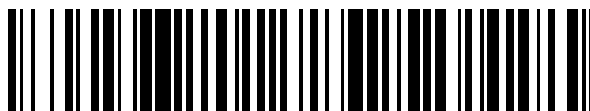


19



OFICINA ESPAÑOLA DE
PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



11 Número de publicación: **2 530 064**

51 Int. Cl.:

C07D 207/20 (2006.01)

C07D 249/10 (2006.01)

C07D 403/10 (2006.01)

A01N 43/36 (2006.01)

C07F 7/10 (2006.01)

12

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

96 Fecha de presentación y número de la solicitud europea: **29.01.2009** **E 09709380 (1)**

97 Fecha y número de publicación de la concesión europea: **12.11.2014** **EP 2242739**

54 Título: **Arilpirrolinas insecticidas**

30 Prioridad:

07.02.2008 JP 2008027241

30.05.2008 JP 2008143120

22.10.2008 EP 08167339

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

26.02.2015

73 Titular/es:

BAYER CROPSCIENCE AG (100.0%)

Alfred-Nobel-Strasse 50

40789 Monheim, DE

72 Inventor/es:

GÖRGENS, ULRICH;

YONETA, YASUSHI;

MURATA, TETSUYA;

MIHARA, JUN;

DOMON, KEI;

SHIMOJO, EIICHI;

SHIBUYA, KATSUHIKO y

ICHIHARA, TERUYUKI

74 Agente/Representante:

CARPINTERO LÓPEZ, Mario

ES 2 530 064 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).

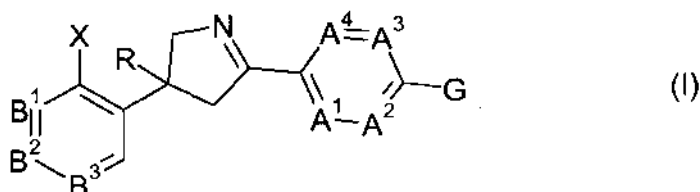
DESCRIPCIÓN

Arlipirrolinas insecticidas

La presente invención se refiere a nuevas arlipirrolinas y a su uso como insecticidas, así como a procedimientos de preparación de las arlipirrolinas.

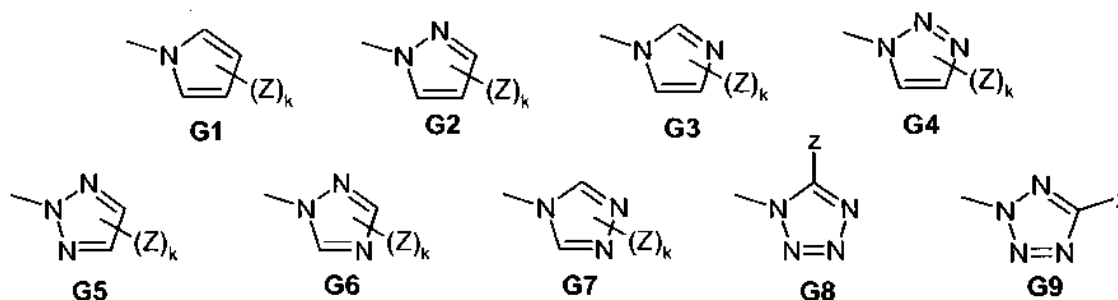
- 5 De la Solicitud de Patente Japonesa Abierta a Consulta por el Público N° 2007-91708 se sabe que los compuestos de benzamida sustituidos con dihidroazol pueden usarse como agentes de control de plagas. Además, a partir de diversas solicitudes de patente publicadas se sabe que ciertos derivados de isoxazolina también pueden usarse como agentes de control de plagas (cotéjese el documento WO 2005/085216, el documento WO 2007/026965, el documento WO 2007/074789, el documento WO 2007/070606, el documento WO 2007/075459, el documento WO 2007/079162, el documento WO 2007/105814, el documento WO 2007/125984, la Solicitud de Patente Japonesa Abierta a Consulta por el Público N° 2007-16017, la Solicitud de Patente Japonesa Abierta a Consulta por el Público N° 2007-106756 y la Solicitud de Patente Japonesa Abierta a Consulta por el Público N° 2007-30847). El uso de compuestos heterocíclicos de 5 miembros como agentes de control de plagas se ha descrito en el documento WO 2007/123853 y el mismo uso de compuestos de pirazolina se ha descrito en el documento WO 2007/123855.
- 10 Dado que la demanda ecológica y económica de modernos agentes de tratamiento de plagas está en continuo crecimiento, particularmente con respecto a la cantidad aplicada, la formación de residuos, la selectividad, la toxicidad y la metodología de producción favorable, y también porque pueden producirse, por ejemplo, problemas de resistencias, existe una tarea pendiente de desarrollar nuevos agentes de tratamientos de plantas que sean capaces, al menos en ciertas áreas, de mostrar ventajas con respecto a los agentes conocidos.
- 20 Los inventores de la presente invención realizaron una ferviente investigación para crear un nuevo compuesto que muestre unos efectos mayores y que tenga un amplio espectro como insecticida. Como resultado encontraron unas nuevas arlipirrolinas que muestran una gran actividad, un amplio espectro y seguridad, y adicionalmente, son eficaces frente a plagas que son resistentes a los agentes organofosforados o a los agentes de carbamato.

Por lo tanto, la presente invención se refiere a compuestos de arlipirrolina de fórmula (I)



25 en la que

G es seleccionado de entre el grupo que consiste en los grupos heterocíclicos de 5 miembros G1 a G9 opcionalmente sustituidos:



30 Z representa cada uno independientemente halógeno, haloalquilo C₁₋₁₂ opcionalmente sustituido; nitro; alcoxilo C₁₋₁₂ opcionalmente sustituido; ciano; haloalcoxilo C₁₋₁₂ opcionalmente sustituido, alquilsulfenilo C₁₋₁₂, alquilsulfenilo C₁₋₁₂, alquilsulfonilo C₁₋₁₂, haloalquilsulfenilo C₁₋₁₂, haloalquilsulfonilo C₁₋₁₂; hidroxilo o tiol;

k representa 0, 1, 2, 3 o 4;

35 R representa alquilo C₁₋₁₂ opcionalmente sustituido o haloalquilo C₁₋₁₂;

A¹, A², A³ y A⁴ representa cada uno independientemente un grupo C-Y; o nitrógeno, con la condición de que únicamente 2 de los grupos químicos A¹, A², A³ y A⁴ pueden representar nitrógeno al mismo tiempo; o si A¹ y A² representan ambos C-Y, entonces ambos Y, junto con los átomos de carbono a los que están unidos, pueden formar un anillo aromático de 5 o 6 miembros;

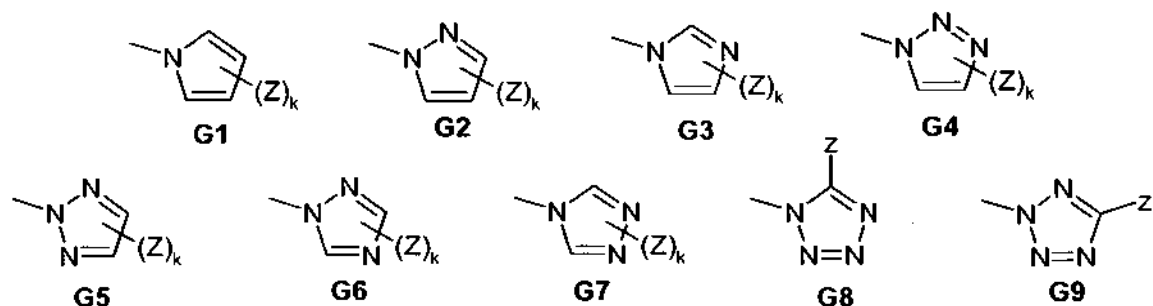
B¹, B² y B³ representan cada uno independientemente un grupo C-X; o nitrógeno con la condición de que únicamente 2 de los grupos químicos B¹, B² y B³ pueden representar nitrógeno al mismo tiempo;

X representa cada uno independentemente hidrógeno; halógeno; haloalquilo C₁₋₁₂ opcionalmente substituído; nitro; alquilo C₁₋₁₂ opcionalmente substituído, alcóxilo C₁₋₁₂, ciano, haloalcóxilo C₁₋₁₂ opcionalmente substituído, alquilsulfenilo C₁₋₁₂, alquilsulfínilo C₁₋₁₂, alquilsulfonilo C₁₋₁₂, haloalquilsulfenilo C₁₋₁₂, haloalquilsulfínilo C₁₋₁₂, haloalquilsulfonilo C₁₋₁₂; hidróxilo, tiol; amino; acilamino C₁₋₁₂ opcionalmente substituído, alcóxicarbonilamino C₁₋₁₂, haloalcóxicarbonilamino C₁₋₁₂, alcóxiimino C₁₋₁₂, haloalcóxiimino C₁₋₁₂, alquilsulfonilamino C₁₋₁₂; o pentafluoruro de azufre;

Y representa cada uno independientemente hidrógeno; halógeno; haloalquilo C₁₋₁₂ opcionalmente sustituido; nitro; alquilo C₁₋₁₂ opcionalmente sustituido, cicloalquilo C₃₋₈, ciclohaloalquilo C₃₋₈, alcoxilo C₁₋₁₂; ciano, haloalcoxilo C₁₋₁₂ opcionalmente sustituido, alquilsulfenilo C₁₋₁₂, alquilsulfinilo C₁₋₁₂, alquilsulfonilo C₁₋₁₂, haloalquilsulfenilo C₁₋₁₂, haloalquilsulfinilo C₁₋₁₂, haloalquilsulfonilo C₁₋₁₂, alquilsulfoniloxi C₁₋₁₂, haloalquilsulfoniloxi C₁₋₁₂, alquilaminosulfonilo C₁₋₁₂, haloalquilaminosulfonilo C₁₋₁₂, dialquilaminosulfonilo C₂₋₂₄ (número total de carbonos), di(haloalquil)aminosulfonilo C₂₋₂₄ (número total de carbonos); hidroxilo; tiol; amino; alquilamino C₁₋₁₂ opcionalmente sustituido, dialquilamino C₂₋₂₄ (número total de carbonos), acilamino C₁₋₁₂, alcocixarbonilamino C₁₋₁₂, haloalcocixarbonilamino C₁₋₁₂, alquilsulfonilamino C₁₋₁₂, haloalquilsulfonilamino C₁₋₁₂, trialkilsililo C₁₋₁₂, alcoxiimino C₁₋₁₂, haloalcoxiimino C₁₋₁₂, alcoxiiminoalquilo C₁₋₁₂, haloalcoxiiminoalquilo C₁₋₁₂, alquilsulfinilimino C₁₋₁₂, alquilsulfiniliminoalquilo C₁₋₁₂, alquilsulfinilimino C₁₋₁₂, alquilcarbonilo C₁₋₁₂, alquilsulfoxiimino C₁₋₁₂, alquilsulfoxiiminoalquilo C₁₋₁₂, alcocixarbonilo C₁₋₁₂, alquilcarbonilo C₁₋₁₂, aminocarbonilo C₁₋₁₂, alquilaminocarbonilo C₁₋₁₂, aminotiocarbonilo, alquilaminotiocarbonilo C₁₋₁₂, dialquilaminocarbonilo C₂₋₁₂ (número total de carbonos) o dialquilaminotiocarbonilo C₂₋₁₂ (número total de carbonos).

En una segunda forma de realización la invención se refiere a compuestos de arilpirrolina de fórmula (I), en la que

G es seleccionado de entre el grupo que consiste en los grupos heterocíclicos G1 a G9 opcionalmente sustituidos:



Z representa cada uno independientemente halógeno, haloalquilo C₁₋₆ opcionalmente sustituido; nitro; alcoilo C₁₋₆ opcionalmente sustituido; ciano; haloalcoilo C₁₋₆ opcionalmente sustituido, alquilsulfenilo C₁₋₆, alquilsulfenilo C₁₋₆, alquilsulfenilo C₁₋₆, haloalquilsulfenilo C₁₋₆, haloalquilsulfenilo C₁₋₆, haloalquilsulfenilo C₁₋₆; hidroxilo o tiol;

k representa 0, 1, 2, 3 o 4:

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

A^1 , A^2 , A^3 y A^4 representan cada uno independientemente un grupo C-Y; o nitrógeno, con la condición de que únicamente 2 de los grupos químicos grupos A^1 , A^2 , A^3 y A^4 pueden representar nitrógeno al mismo tiempo; o si A^1 y A^2 representan ambos C-Y, entonces ambos Y, junto con los átomos de carbono a los que están unidos, pueden formar un anillo aromático de 5 o 6 miembros;

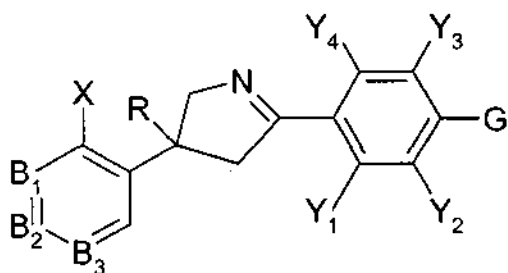
B¹, B² y B³ representan cada uno independientemente un grupo C-X; o nitrógeno con la condición de que únicamente 2 de los grupos químicos B¹, B² y B³ pueden representar nitrógeno al mismo tiempo;

X
5
representa cada uno independientemente hidrógeno; halógeno; haloalquilo C₁₋₆ opcionalmente sustituido; nitro; alquilo C₁₋₆ opcionalmente sustituido, alcoxilo C₁₋₆, ciano, haloalcoxilo C₁₋₆ opcionalmente sustituido, alquilsulfenilo C₁₋₆, alquilsulfenilo C₁₋₆, alquilsulfonilo C₁₋₆, haloalquilsulfenilo C₁₋₆, haloalquilsulfenilo C₁₋₆, haloalquilsulfonilo C₁₋₆; hidroxilo, tior; amino; acilamino C₁₋₆ opcionalmente sustituido, alcoxycarbonilamino C₁₋₆, haloalcoylcarbonilamino C₁₋₆, alcoxiiimino C₁₋₆, haloalcoxiimino C₁₋₆, alquilsulfonilamino C₁₋₆; o pentafluoruro de azufre;

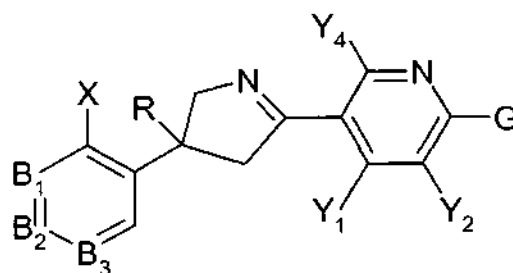
Y
10
15
20
representa cada uno independientemente hidrógeno; halógeno; haloalquilo C₁₋₆ opcionalmente sustituido; nitro; alquilo C₁₋₆ opcionalmente sustituido, cicloalquilo C₃₋₆, ciclohaloalquilo C₃₋₆, alcoxilo C₁₋₆; ciano, haloalcoxilo C₁₋₆ opcionalmente sustituido, alquilsulfenilo C₁₋₆, alquilsulfenilo C₁₋₆, alquilsulfonilo C₁₋₆, haloalquilsulfenilo C₁₋₆, haloalquilsulfenilo C₁₋₆, haloalquilsulfonilo C₁₋₆, alquilsulfonilo C₁₋₆, haloalquilsulfonilo C₁₋₆, alquilaminosulfonilo C₁₋₆, haloalquilaminosulfonilo C₁₋₆, dialquilaminosulfonilo C₂₋₁₂ (número total de carbonos), di(haloalquil)aminosulfonilo C₂₋₁₂ (número total de carbonos); hidroxilo; tior; amino; alquilamino C₁₋₆ opcionalmente sustituido, dialquilamino C₂₋₁₂ (número total de carbonos), acilamino C₁₋₆, alcoxycarbonilamino C₁₋₆, haloalcoylcarbonilamino C₁₋₆, alquilsulfonilamino C₁₋₆, haloalquilsulfonilamino C₁₋₆, alquilsulfonilo C₁₋₆, alcoxiiimino C₁₋₆, haloalcoxiimino C₁₋₆, alcoxiiiminoalquilo C₁₋₆, haloalcoxiiminoalquilo C₁₋₆, alquilsulfonilimino C₁₋₄, alquilsulfonilimino C₁₋₄-alquilo C₁₋₆, alquilsulfonilimino C₁₋₄-alquilcarbonilo C₁₋₅, alquilsulfoxiiimino C₁₋₄, alquilsulfoxiiimino C₁₋₄-alquilo C₁₋₆, alcoxycarbonilo C₁₋₆, alquilcarbonilo C₁₋₆, aminocarbonilo, alquilaminocarbonilo C₁₋₆, aminotiocarbonilo, alquilaminotiocarbonilo C₁₋₆, dialquilaminocarbonilo C₂₋₁₂ (número total de carbonos) o dialquilaminotiocarbonilo C₂₋₁₂ (número total de carbonos).

