones de grupos metileno en paréntesis, y es cualquier número entero de 1 a 4;

25

R representa un grupo alquilo de C1-6 no sustituido, un grupo alqueno de C2-6 no sustituido, un grupo alquino de C2-6 no sustituido, un grupo cicloalquilo de C3-8 no sustituido, un grupo cicloalqueno de C4-8 no sustituido, un grupo arilo de C6-10 no sustituido, o un grupo heterocíclico no sustituido;

m representa el número de R(s), y es cualquier número entero de 0 a 8, y, cuando m es 2 o más, R puede ser igual o diferente, y asimismo cualquier plural R(s) se puede combinar para formar un anillo de 3 a 8 miembros no sustituido o sustituido;

30

R¹ y R², cada uno representan independientemente un átomo de hidrógeno, un grupo alquilo de C1-6 no sustituido, o un grupo cicloalquilo de C3-8 no sustituido;

35

dicho "sustituido" significa que está sustituido con un grupo alquilo de C1-6, un grupo alqueno de C2-6, un grupo alquino de C2-6, un grupo cicloalquilo de C3-8, un grupo cicloalqueno de C4-8, un grupo arilo de C6-10, un grupo heterocíclico, un grupo acilo de C1-11, un grupo (1-imino)alquilo de C1-6, un grupo alcoxi de C1-6, un átomo de halógeno, un grupo sililo, un grupo hidroxilo, un grupo amino, un grupo tiol, un grupo sulfinilo, un grupo sulfonilo, un grupo ciano, un grupo nitro, un grupo formilo, un grupo haloalquilo de C1-6, un grupo arilo, o un grupo aralquilo de C7-12; y

40

un isómero E, un isómero Z, o una mezcla de los mismos se expresa mediante un estereoenlace doble carbono-carbono en la Fórmula (1);

o una sal del mismo.

45

2. Derivado de 1-heterodieno según la reivindicación 1, en el que n es 2, o una sal del mismo.

3. Derivado de 1-heterodieno según la reivindicación 1 o 2, en el que Q es un grupo arilo de C6-10 sustituido o no sustituido, o un grupo heterocíclico sustituido o no sustituido, o una sal del mismo.

50

4. Agente de control de plagas que comprende, como principio activo, al menos uno seleccionado de entre el derivado de 1-heterodieno según cualquiera de las reivindicaciones 1 a 3 y una sal del mismo.

5. Agente de control de plagas según la reivindicación 4, en el que la plaga es un insecto o acárido.