Los compuestos de acuerdo con la invención tienen carbonos asimétricos, y por lo tanto los compuestos también incluyen especies ópticamente activas. Además, la presente invención también incluye N-óxidos y sales de los compuestos de acuerdo con la invención.

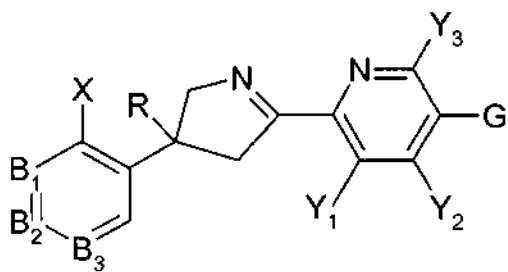
25 En una forma de realización A, se prefieren los compuestos de arilpirrolina de las siguientes estructuras (I-a), (I-b), (I-c), (I-d), (I-e) y (I-f), en las que los grupos químicos G, B¹ a B³, X, R son según se han definido en el presente documento y en las que cada uno de Y₁, Y₂, Y₃ e Y₄ son según se han definido en el presente documento para Y.



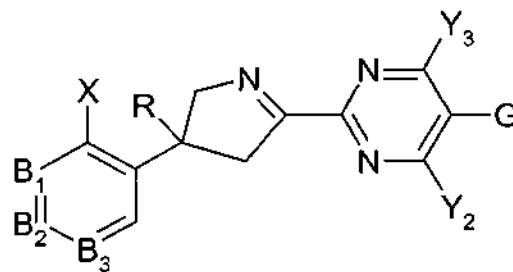
(I-a)



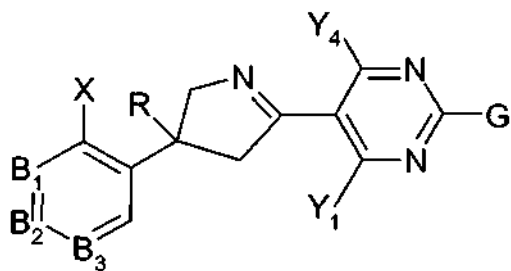
(I-b)



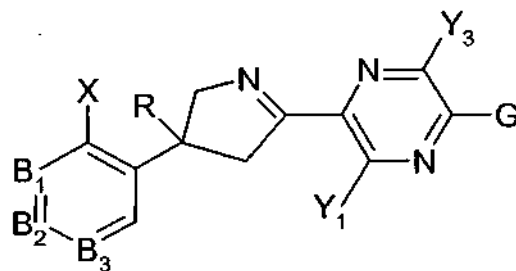
(I-c)



(I-d)



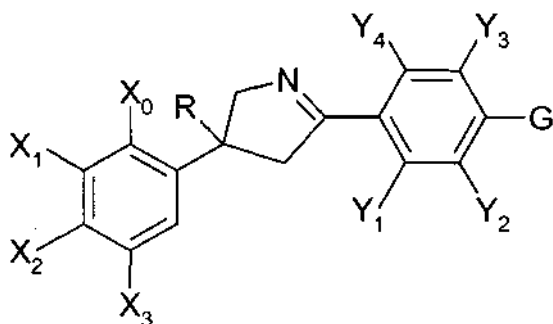
(I-e)



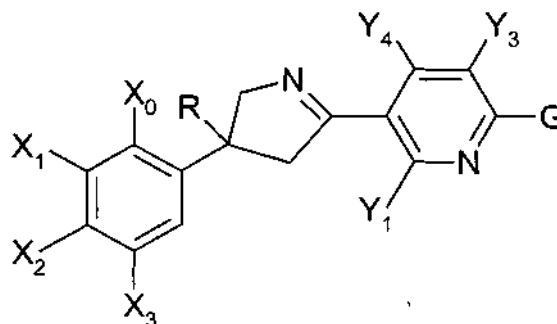
(I-f)

En una forma de realización B, la invención se refiere a los compuestos según se han definido en la forma de realización A, en los que G es seleccionado de entre G1 y G9, preferiblemente de entre G1, G2 y G6.

- 5 En una forma de realización D y E, respectivamente, la invención se refiere a compuestos de arilpirrolina de las siguientes estructuras (I-g) y (I-h), respectivamente, en las que se prefiere que los grupos químicos G, R sean según se han definido en el presente documento y en las que cada uno de Y₁, Y₂, Y₃ e Y₄ sean según se han definido en el presente documento para Y, y en las que X₀, X₁, X₂ y X₃ sean según se definen en el presente documento para X.



(I-g)



(I-h)

En una forma de realización F, la invención se refiere a los compuestos según se definen en la forma de realización D o E, en los que G es seleccionado de entre G1 y G9, preferiblemente de entre G1, G2 y G6.

Los compuestos de acuerdo con la presente invención muestran una potente acción insecticida.

En la presente memoria descriptiva,

- 15 El término "alquilo" usado solo o combinado con otros términos tales como "aminoalquilo" o "haloalquilo" incluye un alquilo de cadena lineal o ramificada que contiene hasta 12 átomos de carbono, tales como metilo, etilo, n o isopropilo; n, iso, sec o terc-butilo; n-pentilo, n-hexilo, n-heptilo, n-octilo, n-nonilo, n-decilo, n-undecilo o n-dodecilo y preferiblemente representa un alquilo con entre 1 y 6 átomos de carbono.

- 20 El término "halógeno" o "halo" usado solo o combinado con otros términos tales como "haloalquilo" incluye flúor, cloro, bromo o yodo.

El término "haloalquilo" usado solo o combinado con otros términos se refiere a grupos alquilo que están parcialmente o totalmente sustituidos con átomos de halógeno que pueden ser iguales o diferentes. Algunos ejemplos de "haloalquilo" incluyen, entre otros, grupos químicos como CF₃, CH₂F, CHF₂, CH₂CHF₂, CCl₃, CH₂Cl, CHCl₂, CF₂CF₃, CH₂CF₃, CH₂CH₂Cl, CH₂CH₂F, CHClCH₃, CHFCH₃, CH₂CHFCl, CHCl₂, CF₂CF₂H, CH₂CF₃.

- 25 El término "cicloalquilo" usado solo o combinado con otros términos representa preferiblemente grupos cicloalquilo con entre 3 y 8 átomos de carbono, tales como ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo, ciclohexilo, cicloheptilo o ciclooctilo, y preferiblemente representa cicloalquilo con entre 3 y 7 átomos de carbono.

El término "alquenilo" usado solo o combinado con otros términos preferiblemente representa alquenilo con entre 2 y 6 o con entre 2 y 5 átomos de carbono. Algunos ejemplos incluyen vinilo, alilo, 1-propenilo, 1, 2 o 3-butenilo o 1-

pentenilo. Lo más preferido representa alqueno con entre 2 y 4 átomos de carbono.

El término "alquino" usado solo o combinado con otros términos preferiblemente representa alquino con entre 2 y 6 o con entre 2 y 5 átomos de carbono. Algunos ejemplos incluyen etino, propino, 1-propino, but-3-ino o pent-4-ino. Lo más preferido representa alquino con entre 2 y 4 átomos de carbono.

- 5 El término "grupo heterocíclico" usado solo o combinado con otros términos preferiblemente representa un grupo heterocíclico de 5 o 6 miembros que contiene al menos uno de N, O y S como heteroátomo. Normalmente un grupo heterocíclico no contiene más de 4 nitrógenos, 2 oxígenos y 2 átomos de azufre. El grupo cíclico, el anillo, puede estar saturado, insaturado o parcialmente saturado. Si no se indica de otro modo, entonces un grupo heterocíclico puede estar unido a través de cualquier carbono o heteroátomo disponible. El término incluye adicionalmente un grupo heterocíclico fusionado que después puede estar condensado con un benzo. Algunos grupos heterocíclicos incluyen, por ejemplo, furilo, tienilo, pirrolilo, isoxazolilo, pirazolilo, oxazolilo, oxadiazolilo, imidazolilo, triazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, tetrazolilo, piridilo, pirimidinilo, piridinilo, piracino, triacino, indolilo, benzoxazolilo o quinolilo.

El término "acilamino" incluye grupos como alquilcarbonilamino, cicloalquilcarbonilamino o benzoilamino.

- 15 El término "opcionalmente sustituido" significa no sustituido o sustituido con al menos un sustituyente "J", que es seleccionado de entre alquilo C₁₋₆, alqueno C₂₋₆, alquino C₂₋₆, cicloalquilo C₃₋₆, cloro, fluoro, bromo, iodo, NO₂, NR_xR_y, N₃, CN, SCN, OR_x, SH, SF₅, COOR_x, C(O)R_x, CONR_xR_y, N=C(R_x)OR_y, SO₂NR_xR_y, fenilo, heterociclos de 5 o 6 miembros, mientras que R_x y R_y independientemente entre sí, representan H, alquilo C₁₋₆ o haloalquilo C₁₋₆. El sustituyente J representa preferiblemente metilo, etilo, i-propilo, C₃-cicloalquilo, cloro, fluoro, bromo, iodo, NO₂, NH₂, NMe₂, NHMe, CN, SCN, OH, OMe, SH, SF₅, COOH, COOMe, C(O)H, COMe, CONH₂, COMe₂, N=CHOH, N=CHOMe, N=CMeOH, SO₂NHMe, SO₂NH₂, SO₂NMe₂, fenilo, un grupo G1 a G9 según se define en el presente documento, o piridina.

- 20 El término "reactivos de flúor" significa "reactivos que contienen flúor". Dichos reactivos son conocidos en la técnica e incluyen, por ejemplo, HF así como fluoruro de potasio, fluoruro de tetrametilamonio, fluoruro de tetraetilamonio o fluoruro de tetrabutilamonio.

El término "haluro de alquilo" representa haloalcanos, tales como fluoroalcanos, cloroalcanos, bromoalcanos y yodoalcanos, con entre 1 y 6 átomos de carbono.

Según se usa en el presente documento R¹, R², R³ y R⁴ tienen los siguientes significados:

- 30 R¹ y R² representan cada uno independientemente hidrógeno; alquilo opcionalmente sustituido, cicloalquilo, haloalquilo, ciclohaloalquilo, alqueno, alquino, haloalqueno, haloalquino; ciano; alcocarbonilo opcionalmente sustituido o alcóxitiocarbonilo; o
- R¹ y R² junto con el átomo de carbono al que están unidos forman un anillo carbocíclico de 3 a 6 miembros;
- 35 R³ representa hidrógeno; amino; hidroxilo; alcoxi opcionalmente sustituido, alquilcarbonilamino, alquilimino, alquilo, cicloalquilo, haloalquilo; ciano; alqueno opcionalmente sustituido, alquino, alquilcarbonilo, o es seleccionado de entre siguientes grupos CH₂-R⁵, C(=O)R⁵, C(=S)R⁵;
- 40 R⁴ representa un grupo químico elegido de entre hidrógeno; ciano; carbonilo; tiocarbonilo; alquilcarbonilo opcionalmente sustituido, alquiltiocarbonilo, haloalquilcarbonilo, haloalquiltiocarbonilo, alquilaminocarbonilo, alquilaminotiocarbonilo, dialquilaminocarbonilo, dialquilaminotiocarbonilo, alcóxiaminocarbonilo, alcóxiaminotiocarbonilo, alcocarbonilo, alcóxitiocarbonilo, tioalcocarbonilo, tioalcóxitiocarbonilo, alquilsulfonilo, haloalquilsulfonilo; o un grupo químico elegido de entre cicloalquilcarbonilo, alquenoilcarbonilo, alquinoilcarbonilo, cicloalquilalquilcarbonilo, alquilsulfenilalquilcarbonilo, alquilsulfenilalquilcarbonilo, alquilsulfonilalquilcarbonilo, alquilcarbonilalquilcarbonilo, cicloalquilaminocarbonilo, alquenoilaminocarbonilo, alquinoilaminocarbonilo; o es seleccionado de entre los grupos C(=O)R⁵ y C(=S)R⁵;
- 45 o
- R³ y R⁴ junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, forman un anillo heterocíclico de 3 a 6 miembros que puede estar sustituido con un sustituyente X, o puede estar sustituido con un grupo ceto, tioceto o nitroimino.

Preferiblemente, R¹, R², R³ y R⁴ tienen el siguiente significado:

- 50 R¹ y R² representan cada uno independientemente hidrógeno; alquilo C₁₋₁₂ opcionalmente sustituido, cicloalquilo C₃₋₈, haloalquilo C₁₋₁₂, ciclohaloalquilo C₃₋₈, alqueno C₂₋₁₂, alquino C₂₋₁₂, haloalqueno C₂₋₁₂, haloalquino C₂₋₁₂; ciano; C₁₋₁₂ alcocarbonilo opcionalmente sustituido, alcóxitiocarbonilo C₁₋₁₂, o
- R¹ y R² junto con el átomo de carbono al que están unidos pueden formar un anillo carbocíclico de 3 a 6

miembros;

R^3 representa hidrógeno; amino; hidroxilo; alcoxi C_{1-12} opcionalmente sustituido, alquilcarbonilamino C_{1-12} , alquilimino C_{1-12} , alquilo C_{1-12} , cicloalquilo C_{3-8} , haloalquilo C_{1-12} , ciano, alquenilo C_{2-12} , alquinilo C_{2-12} , alquilcarbonilo C_{1-12} ; o es seleccionado de entre siguientes grupos CH_2-R^5 , $C(=O)R^5$, $C(=S)R^5$;

5 R^4 representa un grupo químico elegido de entre hidrógeno; ciano; carbonilo; tiocarbonilo; alquilcarbonilo C_{1-12} opcionalmente sustituido, alquiltiocarbonilo C_{1-12} , haloalquilcarbonilo C_{1-12} , haloalquiltiocarbonilo C_{1-12} , alquilaminocarbonilo C_{1-12} , alquilaminotiocarbonilo C_{1-12} , dialquilaminocarbonilo C_{2-24} (número total de carbonos), dialquilaminotiocarbonilo C_{2-24} (número total de carbonos), alcoxiaminocarbonilo C_{1-12} , alcoxiaminotiocarbonilo C_{1-12} , alcoxycarbonilo C_{1-12} , alcoxitiocarbonilo C_{1-12} , tioalcoxycarbonilo C_{1-12} , tioalcoxitiocarbonilo C_{1-12} , alquilsulfonilo C_{1-12} , haloalquilsulfonilo C_{1-12} ; o un grupo químico elegido de entre cicloalquilcarbonilo C_{4-13} , alquenilcarbonilo C_{3-13} , alquinilcarbonilo C_{3-13} , cicloalquilalquilcarbonilo C_{5-25} , alquilsulfenilalquilcarbonilo C_{3-25} , alquilsulfenilalquilcarbonilo C_{3-25} , alquilsulfonilalquilcarbonilo C_{3-25} , alquilcarbonilalquilcarbonilo C_{4-26} , ciclalquilaminocarbonilo C_{4-13} , alquenilaminocarbonilo C_{3-13} , alquinilaminocarbonilo C_{3-13} ; o es seleccionado de entre los grupos $C(=O)R^5$ y $C(=S)R^5$;

15 o R^3 y R^4 junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, forman un anillo heterocíclico de 3 a 6 miembros que puede estar sustituido con un sustituyente X, o puede estar sustituido con un grupo ceto, tioceto o nitroimino.

Más preferiblemente, R^1 , R^2 , R^3 y R^4 tienen el siguiente significado:

20 R^1 y R^2 representan cada uno independientemente hidrógeno; alquilo C_{1-6} opcionalmente sustituido, cicloalquilo C_{3-6} , haloalquilo C_{1-6} , ciclohaloalquilo C_{3-6} , alquenilo C_{2-6} , alquinilo C_{2-6} , haloalquenilo C_{2-12} , haloalquinilo C_{2-6} ; ciano; alcoxycarbonilo C_{1-6} opcionalmente sustituido, alcoxitiocarbonilo C_{1-6} , o

R^1 y R^2 junto con el átomo de carbono al que están unidos pueden formar un anillo carbocíclico de 3 a 6 miembros;

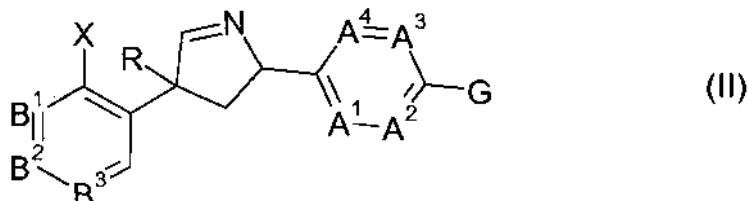
25 R^3 representa hidrógeno; amino; hidroxilo; alcoxi C_{1-6} opcionalmente sustituido, alquilcarbonilamino C_{1-6} , alquilimino C_{1-6} , alquilo C_{1-6} , cicloalquilo C_{3-6} , haloalquilo C_{1-6} , ciano, alquenilo C_{2-6} , alquinilo C_{2-6} , alquilcarbonilo C_{1-6} ; o es seleccionado de entre siguientes grupos CH_2-R^5 , $C(=O)R^5$, $C(=S)R^5$;

30 R^4 representa un grupo químico elegido de entre hidrógeno; ciano; carbonilo; tiocarbonilo; alquilcarbonilo C_{1-6} opcionalmente sustituido, alquiltiocarbonilo C_{1-6} , haloalquilcarbonilo C_{1-6} , haloalquiltiocarbonilo C_{1-6} , alquilaminocarbonilo C_{1-6} , alquilaminotiocarbonilo C_{1-6} , dialquilaminocarbonilo C_{2-12} (número total de carbonos), dialquilaminotiocarbonilo C_{2-12} (número total de carbonos), alcoxiaminocarbonilo C_{1-6} , alcoxiaminotiocarbonilo C_{1-6} , alcoxycarbonilo C_{1-6} , alcoxitiocarbonilo C_{1-6} , tioalcoxycarbonilo C_{1-6} , tioalcoxitiocarbonilo C_{1-6} , alquilsulfonilo C_{1-6} , haloalquilsulfonilo C_{1-6} ; o un grupo químico elegido de entre cicloalquilcarbonilo C_{4-7} , alquenilcarbonilo C_{3-7} , alquinilcarbonilo C_{3-7} , cicloalquilalquilcarbonilo C_{5-13} , alquilsulfenilalquilcarbonilo C_{3-13} , alquilsulfenilalquilcarbonilo C_{3-13} , alquilsulfonilalquilcarbonilo C_{3-13} , alquilcarbonilalquilcarbonilo C_{4-14} , ciclalquilaminocarbonilo C_{4-7} , alquenilaminocarbonilo C_{3-7} , alquinilaminocarbonilo C_{3-7} ; o es seleccionado de entre los grupos $C(=O)R^5$ y $C(=S)R^5$;

o R^3 y R^4 junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos, forman un anillo heterocíclico de 3 a 6 miembros que puede estar sustituido con un sustituyente X, o puede estar sustituido con un grupo ceto, tioceto o nitroimino.

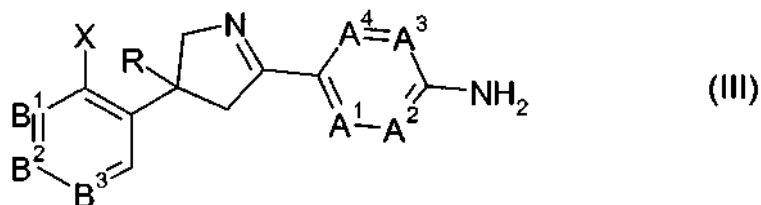
40 Los compuestos de acuerdo con la invención pueden obtenerse mediante los procedimientos de preparación conocidos generalmente en la técnica, junto con los procedimientos de producción (a) hasta (g) o (p) según se describe en este documento.

Por lo tanto, la invención también se refiere a un procedimiento de preparación (a) para la preparación de los compuestos de acuerdo con la invención, que comprende la etapa de cambiar un doble enlace imino en compuestos de la fórmula (II):



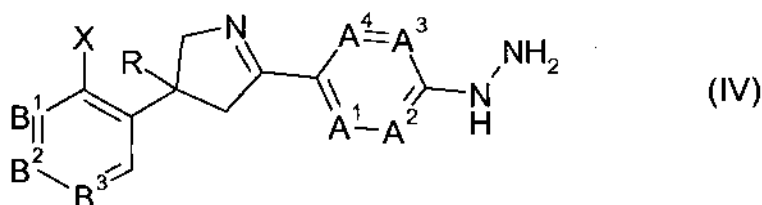
45 en la que A^1 a A^4 , B^1 a B^3 , X, R y G tienen los mismos significados según se han definido en el presente documento, en presencia de una base metálica alcalina.

La invención está dirigida además a un procedimiento de preparación (b) para la preparación de los compuestos de acuerdo con la invención en el que G representa G1, G6 o G8, que comprende la reacción de los compuestos de la fórmula (III):



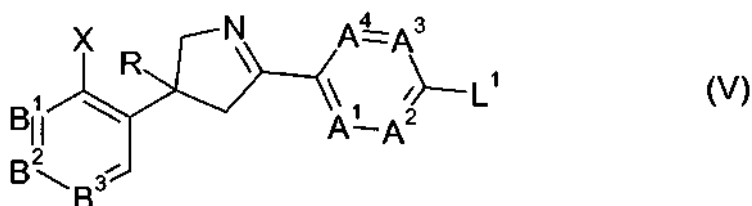
5 en la que
A¹ a A⁴, B¹ a B³, y X, R tienen los mismos significados según se han definido en el presente documento, con dialcoxitetrahydrofurano (por ejemplo, dimetoxitetrahydrofurano), 1,2-diformilhidracina, o con azida de sodio y ortoformiato de trialquilo.

10 La invención también se refiere a un procedimiento de preparación (c) para la preparación de compuestos de acuerdo con la invención, en el que G representa G2, que comprende la reacción de los compuestos de la fórmula (IV):



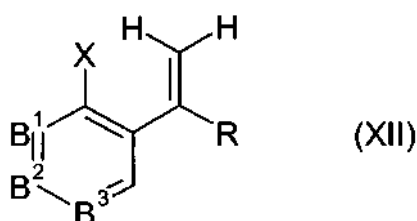
15 A¹ a A⁴, B¹ a B³, X, y R tienen los mismos significados según se han definido en el presente documento, con 1,1,3,3-tetraalcoxipropano (por ejemplo, 1,1,3,3-tetraetoxipropano).

La invención también se refiere a un procedimiento de preparación (d) para la preparación de los compuestos de acuerdo con la invención, en el que G representa G2, G3, G4, G5, G6, G8 o G9, que comprende la reacción de los compuestos de la fórmula (V):

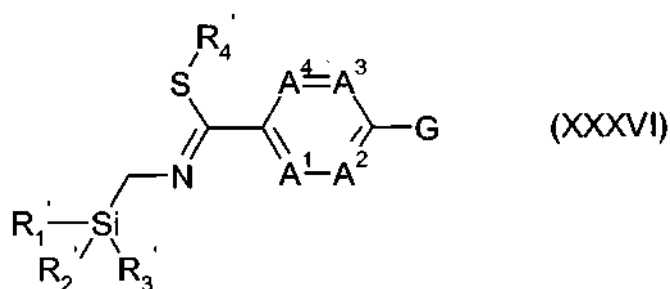


20 en la que
A¹ a A⁴, B¹ a B³, X, y R tienen los mismos significados según se han definido en el presente documento y en la que L¹ representa halógeno, o un grupo haloalquilsulfonilo con entre 1 y 4 átomos de carbono, con un grupo químico G2-H, G3-H, G4-H, G5-H, G6-H, G8-H o G9-H.

25 La invención está dirigida además a un procedimiento de preparación (p) para la preparación de compuestos de acuerdo con la invención, que comprende la reacción de los compuestos de la fórmula (XII):



en la que B¹ a B³, X y R tienen los mismos significados según se han definido en el presente documento, con compuestos de la fórmula (XXXVI):



en la que

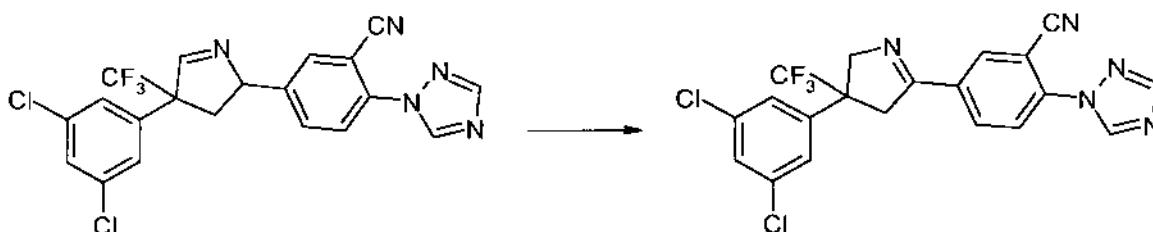
5 R_1' , R_2' y R_3' representan cada uno independientemente un alquilo opcionalmente sustituido, preferiblemente alquilo C_{1-12} , o fenilo opcionalmente sustituido; y

R_4' representa hidrógeno; o es seleccionado de entre alquilo opcionalmente sustituido, preferiblemente alquilo C_{1-12} , alquenilo opcionalmente sustituido, preferiblemente alquenilo C_{2-12} , alquinilo opcionalmente sustituido, preferiblemente alquinilo C_{2-12} o bencilo opcionalmente sustituido;

y A^1 a A^4 y G tienen los mismos significados según se han definido en el presente documento.

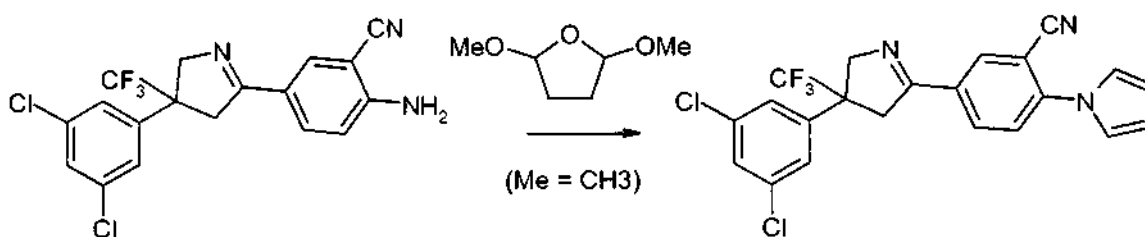
10 Los procedimientos de producción (a) a (d) y (p) están ilustrados por los siguientes esquemas de reacción

Esquema de reacción 1 - Procedimiento de producción (a):



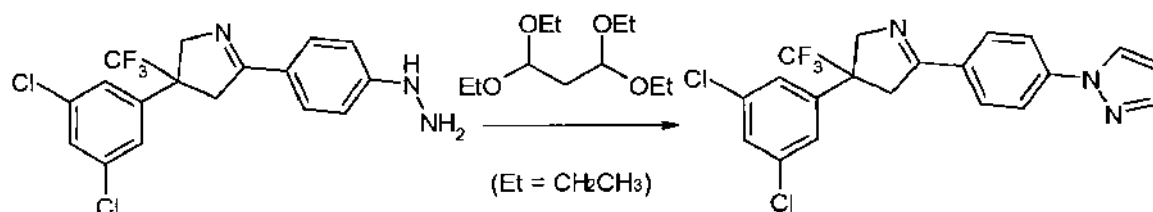
15 Aquí se usa 5-[4-(3,5-diclorofenil)-4-(trifluorometil)-3,4-dihidro-2H-pirrol-2-il]-2-(1H-1,2,4-triazol-1-il) benzonitrilo usa como material de partida.

Esquema de reacción 2 - Procedimiento de producción (b):



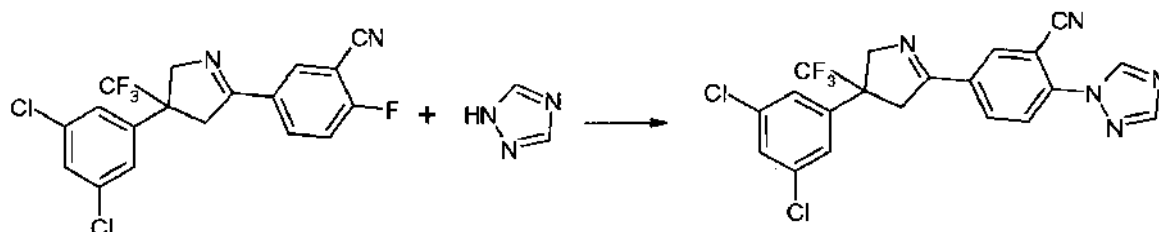
20 Aquí se usan 2-amino-5-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)-3,4-dihidro-2H-pirrol-5-il] benzonitrilo y 2,5-dimetoxitetrahidrofurano como materiales de partida.

Esquema de reacción 3 - Procedimiento de producción (c)



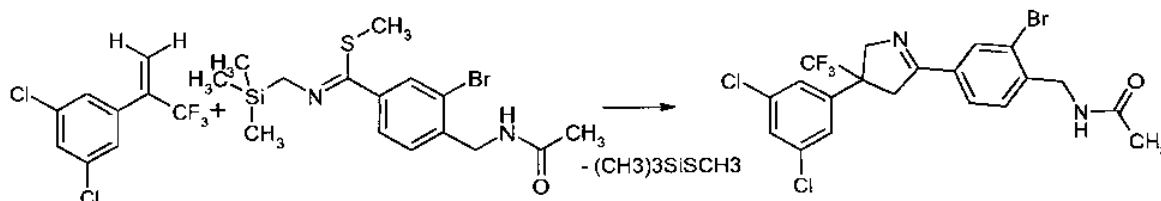
Aquí se usan 3-(3,5-diclorofenil)-5-(4-hidracinofenil)-3-(trifluorometil)-3,4-dihidro-2H-pirrol y 1,1,3,3- tetraetoxipropano como materiales de partida.

Esquema de reacción 4 - Procedimiento de producción (d):



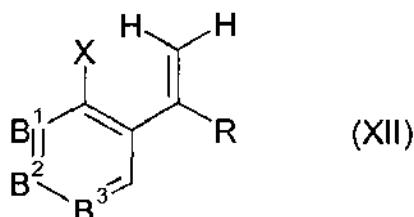
Aquí se usan 5-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)-3,4-dihidro-2H-pirrol-5-il]-2-fluorobenzonitrilo y 1H-1,2,4-triazol como materiales de partida.

Esquema de reacción 8 - Procedimiento de producción (p):

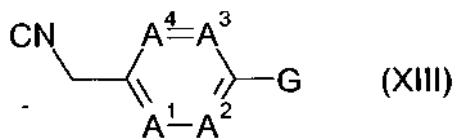


Aquí se usan 1,3-dicloro-5-(3,3,3-trifluoropropo-1-en-2-il) benceno y 4-[(acetilamino)metil]-3-bromo-N-[(trimetilsilil)metil] benzenocarbodimatioato de metilo como materiales de partida. Los compuestos de fórmula (II), que pueden usarse como materiales de partida en el procedimiento de producción (a), son compuestos nuevos y pueden ser sintetizados mediante el uso de los mismos procedimientos o similares a los descritos en el documento EP-A-1538138.

Los compuestos de fórmula (II) pueden prepararse mediante la reacción de los compuestos de la fórmula (XII).

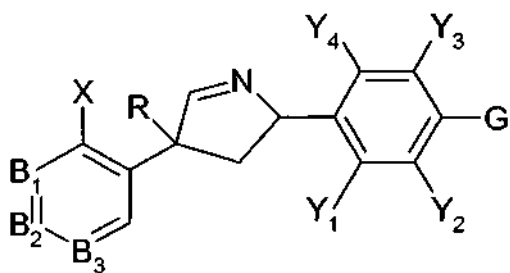


en la que B¹ a B³, X y R tienen los mismos significados según se han definido en el presente documento, con compuestos de la fórmula (XIII):

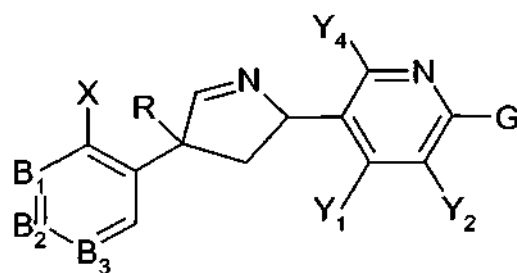


en la que A¹ a A⁴ y G tienen los mismos significados según se han definido en el presente documento, preferiblemente, en presencia de un catalizador metálico.

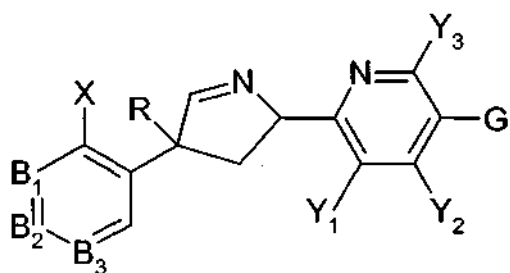
- 5 Como los compuestos (II), y en una forma de realización J, se prefieren los compuestos de las siguientes estructuras (II-a), (II-b), (II-c), (II-d), (II-e) y (II-f), en los que los grupos químicos G, B¹ a B³, X, R son según se han definido en el presente documento, y en los que cada uno de Y₁, Y₂, Y₃ e Y₄ son como se han definido en el presente documento para Y.



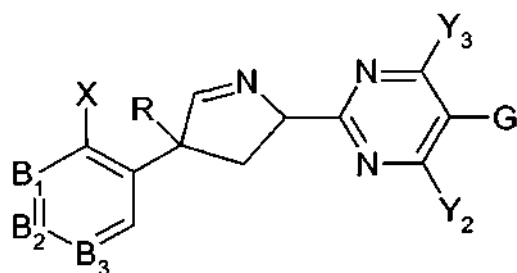
(II-a)



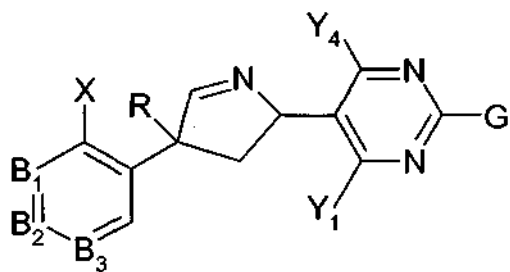
(II-b)



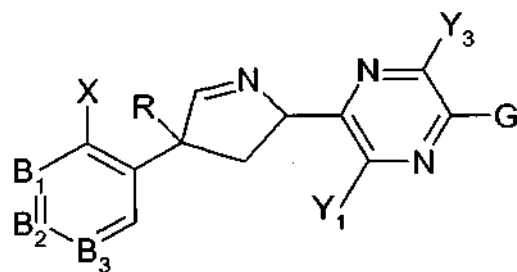
(II-c)



(II-d)



(II-e)

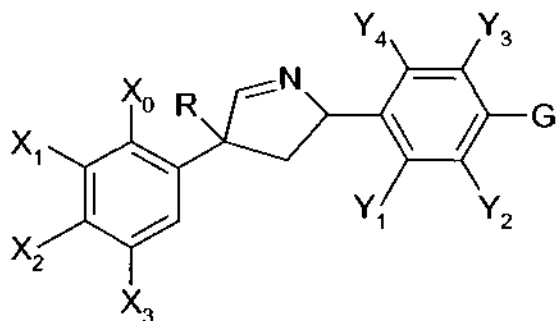


(II-f)

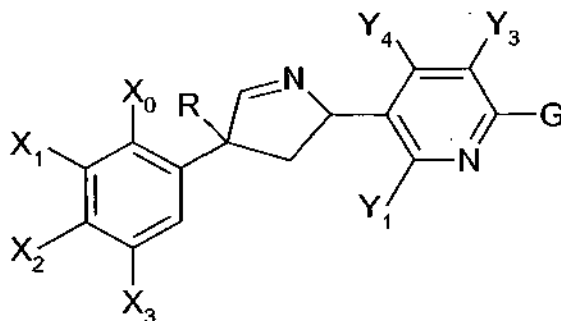
En una forma de realización K, la invención se refiere a los compuestos según se definen en la forma de realización J, en los que G es seleccionado de entre G1 a G9, preferiblemente de entre G1, G2 y G6.

En una forma de realización M y N, respectivamente, la invención se refiere a los compuestos de las siguientes estructuras (II-g) y (II-h), respectivamente, en los que se prefieren los grupos químicos G, R que son según se han

definido en el presente documento, y en los que cada uno de Y_1 , Y_2 , Y_3 e Y_4 son como se han definido en el presente documento para Y , y en los que X_0 , X_1 , X_2 y X_3 son como se han definido en el presente documento para X .



(II-g)



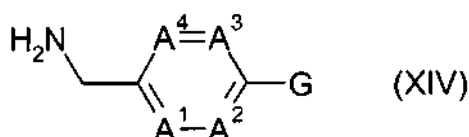
(II-h)

- 5 En una forma de realización O, la invención se refiere a los compuestos según se definen en la forma de realización M o N, en los que G es seleccionado de entre G1 a G9, preferiblemente de entre G1, G2 y G6.

Los compuestos de fórmula (II) son, por ejemplo, 5-[4-(3,5-diclorofenil)-4-(trifluorometil)-3,4-dihidro-2H-pirrol-2-il]-2-(1H-1,2,4-triazol-1-il) benzonitrilo, y N-[2-bromo-4-[4-(3,5-diclorofenil)-4-(trifluorometil)-3,4-dihidro-2H-pirrol-2-il]bencil] acetamida.

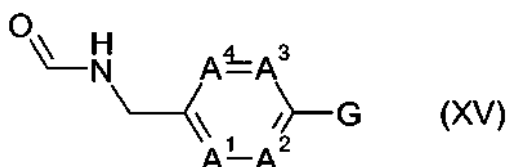
- 10 Los compuestos de fórmula (XII) se describen en The Journal of Organic Chemistry, Vol. 56, págs. 7336 - 7340 (1991); *ibid.* Vol. 59, págs. 2898 - 2901 (1994); Journal of Fluorine Chemistry, Vol. 95, págs. 167 - 170 (1999) o en el documento WO 2005/5085216. Dichos compuestos son, por ejemplo, [1-(trifluorometil)vinil] benceno, 1,3-difluoro-5-[1-(trifluorometil)vinil] benceno, 1-cloro-3-[1-(trifluorometil)vinil] benceno, 1,3-dicloro-5-[1-(trifluorometil)vinil] benceno, 1-trifluorometil-3-[1-(trifluorometil)vinil]-benceno, 1-trifluorometil-4-[1-(trifluorometil)vinil] benceno, 1,3-bis(trifluorometil)-5-[1-(trifluorometil)vinil] benceno, 1,3-dibromo-5-[1-(trifluorometil)vinil] benceno, 1,2,3-tricloro-5-[1-(trifluorometil)vinil] benceno y 1-fluoro-2-(trifluorometil)-4-[1-(trifluorometil)vinil] benceno.
- 15

Los compuestos de fórmula (XIII) pueden ser sintetizados mediante los procedimientos descritos en Chem. Lett., págs. 697 - 698 (1977) y/o pueden obtenerse mediante la reacción de los compuestos de la fórmula (XIV) con formiato de etilo



(XIV)

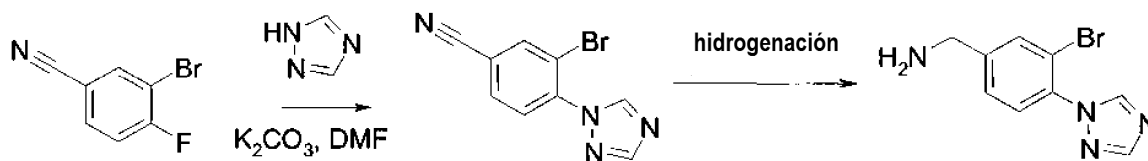
- 20 para obtener los compuestos de la fórmula (XV):



(XV)

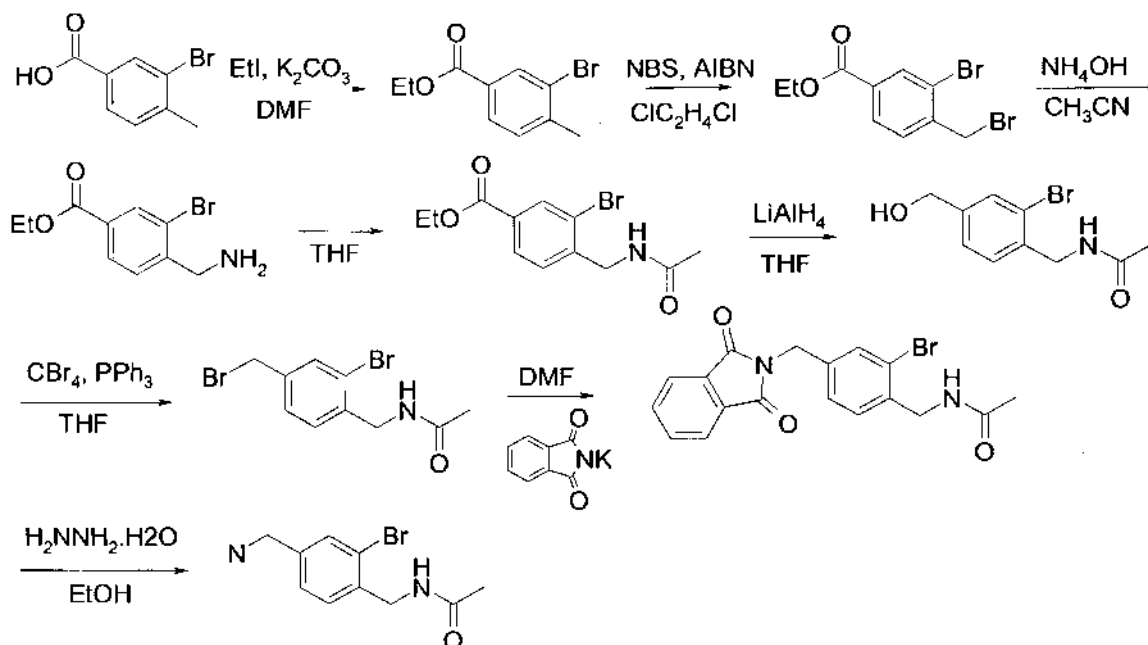
en las que A^1 a A^4 y G tienen los mismos significados según se han definido en el presente documento, seguido de las etapas de halogenación, deshalogenación e hidrogenación.

- 25 El esquema de reacción 9 muestra un procedimiento de síntesis para la preparación de los compuestos de la fórmula (XIV), en el que G representa un grupo heterocíclico saturado o insaturado de 5 o 6 miembros opcionalmente sustituido.

Esquema de reacción 9

5 en el que DMF representa N,N-dimetilformamida; y la hidrogenación se lleva a cabo según se describe en el documento US 2007/111984 A.

El esquema de reacción 10 muestra un procedimiento de síntesis para la preparación de los compuestos de la fórmula (XIV), en el que G representa un grupo químico $-(CR^1R^2)_1-NR^3R^4$ según se define en el presente documento.

Esquema de reacción 10

10 *1 ácido acético anhidro, en las que EtI representa yoduro de etilo, NBS representa N-bromosuccinimida, AIBN representa azobisisobutironitrilo y DMF representa N,N-dimetilformamida.

Los compuestos de la fórmula (XV) son, por ejemplo, N-[3-bromo-4-(1H-1,2,4-triazol-1-il)bencil] formamida, y N-[2-bromo-4-[(formilamino)metil]bencil] acetamida.

15 Adicionalmente, el procedimiento de producción (a) puede realizarse según se describe en la Solicitud de Patente Japonesa Abierta a Consulta por el Público N° 2007-91708 y en Chem. Lett., págs. 1601 - 1604 (1985).

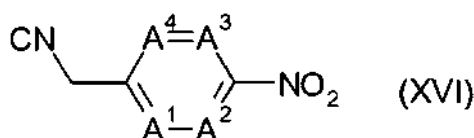
20 La reacción del procedimiento de producción (a) puede llevarse a cabo en un diluyente apropiado y mediante el uso de una base metálica alcalina tal como carbonato de sodio, carbonato de potasio, hidrogenocarbonato de sodio, hidrogenocarbonato de potasio, acetato de sodio, acetato de potasio, metóxido de sodio, etóxido de sodio o terc-butóxido de potasio; una base orgánica tal como trietilamina, diisopropiletilamina, tributilamina, N-metilmorfolina, N,N-dimetilanilina, N,N-dieterilamina, 4-terc-butil-N,N-dimetilanilina, piridina, picolina, lutidina, diazabicycloundeceno, diazabicyclooctano o imidazol; como la base; a unas temperaturas de entre aproximadamente -78 y aproximadamente 200 °C, preferiblemente de entre -10 y aproximadamente 100 °C. Adicionalmente, la reacción puede llevarse a cabo diferentes presiones, tal como a la presión normal, es decir, 1.013 mbar, o a presión reducida, es decir, por debajo de 1.013 mbar. El tiempo de reacción puede variar, y es de entre 0,1 y 72 horas, preferiblemente de entre 1 y 24 horas.

30 Algunos diluyentes apropiados para el procedimiento de producción (a) incluyen, por ejemplo, hidrocarburos alifáticos, cicloalifáticos y aromáticos (opcionalmente pueden estar clorados), por ejemplo, pentano, hexano, ciclohexano, éter de petróleo, ligroína, benceno, tolueno, xileno, diclorometano, cloroformo, tetracloruro de carbono, 1,2-dicloroetano, clorobenceno, diclorobenceno y similares; éteres, por ejemplo, etil éter, metil etil éter, isopropil éter, butil éter, dioxano, dimetoxietano (DME), tetrahydrofurano (THF), dietilenglicol dimetil éter (DGM) y similares;

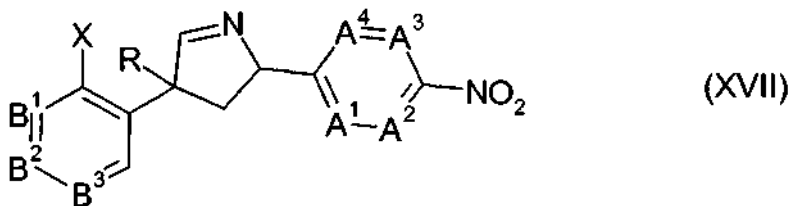
cetonas, por ejemplo, acetona, metil etil cetona (MEK), metil isopropil cetona, metil isobutil cetona (MIBK) y similares; nitrilos, por ejemplo, acetonitrilo, propionitrilo, acrilonitrilo y similares; alcoholes, por ejemplo, metanol, etanol, isopropanol, butanol, etilenglicol y similares; ésteres, por ejemplo, acetato de etilo, acetato de amilo y similares; amidas ácidas, por ejemplo, dimetilformamida (DMF), dimetilacetamida (MDA), N-metilpirrolidona, 1,3-dimetil-2-imidazolidinona, triamida hexametilfosfórica (HMPA) y similares; sulfonas y sulfóxidos, por ejemplo, dimetilsulfóxido (DMSO), sulfolano y similares; y bases, por ejemplo, piridina y similares.

Para llevar a cabo el procedimiento de producción (a), por ejemplo, cuando se hace reaccionar 1 mol de los compuestos de fórmula (II) con una base en una cantidad de 1 mol o en un ligero exceso, en un diluyente tal como THF, pueden obtenerse los compuestos de acuerdo con la invención.

Los compuestos de fórmula (III), que pueden usarse como materiales de partida en el procedimiento de producción (b), son compuestos nuevos y pueden ser sintetizados de acuerdo con los siguientes procedimientos de preparación y esquemas de reacción. Los compuestos de fórmula (III) pueden prepararse mediante la reacción de los compuestos de la fórmula (XII) con los compuestos de la fórmula (XVI):



para obtener los compuestos de la fórmula (XVII):



en las que A¹ a A⁴, B¹ a B³, R y X tienen los mismos significados según se han definido en el presente documento, seguido de la etapa de cambio de un doble enlace imino en condiciones básicas (por ejemplo, en presencia de una base metálica alcalina) y la reducción del grupo -NO₂.

Los compuestos de la fórmula (XVI) son, por ejemplo, 2-fluoro-4-isocianatometil-1-nitrobenzono, 2-bromo-4-isocianatometil-1-nitrobenzono, 2-yodo-4-isocianatometil-1-nitrobenzono, 2-metil-4-isocianatometil-1-nitrobenzono y 2-ciano-4-isocianatometil-1-nitrobenzono.

Algunos compuestos representativos de fórmula (III) son, por ejemplo, 4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)-3,4-dihidro-2H-pirrol-5-il] anilina y 2-bromo-4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)-3,4-dihidro-2H-pirrol-5-il] anilina.

El dialcoxitetrahydrofurano es, por ejemplo, 2,5-dimetoxitetrahydrofurano y 2,5-dietoxitetrahydrofurano.

La reacción del procedimiento de producción (b) puede llevarse a cabo en un diluyente apropiado a unas temperaturas de entre 0 y aproximadamente 200 °C y preferiblemente a la temperatura ambiente, es decir, desde aproximadamente 20 °C hasta aproximadamente 150 °C. Adicionalmente, la reacción puede llevarse a cabo a diferentes presiones, tales como a la presión normal, es decir, 1.013 mbar, o a una presión por encima o por debajo (a presión reducida) de la presión normal. El tiempo de reacción puede variar entre 0,1 y 72 horas, preferiblemente entre 1 y 24 horas.

Los diluyentes apropiados en el procedimiento de producción (b) incluyen, por ejemplo, hidrocarburos alifáticos (hexano, ciclohexano, benceno, tolueno, xileno y otros), ácidos (ácido acético, ácido propiónico), hidrocarburos aromáticos (benceno, tolueno, xileno, clorobenceno y otros), éteres (éter dietílico, dibutil éter, dimetoxietano (DME), tetrahydrofurano, dioxano y otros), amidas ácidas (dimetilformamida (DMF), dimetilacetamida (DME), N-metilpirrolidona y otros), ácidos (ácido acético, ácido propiónico), nitrilos (acetonitrilo, propionitrilo y otros), dimetilsulfóxido (DMSO) y mezclas disolventes de los mismos.

Para llevar a cabo el procedimiento de producción (b), por ejemplo, cuando se hace reaccionar 1 mol de los compuestos de fórmula (III) con entre 1 mol y 5 moles de 2,5-dimetoxitetrahydrofurano en un diluyente tal como ácido acético, pueden obtenerse los compuestos de acuerdo con la invención.

En el caso de que se lleve a cabo una reacción con 1,2-diformilhidracina en el procedimiento de producción (b), la reacción puede llevarse a cabo en presencia de una base, tal como bases orgánicas (por ejemplo, trietilamina, diisopropiletilamina, tributilamina, N-metilmorfolina, N,N-dimetilanilina, N,N-dietilanilina, 4-terc-butyl-N,N-dimetilanilina,

piridina, picolina, lutidina, diazabicycloundeceno, diazabicyclooctano e imidazol y trialquilhalosilano) y un trialquilhalosilano, tal como trimetilclorosilano, trietilclorosilano y trimetilbromosilano.

Para llevar a cabo el procedimiento de producción, cuando se hace reaccionar 1 mol de los compuestos de fórmula (III) con entre 1 mol y 5 moles de 1,2-diformilhidracina, entre 1 mol y 10 moles de la base y entre 1 mol y 25 moles de un trialquilhalosilano, en un gran exceso de piridina, pueden obtenerse los compuestos de acuerdo con la invención.

En el caso de que en el procedimiento de producción (b) se haga reaccionar azida de sodio con ortoformiato de trialquilo, algunos ejemplos del ortoformiato de trialquilo incluyen ortoformiato de trimetilo y ortoformiato de trietilo.

Para llevar a cabo el procedimiento de producción, cuando se hace reaccionar 1 mol de los compuestos de fórmula (III) con entre 1 y 3 moles de la azida de sodio y entre 1 y 10 moles del ortoformiato de trialquilo en un diluyente apropiado tal como ácido acético, pueden obtenerse los compuestos de acuerdo con la invención.

Los compuestos de fórmula (IV), que pueden usarse como material de partida en el procedimiento de producción (c), son compuestos nuevos y pueden ser sintetizados sometiendo los compuestos de fórmula (III) a la bien conocida reacción de "Sandmeyer" y seguido de una reacción de reducción.

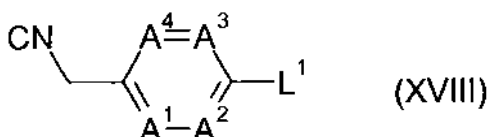
Algunos compuestos representativos de fórmula (IV) son, por ejemplo, 3-(3,5-diclorofenil)-1-(4-hidracinofenil)-3-(trifluorometil)-3,4-dihidro-2H-pirrol y 3-(3,5-diclorofenil)-1-(4-hidracino-3-metilfenil)-3-(trifluorometil)-3,4-dihidro-2H-pirrol.

Algunos 1,1,3,3-tetraalcoxipropanos adecuados son, por ejemplo, 1,1,3,3-tetrametoxipropano y 1,1,3,3-tetraetoxipropano,

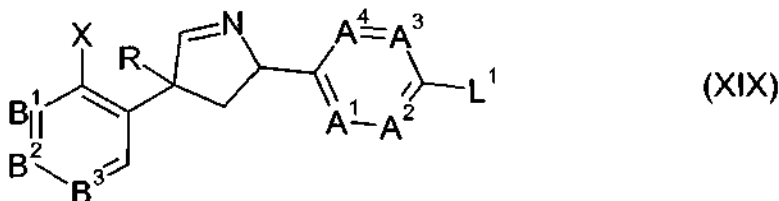
La reacción del procedimiento de producción (c) puede llevarse a cabo en un diluyente apropiado a la temperatura y a la presión según se han descrito para el procedimiento de producción (b).

Para llevar a cabo el procedimiento de producción (c), por ejemplo, cuando se hace reaccionar 1 mol de los compuestos de fórmula (IV) con entre 1 mol y 5 moles de 1,1,3,3-tetraalcoxipropano en un diluyente tal como etanol y, si fuera necesario, en presencia de una cantidad catalítica de un ácido tal como ácido sulfúrico, pueden obtenerse los compuestos de acuerdo con la invención.

Los compuestos de fórmula (V), que pueden usarse como materiales de partida en el procedimiento de producción (d), son compuestos conocidos y pueden ser sintetizados mediante la reacción de los compuestos de la fórmula (XII) con los compuestos de la fórmula (XVIII):



para obtener los compuestos de la siguiente fórmula:



en las que A¹ a A⁴, B¹ a B³, R, X y L¹ tienen los mismos significados según se han definido en el presente documento, seguido de la etapa de cambio de un doble enlace imino en condiciones básicas.

Los compuestos de la fórmula (XVIII) pueden ser sintetizados de acuerdo con el procedimiento para la producción de los compuestos de la fórmula (XIII). Algunos compuestos específicos de la fórmula (XVIII) son, por ejemplo, 2-fluoro-5-isocianatometil-nitrobenzono y 2-fluoro-5-isocianatometil-benzonitrilo.

Algunos compuestos representativos de la fórmula (V) usados en el procedimiento de producción (d) son, por ejemplo, 5-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)-3,4-dihidro-2H-pirrol-5-il]-2-fluorobenzonitrilo y 5-[3-[3,5-bis(trifluorometil)fenil]-3-(trifluorometil)-3,4-dihidro-2H-pirrol-5-il]-2-fluorobenzonitrilo.

Muchos de los compuestos representados por las fórmulas G2-H, G3-H, G4-H, G5-H, G6-H, G8-H y G9-H, que son los materiales de partida en el procedimiento de producción (d), son compuestos conocidos, y algunos ejemplos específicos de los mismos incluyen 1H-imidazol, 1 H-pirazol, 4-metil-1H-pirazol, 4-fluoro-1H-pirazol, 4-cloro-1H-pirazol, 4-bromo-1H-pirazol, 4-yodo-1H-pirazol, 4-nitro-1H-pirazol, 3-trifluorometil-1H-pirazol, 4-trifluorometil-1H-pirazol, 4-ciano-1H-pirazol, 1H-1,2,3-triazol, 1H-1,2,4-triazol, 1H-tetrazol, 5-metil-1H-tetrazol, 5-(metiltio)-1H-tetrazol.

La reacción del procedimiento de producción (d) puede llevarse a cabo en un diluyente apropiado y mediante el uso de una base metálica alcalina según se ha ejemplificado en el procedimiento de reacción (a) en las condiciones de reacción (temperatura, presión, tiempo de reacción) según se han descrito para el procedimiento de producción (a).

Para llevar a cabo el procedimiento de producción (d), por ejemplo, cuando se hace reaccionar 1 mol de los compuestos de fórmula (V) con entre 1 mol y 3 moles de G6-H en un diluyente tal como DMF, en presencia de entre 1 mol y 3 moles de una base, pueden obtenerse los compuestos de acuerdo con la invención.

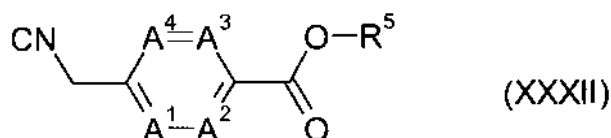
Los compuestos de la fórmula (XXIV) pueden ser sintetizados de acuerdo con el procedimiento descrito para la preparación de los compuestos de fórmula (XIII). Algunos compuestos representativos de fórmula (XXIV) son, por ejemplo, N-[2-fluoro-4-(isocianatometil)bencil] acetamida, N-[2-bromo-4-(isocianato-metil)bencil] acetamida, N-[2-yodo-4-(isocianatometil)bencil] acetamida, N-[2-metil-4-(isocianatometil)bencil] acetamida y N-[2-ciano-4-(isocianatometil)bencil] acetamida.

Los compuestos de la fórmula (XXV) pueden ser sintetizados de acuerdo con procedimiento descrito para la preparación de compuestos de fórmula (II). Algunos ejemplos representativos son, por ejemplo, N-{2-bromo-4-[4-(3,5-diclorofenil)-4-(trifluorometil)-3,4-dihidro-2H-pirrol-2-il]bencil} acetamida y N-{2-bromo-4-[4-(3,5-diclorofenil)-4-(trifluorometil)-3,4-dihidro-2H-pirrol-2-il]bencil} benzamida.

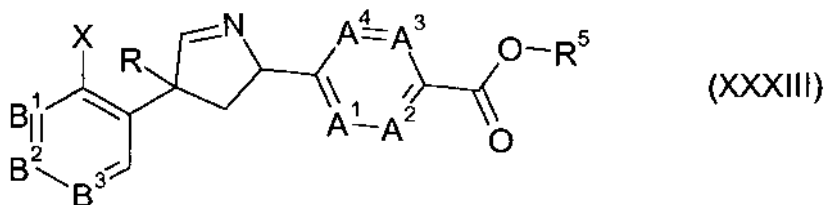
Algunos compuestos adecuados de la fórmula (XXVI) para el uso en el procedimiento de producción (m) son, por ejemplo, formamida, acetamida, propionamida, 2,2,2-trifluoroacetamida, benzamida, carbamato de etilo o etanotioamida.

El procedimiento de producción (f) puede llevarse a cabo en las mismas condiciones según se han descrito para el procedimiento de producción (e).

Los compuestos de la fórmula (XXVIII) pueden obtenerse mediante la reacción de los compuestos de la fórmula (XXXII):



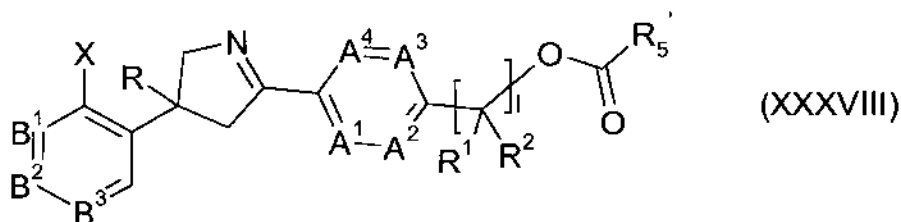
en la que A¹ a A⁴, y R⁵ tienen los mismos significados según se han definido en el presente documento, con los compuestos de la fórmula (XII), para obtener los compuestos de la fórmula (XXXIII):



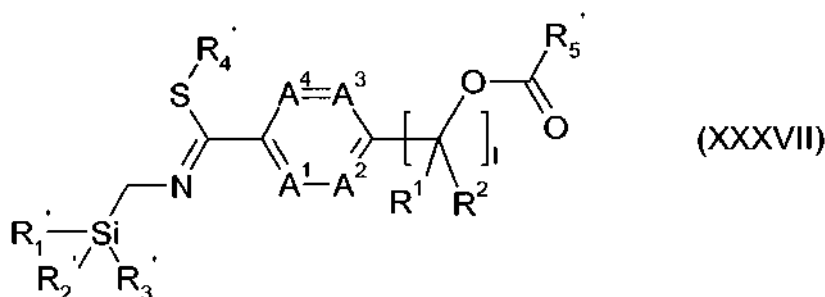
en la que A¹ a A⁴, B¹ a B³, X, R, R⁵ tienen los mismos significados según se han definido en el presente documento, seguido de la etapa del cambio de un doble enlace imino en condiciones básicas.

Algunos compuestos representativos de la fórmula (XXX) son, por ejemplo, 2-bromo-4-(isocianometil)-1-metilbenceno, 2-ciano-4-(isocianometil)-1-metilbenceno y 2-bromo-4-(isocianometil)-1-etilbenceno.

Además, los compuestos de la fórmula (XXXVIII)

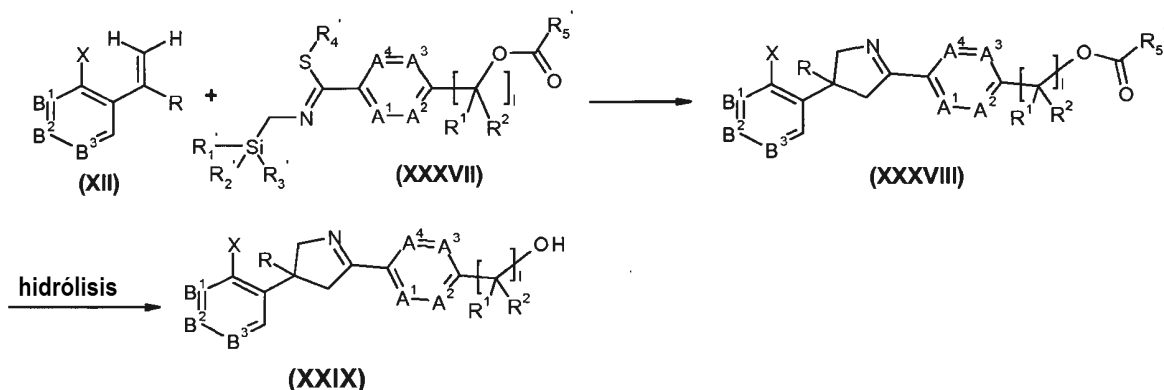


5 en la que A¹ a A⁴, B¹ a B³, X, R, R¹, R², R⁵ e I tienen los mismos significados según se han definido en el presente documento, también pueden ser sintetizados mediante la reacción de los compuestos de la fórmula (XXXVII)



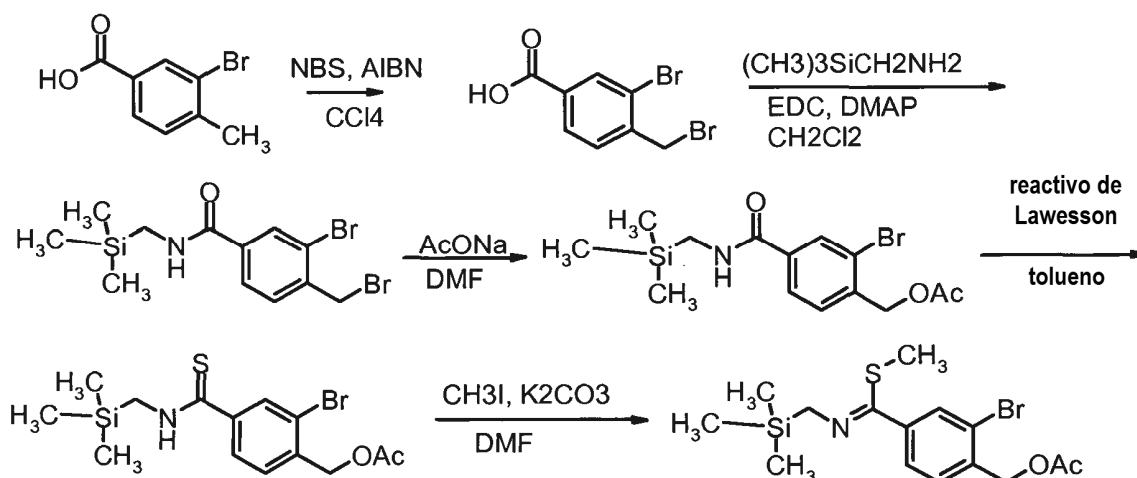
10 en la que
 R¹, R², A¹ a A⁴ y I tienen los mismos significados según se han definido en el presente documento y en la que R¹, R² y R³ representan cada uno independientemente alquilo opcionalmente sustituido o fenilo opcionalmente sustituido; y R⁴ representa hidrógeno; o un grupo químico elegido de entre alquilo opcionalmente sustituido, alquenilo, alquinilo; o bencilo opcionalmente sustituido; y R⁵ representa hidrógeno, alquilo opcionalmente sustituido o fenilo opcionalmente sustituido;
 15 con los compuestos de fórmula (XII), si fuera apropiado, en presencia de un reactivo de flúor y de un haluro de alquilo (preferiblemente yoduro de metilo cuando R⁴ representa hidrógeno).

Los compuestos de fórmula (XXIX) pueden ser sintetizados sometiendo los compuestos de fórmula (XXXVIII) a una hidrólisis mediante el uso de procedimientos conocidos.



20 Los compuestos de fórmula (XXIX) se hacen reaccionar entonces con cloruro de metansulfonilo o con un agente halogenante para producir los compuestos de acuerdo con la invención.

Los compuestos de la fórmula (XXXVII) pueden ser sintetizados de acuerdo con el proceso de reacción ilustrado en el esquema de reacción 11.

Esquema de reacción 11:

en la que NBS representa N-bromosuccinimida, AIBN representa azobisisobutironitrilo, EDC representa 1-etil-3-(3-dimetilaminopropil)-carbodiimida, DMAP representa 4-(dimetilamino)piridina, DMF representa N,N-dimetilformamida y reactivo de Lawesson representa 2,4-bis(4-metoxifenil)-1,3-ditia-2,4-difosfetano-2,4-disulfuro.

Los compuestos de la fórmula (XXXVII) son, por ejemplo, acetato de 2-bromo-4-[(metilsulfanil){[(trimetilsilil)metil]imino}metil] bencilo, acetato de 2-cloro-4-[(metilsulfanil)-{[(trimetilsilil)metil]imino}metil] bencilo, acetato de 2-trifluorometil-4-[(metilsulfanil)-{[(trimetilsilil)metil]imino}metil] bencilo, acetato de 6-[(metilsulfanil){[(trimetilsilil)metil]imino}metil]-2-(trifluorometil)piridin-3-il] metilo y acetato de 6-[(metilsulfanil)-{[(trimetilsilil)metil]imino}metil]-4-(trifluorometil)piridin-3-il] metilo.

Adicionalmente, el procedimiento de producción para la preparación de los compuestos de la fórmula (XXXVIII) puede realizarse de acuerdo con los procedimientos descritos en The Journal of Organic Chemistry, Vol. 52, págs. 1027 - 1035 (1987).

El procedimiento de producción para la preparación de los compuestos de la fórmula (XXXVIII) puede llevarse a cabo en un diluyente apropiado, mediante el uso de un reactivo de flúor tal como fluoruro de potasio, o fluoruro de tetrametilamonio, fluoruro de tetraetilamonio o fluoruro de tetrabutilamonio, y puede realizarse a unas temperaturas de entre aproximadamente -78 y aproximadamente 100 °C, preferiblemente de entre -10 y aproximadamente 50 °C. Adicionalmente, es deseable llevar a cabo la reacción a la presión normal, es decir, a 1.013 mbar, pero la reacción también puede realizarse bajo presión, es decir, por encima de 1.013 mbar o a una presión reducida, es decir, por debajo de 1.013 mbar. El tiempo de reacción es de entre 0,1 y 10 horas, preferiblemente de entre 1 y 5 horas.

Para llevar a cabo el procedimiento de producción de los compuestos de la fórmula (XXXVIII), por ejemplo, cuando se hace reaccionar 1 mol de los de los compuestos de fórmula (XXXVII) con 1 mol de los compuestos de fórmula (XII) en un diluyente tal como THF, en presencia de 0,1 mol del agente de fluoración, tal como fluoruro de tetrabutilamonio, puede obtenerse el compuesto de fórmula (XXXVIII).

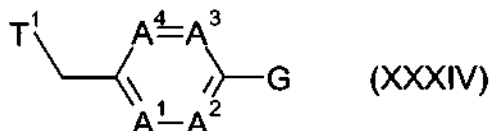
Algunos compuestos de la fórmula (XXXVIII) son, por ejemplo, acetato de 2-bromo-4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)-3,4-dihidro-2H-pirrol-5-il] bencilo, acetato de 2-cloro-4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)-3,4-dihidro-2H-pirrol-5-il] bencilo, acetato de 2-ciano-4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)-3,4-dihidro-2H-pirrol-5-il] bencilo, acetato de 2-trifluorometil-4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)-3,4-dihidro-2H-pirrol-5-il] bencilo, acetato de 2-bromo-4-[3-(3,5-dibromofenil)-3-(trifluorometil)-3,4-dihidro-2H-pirrol-5-il] bencilo, acetato de 2-cloro-4-[3-(3,5-dibromofenil)-3-(trifluorometil)-3,4-dihidro-2H-pirrol-5-il] bencilo, acetato de 2-ciano-4-[3-(3,5-dibromofenil)-3-(trifluorometil)-3,4-dihidro-2H-pirrol-5-il] bencilo, acetato de 2-bromo-4-[3-(3,5-bistrifluorometilfenil)-3-(trifluorometil)-3,4-dihidro-2H-pirrol-5-il] bencilo, acetato de 2-cloro-4-[3-(3,5-bistrifluorometilfenil)-3-(trifluorometil)-3,4-dihidro-2H-pirrol-5-il] bencilo, acetato de 2-ciano-4-[3-(3,5-bistrifluorometilfenil)-3-(trifluorometil)-3,4-dihidro-2H-pirrol-5-il] bencilo, acetato de 2-trifluorometil-4-[3-(3,5-bistrifluorometilfenil)-3-(trifluorometil)-3,4-dihidro-2H-pirrol-5-il] bencilo, acetato de 2-bromo-4-[3-(3,4,5-tricloro-fenil)-3-(trifluorometil)-3,4-dihidro-2H-pirrol-5-il] bencilo, acetato de 2-cloro-4-[3-(3,4,5-triclorofenil)-3-(trifluorometil)-3,4-dihidro-2H-pirrol-5-il] bencilo, acetato de 2-ciano-4-[3-(3,4,5-triclorofenil)-3-(trifluorometil)-3,4-dihidro-2H-pirrol-5-il] bencilo, acetato de 2-trifluorometil-4-[3-(3,4,5-triclorofenil)-3-(trifluorometil)-3,4-dihidro-2H-pirrol-5-il] bencilo, acetato de 6-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)-3,4-dihidro-2H-pirrol-5-il]-2-(trifluorometil)-piridin-3-il] metilo y acetato de 6-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)-3,4-dihidro-2H-pirrol-5-il]-4-(trifluorometil)piridin-3-il] metilo.

Algunos compuestos de amida adecuados de la fórmula (XI) en el procedimiento de producción (g) son, por ejemplo, acetamida, 2,2,2-trifluoroacetamida, 2,2,2-trifluoro-N-metilacetamida, pirrolidin-2-ona, piperidin-2-ona y N-(piridin-2-ilmetil) acetamida.

5 El procedimiento de producción (g) puede llevarse a cabo en las mismas condiciones según se han descrito para el procedimiento de producción (e).

Los compuestos de la fórmula (II), de la fórmula (XIII), de la fórmula (XV), de la fórmula (XX) y de la fórmula (XXIV) son compuestos nuevos.

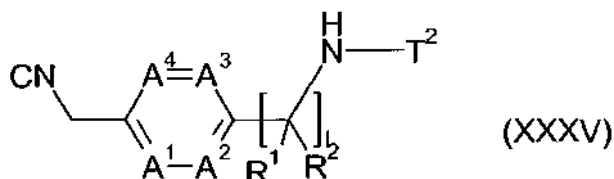
Los compuestos de las fórmulas (XIII) y (XV) están representados por la fórmula general (XXXIV)



10 en la que T^1 representa $-NH-CH=O$ o $-N=C$; y en la que A^1 a A^4 y G tienen los mismos significados según se han definido en el presente documento.

15 Los compuestos de fórmula general (XXXIV) son intermedios útiles para la preparación de los compuestos de acuerdo con la invención. A saber, como compuestos de acuerdo con la invención pueden prepararse haciendo reaccionar un compuesto de fórmula (XII) con un compuesto de fórmula (XXXIV) para dar un compuesto de fórmula (II) e induciendo posteriormente el cambio del doble enlace imino en condiciones básicas tal como se ha descrito en el procedimiento de preparación (a).

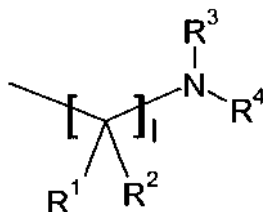
Los compuestos de las fórmulas (XX) y (XXIV) están representados por la fórmula general (XXXV)



20 en la que T^2 representa R^3 o R^4 ; y A^1 a A^4 , R^1 , R^2 , R^3 , R^4 y 1 tienen los mismos significados según se han definido en el presente documento.

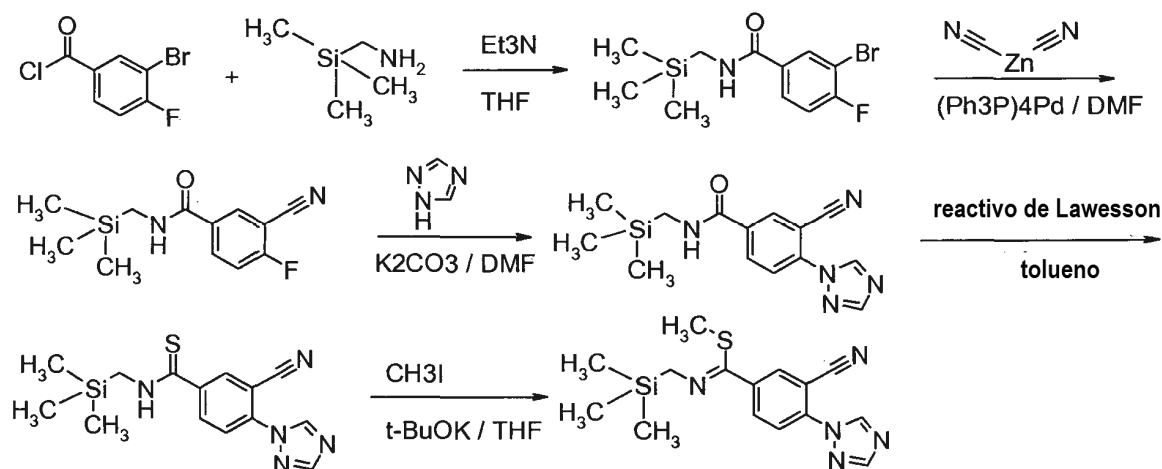
25 Los compuestos de fórmula general (XXXV) son intermedios útiles para la preparación de compuestos. A saber, como compuestos pueden prepararse haciendo reaccionar un compuesto de fórmula (XII) con un compuesto de fórmula (XXXV) para dar un compuesto de fórmula (II) e induciendo posteriormente el cambio del doble enlace imino en condiciones básicas tal como se ha descrito en el procedimiento de preparación (a).

Los compuestos de fórmula (XXXV) pueden entenderse como compuestos de fórmula (XXXIV) en los que T^1 representa CN y G representa un grupo



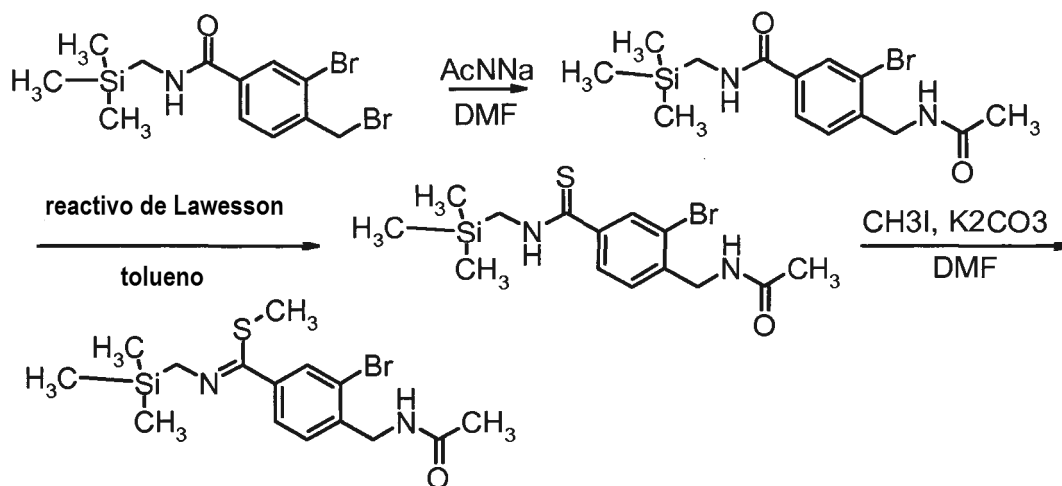
30 en la que cualquiera de R^3 o R^4 representa H y en la que A^1 a A^4 y R^1 , R^2 y cualquiera de R^3 o R^4 y 1 tienen los significados según se define en el presente documento.

El esquema de reacción 12 muestra un procedimiento de síntesis para la preparación de los compuestos de la fórmula (XXXVI), en el que G representa un grupo heterocíclico saturado o insaturado opcionalmente sustituido de 5 o 6 miembros.

Esquema de reacción 12:

en la que Et_3N representa trietilamina, THF representa tetrahidrofurano, $(\text{Ph}_3\text{P})_4\text{Pd}$ representa tetraquis(trifenilfosfina) paladio, DMF representa N,N-dimetilformamida, el reactivo de Lawesson representa 2,4-bis(4-metoxifenil)-1,3-ditia-2,4-difosfetano-2,4-disulfuro y t-BuOK representa t-butoxicarbonilo.

El esquema de reacción 13 muestra un procedimiento de síntesis para la preparación de los compuestos de la fórmula (XXXVI), en el que G representa un grupo químico $-(\text{CR}^1\text{R}^2)_1-\text{NR}^3\text{R}^4$ según se ha definido en el presente documento.

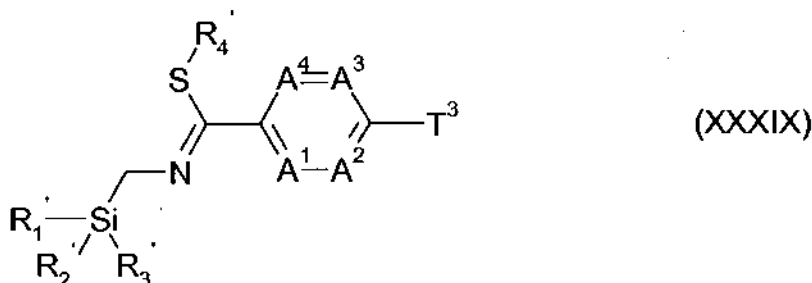
Esquema de reacción 13

en la que AcNH_2 representa acetato de amonio, NaH representa hidruro de sodio, DMF representa N,N-dimetilformamida y el reactivo de Lawesson representa 2,4-bis(4-metoxifenil)-1,3-ditia-2,4-difosfetano-2,4-disulfuro.

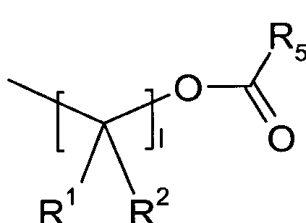
Algunos compuestos de la fórmula (XXXVI) son, por ejemplo, 3-bromo-4-(1H-1,2,4-triazol-1-il)-N-[(trimetilsilil)metil] benzenocarbimidotioato de metilo, 3-cloro-4-(1H-1,2,4-triazol-1-il)-N-[(trimetilsilil)metil] benzenocarbimidotioato de metilo, 3-trifluorometil-4-(1H-1,2,4-triazol-1-il)-N-[(trimetilsilil)metil] benzenocarbimidotioato de metilo, 3-ciano-4-(1H-1,2,4-triazol-1-il)-N-[(trimetilsilil)metil] benzenocarbimidotioato de metilo, 3-bromo-4-(1H-1,2,4-triazol-1-il)-N-[(trimetilsilil)metil] benzenocarbimidotioato de etilo, 3-bromo-4-(1H-1,2,4-triazol-1-il)-N-[(t-butildimetilsilil)metil] benzenocarbimidotioato de metilo, 4-[(acetilamino)metil]-3-bromo-N-[(trimetilsilil)metil] benzenocarbimidotioato de metilo, 4-[(acetilamino)metil]-3-cloro-N-[(trimetilsilil)metil] benzenocarbimidotioato de metilo, 4-[(acetilamino)metil]-3-trifluorometil-N-[(trimetilsilil)metil] benzenocarbimidotioato de metilo, 4-[(acetilamino)metil]-3-ciano-N-[(trimetilsilil)metil] benzenocarbimidotioato de metilo, 4-[(acetilamino)metil]-3-bromo-N-[(trimetilsilil)metil] benzenocarbimidotioato de etilo, 4-[(acetilamino)metil]-3-bromo-N-[(t-butildimetilsilil)metil] benzenocarbimidotioato de metilo y 4-[(acetilamino)metil]-3-bromo-N-[(t-butildimetilsilil)metil] benzenocarbimidotioato de metilo.

El procedimiento de producción (p) puede llevarse a cabo las mismas condiciones según se han descrito en para el procedimiento de producción de los compuestos de la fórmula (XXXVIII).

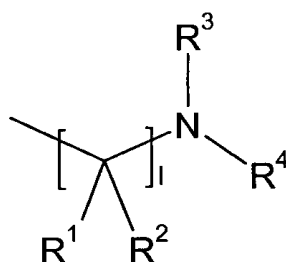
Los compuestos de las fórmulas (XXXVI) y (XXXVII) están representados por la fórmula general (XXXIX).



- 5 en la que T³ representa un halógeno, tal como flúor, cloro, bromo o yodo, el grupo químico G según se ha definido en el presente documento o representa uno de los siguientes grupos químicos:



o



en los que R¹, R², R³, R⁴, R⁵ y 1 tienen los mismos significados a los mencionados anteriormente, y R₁['], R₂['], R₃['], R₄['] y A¹ a A⁴ tienen los mismos significados según se han definido en el presente documento.

- 15 Los compuestos de fórmula general (XXXIX) son intermedios útiles para la preparación de los compuestos de acuerdo con la invención. A saber, como compuestos de acuerdo con la invención, pueden prepararse haciendo reaccionar un compuesto de fórmula (XII) con un compuesto de fórmula (XXXIX) en presencia de un reactivo de flúor si R₄['] no representa H. En el caso de que R₄['] represente H, la reacción puede realizarse en una reacción en un único recipiente añadiendo en primer lugar un haluro de alquilo, tal como yoduro de metilo, y añadiendo después un
- 20 reactivo de flúor.

Los compuestos de la fórmula (XXXIX) son, por ejemplo, los mencionados en las respectivas tablas, así como 3-ciano-4-fluoro-N-[(trimetilsilil)metil] bencenocarbimidotioato de metilo.

- 25 De acuerdo con la invención se prefiere que en cada compuesto que se ha descrito en el presente documento mediante el uso de una fórmula general (tal como, por ejemplo, los compuestos (XIII), (XV), (XXXIV), (XX), (XXIV), (XXXV), (XXXVI), (XXXVII), (XXXIX)), particularmente en aquellos compuestos que son útiles para la preparación de los compuestos de acuerdo con la invención, al menos 3 de los grupos A¹ a A⁴ representen C-Y, mientras que A¹ y A⁴ representen ambos C-Y y/o en los que al menos 2 de los grupos B¹ a B³ representen C-X y, si fuera apropiado, R represente CF₃.

- 30 Es particularmente preferido que en cualquiera de dichos compuestos, todos los grupos A¹ a A⁴ representen C-Y, y/o todos los grupos B¹ a B³ representen C-X y, si fuera apropiado, R represente CF₃.

Los compuestos de acuerdo con la presente invención muestran una potente acción insecticida, y por lo tanto pueden usarse como insecticida. Adicionalmente, los compuestos de acuerdo con la presente invención muestran un fuerte efecto de control frente a insectos perjudiciales, sin imponer ningún efecto secundario perjudicial del fármaco

sobre las plantas cultivadas. Los compuestos de la presente invención pueden por lo tanto usarse para el control de una amplia variedad de especies de plagas, por ejemplo, insectos succionadores perjudiciales, insectos masticadores, así como otras plagas parásitas vegetales, insectos de almacenes, plagas sanitarias y similares, y pueden ser aplicados con el fin de la desinfestación y la exterminación de los mismos. Algunas plagas de animales perjudiciales son, por ejemplo:

de insectos, coleópteros, por ejemplo, *Callosobruchus chinensis*, *Sitophilus zeamais*, *Tribolium castaneum*, *Epilachna vigintioctomaculata*, *Agriotes fuscicollis*, *Anomala rufocuprea*, *Leptinotarsa decemlineata*, *Diabrotica* spp., *Monochamus alternatus*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Lyctus brunneus*, *Aulacophora femoralis*; lepidópteros, por ejemplo, *Lymantria dispar*, *Malacosoma neustria*, *Pieris rapae*, *Spodoptera litura*, *Mamestra brassicae*, *Chilo suppressalis*, *Pirautia nubilalis*, *Ephestia cautella*, *Adoxophyes orana*, *Carpocapsa pomonella*, *Agrotis fuscata*, *Galleria mellonella*, *Plutella maculipennis*, *Heliothis virescens*, *Phyllocnistis citrella*; hemípteros, por ejemplo, *Nephotettix cincticeps*, *Nilaparvata lugens*, *Pseudococcus comstocki*, *Unaspis yanonensis*, *Myzus persicae*, *Aphis pomi*, *Aphis gossypii*, *Rhopalosiphum pseudobrassicarum*, *Stephanitis nashi*, *Nezara* spp., *Trialeurodes vaporariorum*, *Psylla* spp.; tisanópteros, por ejemplo, *Thrips palmi*, *Franklinella occidentalis*; ortópteros, por ejemplo, *Blattella germanica*, *Periplaneta americana*, *Grylotalpa africana*, *Locusta migratoria migratorioides*; isópteros, por ejemplo, *Reticulitermes speratus*, *Coptotermes formosanus*; dípteros, por ejemplo, *Musca domestica*, *Aedes aegypti*, *Hylemyia platura*, *Culex pipiens*, *Anopheles sinensis*, *Culex tritaeniorhynchus*, *Liriomyza trifolii*.

De ácaros, por ejemplo, *Tetranychus cinnabarinus*, *Tetranychus urticae*, *Panonychus citri*, *Aculops pelekassi*, *Tarsonemus* spp.

De nematodos, por ejemplo, *Meloidogyne incognita*, *Bursaphelenchus ligniculus* Mamiya et Kiyohara, *Aphelenchoides besseyi*, *Heterodera glycines*, *Pratylenchus* spp.

Adicionalmente, los compuestos de acuerdo con la presente invención muestran una buena tolerancia en las plantas y una toxicidad favorable para los animales de sangre caliente, y son bien tolerados por el medio ambiente y por lo tanto son adecuados para proteger plantas y partes de plantas.

La aplicación de los compuestos de la invención puede dar como resultado un aumento en el rendimiento de la cosecha, una mejora en la calidad del material cosechado. Adicionalmente, los compuestos pueden usarse para el control de plagas de animales, en particular de insectos, arácnidos, helmintos, nematodos y moluscos, que se encuentran en la agricultura, en la horticultura, en el campo de la medicina veterinaria, en bosques, en jardines y en instalaciones de ocio, en la protección de productos almacenados y de materiales, y en el sector sanitario. Preferiblemente se emplean como agentes de protección de plantas. Son activos frente a especies normalmente sensibles y resistentes, y frente a todas o algunas etapas de desarrollo. Estas plagas incluyen, entre otras:

del orden Anoplura (Phthiraptera), por ejemplo, *Damalinea* spp., *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Trichodectes* spp.

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

De la clase Bivalva, por ejemplo, *Dreissena* spp.

Del orden Chilopoda, por ejemplo, *Geophilus* spp., *Scutigera* spp.

Del orden Coleoptera, por ejemplo, *Acanthoscelides obtectus*, *Adoretus* spp., *Agelastica alni*, *Agriotes* spp., *Amphimallon solstitialis*, *Anobium punctatum*, *Anoplophora* spp., *Anthonomus* spp., *Anthrenus* spp., *Apogonia* spp., *Atomaria* spp., *Attagenus* spp., *Bruchidius obtectus*, *Bruchus* spp., *Ceuthorrhynchus* spp., *Cleonus mendiculus*, *Conoderus* spp., *Cosmopolites* spp., *Costelytra zealandica*, *Curculio* spp., *Cryptorhynchus lapathi*, *Dermestes* spp., *Diabrotica* spp., *Epilachna* spp., *Faustinus cubae*, *Gibbium psyllioides*, *Heteronychus arator*, *Hylamorpha elegans*, *Hylotrupes bajulus*, *Hypera postica*, *Hypothenemus* spp., *Lachnosterna consanguinea*, *Leptinotarsa decemlineata*, *Lissorhoptrus oryzophilus*, *Lixus* spp., *Lyctus* spp., *Meligethes aeneus*, *Melolontha melolontha*, *Migdolus* spp., *Monochamus* spp., *Naupactus xanthographus*, *Niptus hololeucus*, *Oryctes rhinoceros*, *Oryzaephilus surinamensis*, *Otiorrhynchus sulcatus*, *Oxycetonia jucunda*, *Phaedon cochleariae*, *Phyllophaga* spp., *Popillia japonica*, *Premnotypes* spp., *Psylliodes chrysocephala*, *Ptinus* spp., *Rhizobius ventralis*, *Rhizophora dominica*, *Sitophilus* spp., *Sphenophorus* spp., *Sternechus* spp., *Symphyletes* spp., *Tenebrio molitor*, *Tribolium* spp., *Trogoderma* spp., *Tychius* spp., *Xylotrechus* spp., *Zabrus* spp.

Del orden Collembola, por ejemplo, *Onychiurus armatus*.

Del orden Dermaptera, por ejemplo, *Forficula auricularia*.

Del orden Diplopoda, por ejemplo, *Blaniulus guttulatus*.

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

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

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

Adicionalmente es posible controlar protozoos, tales como *Eimeria*.

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

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

Del orden Hymenoptera, por ejemplo, *Diprion* spp., *Hoplocampa* spp., *Lasius* spp., *Monomorium pharaonis*, *Vespa* spp.

Del orden Isopoda, por ejemplo, *Armadillidium vulgare*, *Oniscus asellus*, *Porcellio scaber*.

Del orden Isoptera, por ejemplo, *Reticulitermes* spp., *Odontotermes* spp.

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

Del orden Orthoptera, por ejemplo, *Acheta domesticus*, *Blatta orientalis*, *Blattella germanica*, *Grylotalpa* spp., *Leucophaea maderae*, *Locusta* spp., *Melanoplus* spp., *Periplaneta americana*, *Schistocerca gregaria*.

Del orden Siphonaptera, por ejemplo, *Ceratophyllus* spp., *Xenopsylla cheopis*.

Del orden Symphyla, por ejemplo, *Scutigera* spp.

- 5 Del orden Thysanoptera, por ejemplo, *Baliothrips biformis*, *Enneothrips flavens*, *Frankliniella* spp., *Heliethrips* spp., *Hercinothrips femoralis*, *Kakothrips* spp., *Rhipiphorothrips cruentatus*, *Scirtothrips* spp., *Taeniothrips cardamoni*, *Thrips* spp.

Del orden Thysanura, por ejemplo, *Lepisma saccharina*.

- 10 Algunos nematodos fitoparásitos incluyen, por ejemplo, *Anguina* spp., *Aphelenchoides* spp., *Belonoaimus* spp., *Bursaphelenchus* spp., *Ditylenchus dipsaci*, *Globodera* spp., *Heliocotylenchus* spp., *Heterodera* spp., *Longidorus* spp., *Meloidogyne* spp., *Pratylenchus* spp., *Radopholus similis*, *Rotylenchus* spp., *Trichodorus* spp., *Tylenchorhynchus* spp., *Tylenchulus* spp., *Tylenchulus semipenetrans*, *Xiphinema* spp.

- 15 Todas las plantas y partes de plantas pueden tratarse de acuerdo con la invención. Debe entenderse que las plantas significan, en el presente contexto, todas las plantas y poblaciones de plantas tales como plantas silvestres deseadas y no deseadas o plantas de cosecha (incluyendo plantas de cosecha naturales). Las plantas de cosecha pueden ser plantas que pueden obtenerse mediante procedimientos de siembra y optimización vegetal convencionales, o mediante procedimientos de ingeniería genética y biotecnológica, o mediante combinaciones de estos procedimientos, incluyendo las plantas transgénicas e incluyendo los cultivos de plantas protegidos o no protegidos por los derechos de los agricultores. Debe entenderse que las partes de las plantas significan todas las partes y órganos de las plantas por encima y por debajo del suelo, tales como vástagos, hojas, flores y raíces, siendo algunos ejemplos que pueden mencionarse las hojas, acículas, los troncos, los tallos, las flores, los cuerpos frutales, los frutos, las semillas, las raíces, los tubérculos y los rizomas. Las partes de plantas también incluyen el material cosechado y el material de propagación vegetativo y generativo, por ejemplo, esquejes, tubérculos, rizomas, ramas y semillas.

- 25 El tratamiento de acuerdo con la invención de las plantas y de las partes de plantas con los compuestos activos se realiza directamente o dejando actuar los compuestos en sus alrededores, en su hábitat o en su espacio de almacenamiento mediante los procedimientos de tratamiento habituales, por ejemplo, mediante inmersión, pulverización, evaporación, nebulización, dispersión, pintando, inyectando, y en el caso de material de propagación, en particular, en el caso de semillas, también mediante la aplicación de uno o más recubrimientos.

- 30 Como ya se ha mencionado anteriormente, es posible tratar todas las plantas y partes de plantas de acuerdo con la invención. En una forma de realización preferida, se tratan especies vegetales silvestres y cultivos vegetales, o los obtenidos mediante procedimientos de cruce biológico convencionales, tales como el cruce o la fusión de protoplastos y partes de los mismos. En una forma de realización preferida adicional, se tratan plantas transgénicas y cultivos de plantas obtenidos mediante procedimientos de ingeniería genética, si fuera apropiado, junto con procedimientos convencionales (organismos modificados genéticamente) y partes de los mismos. Los términos "partes", "partes de plantas" y "partes vegetales" se han explicado anteriormente.

- 35 Particularmente preferiblemente, se tratan de acuerdo con la invención las plantas de los cultivares de plantas que en cada caso están disponibles comercialmente o en uso. Se entiende que los cultivares de plantas significan plantas con nuevas propiedades ("atributos") que se han obtenido mediante un cruce convencional, mediante mutagénesis o mediante técnicas de ADN recombinante. Éstos pueden ser cultivares, bio o genotipos.

- 40 Dependiendo de la especie de planta o de los cultivares de planta, de su ubicación y de sus condiciones de crecimiento (suelo, clima, periodo de vegetación, dieta), el tratamiento de acuerdo con la invención también puede dar como resultado unos efectos superaditivos "sinérgicos". Por lo tanto, por ejemplo, son posibles unos índices de aplicación reducidos y/o una ampliación del espectro de actividad y/o un aumento en la actividad de las sustancias y de las composiciones que pueden usarse de acuerdo con la invención, un mejor crecimiento vegetal, un aumento en la tolerancia a temperaturas altas o bajas, un aumento en la tolerancia a la sequía o al agua o al contenido salino del suelo, un aumento en el rendimiento de floración, mayor facilidad de cosechado, maduración acelerada, mayores rendimientos de cosecha, mayor calidad y/o un valor nutricional mayor de los productos cosechados, una mejor estabilidad de almacenamiento y/o procesabilidad de los productos cosechados, que superan los efectos que de hecho se esperaban.

- 50 Las plantas transgénicas o los cultivares de plantas (obtenidos mediante ingeniería genética) preferidos que van a ser tratados de acuerdo con la invención incluyen todas las plantas que, en virtud de la modificación genética, recibieron material genético que imparte unos atributos útiles particularmente ventajosos a estas plantas. Algunos ejemplos de dichos atributos son un mejor crecimiento vegetal, un aumento en la tolerancia a temperaturas altas o bajas, un aumento en la tolerancia a la sequía o al agua o al contenido salino del suelo, un aumento en el rendimiento de floración, mayor facilidad de cosechado, maduración acelerada, mayores rendimientos de cosecha, mayor calidad y/o un valor nutricional mayor de los productos cosechados, una mejor estabilidad de almacenamiento

y/o procesabilidad de los productos cosechados. Algunos ejemplos adicionales y particularmente enfatizados de dichos atributos son una mejor defensa de las plantas frente a plagas animales y microbianas, tales como frente a insectos, ácaros, hongos fitopatógenos, bacterias y/o virus, y también un aumento de la tolerancia de las plantas a ciertos compuestos herbicidamente activos. Algunos ejemplos de plantas transgénicas que pueden mencionarse son las cosechas vegetales importantes, tales como cereales (trigo, arroz), maíz, soja, patatas, remolacha azucarera, tomates, guisantes y otras variedades vegetales, algodón, tabaco, colza, y también plantas frutales (con las frutas manzanas, peras, frutas cítricas y uvas) y se hace particular énfasis al maíz, la soja, las patatas, el algodón, el tabaco y la colza. Los atributos que se enfatizan en particular son el aumento en la defensa de las plantas frente a insectos, arácnidos, nematodos y babosas y caracoles, en virtud de las toxinas formadas en las plantas, en particular aquellas formadas en las plantas por el material genético de *Bacillus thuringiensis* (por ejemplo, por los genes CryIA(a), CryIA(b), CryIA(c), CryIIA, CryIIIA, CryIIIB2, Cry9c, Cry2Ab, Cry3Bb y CryIF, y también combinaciones de los mismos) (denominados en el presente documento en lo sucesivo como "plantas Bt"). Los atributos que también se enfatizan particularmente son el aumento en la defensa de las plantas frente a hongos, bacterias y virus mediante una resistencia sistémica adquirida (SAR), sistemina, fitoalexinas, inductores y genes de resistencia y las correspondientemente proteínas y toxinas expresadas. Los atributos de plantas tolerantes más particularmente enfatizados son el aumento de la tolerancia de las plantas a ciertos compuestos herbicidamente activos, por ejemplo, imidazolinonas, sulfonilureas, glifosato o fosfinotricina (por ejemplo, el gen "PAT"). Los genes que imparten los atributos deseados en cuestión también pueden estar presentes junto con otro cualquiera en las plantas transgénicas. Algunos ejemplos de "plantas Bt" que pueden mencionarse son variedades de maíz, variedades de algodón, variedades de soja y variedades de patata que se venden con los nombres comerciales YIELD GARD® (por ejemplo, maíz, algodón, soja), KnockOut® (por ejemplo, maíz), StarLink® (por ejemplo, maíz), Bollgard® (algodón), Nucotn® (algodón) y NewLeaf® (patata). Algunos ejemplos de plantas tolerantes a los herbicidas que pueden mencionarse son variedades de maíz, variedades de algodón y variedades de soja que se venden con los nombres comerciales Roundup Ready® (tolerancia al glifosato, por ejemplo, maíz, algodón, soja), Liberty Link® (tolerancia a la fosfinotricina, por ejemplo, colza), IML® (tolerancia a las imidazolinonas) y STS® (tolerancia a las sulfonilureas, por ejemplo, maíz). Las plantas resistentes a herbicidas (plantas cultivadas de una manera convencional para una tolerancia a los herbicidas) que pueden mencionarse incluyen las variedades vendidas con el nombre Clearfield® (por ejemplo, maíz). Por supuesto, estas afirmaciones también se aplican a los cultivares de plantas con estos atributos genéticos o con atributos genéticos aún por desarrollar, a los cultivares de plantas que se desarrollarán y/o comercializarán en el futuro.

Las plantas enumeradas pueden tratarse de acuerdo con la invención de una forma particularmente ventajosa con los compuestos de acuerdo con la invención a una concentración adecuada.

Adicionalmente, en el campo de la medicina veterinaria, los nuevos compuestos de la presente invención pueden usarse eficazmente frente a varias plagas parásitas perjudiciales en animales (endoparásitos y ectoparásitos), por ejemplo, de insectos y de helmintos. Algunos ejemplos de dichas plagas parásitas de animales incluyen las plagas según se describen a continuación. Algunos ejemplos de insectos incluyen *Gasterophilus* spp., *Stomoxys* spp., *Trichodectes* spp., *Rhodnius* spp., *Ctenocephalides canis*, *Cimex lecturarius*, *Ctenocephalides felis*, *Lucilia cuprina*, y similares. Algunos ejemplos de ácaros incluyen *Ornithodoros* spp., *Ixodes* spp., *Boophilus* spp., y similares.

En el campo veterinario, es decir, en el campo de la medicina veterinaria, los compuestos activos de acuerdo con la presente invención son activos frente a parásitos de animales, en particular ectoparásitos o endoparásitos. El término endoparásitos incluye en particular helmintos, tales como cestodos, nematodos o trematodos y protozoos, tales como coccidios. Los ectoparásitos son normalmente y preferiblemente artrópodos, en particular insectos tales como moscas (picadoras y lamedoras), larvas de moscas parásitas, piojos, piojos capilares, piojos de aves, pulgas y similares; o acáridos, tales como garrapatas, por ejemplo, ixódidos, ixódidos o argásidos, o ácaros, tales como ácaros del género *Psoroptes*, larvas de *Eutrombicula alfreddugesi*, *Dermanyssus gallinae* y similares.

Estos parásitos incluyen:

del orden Anoplurida, por ejemplo, *Haematopinus* spp., *Linognathus* spp., *Pediculus* spp., *Phthirus* spp., *Solenopotes* spp.; algunos ejemplos particulares son: *Linognathus setosus*, *Linognathus vituli*, *Linognathus ovillus*, *Linognathus oviformis*, *Linognathus pedalis*, *Linognathus stenopsis*, *Haematopinus asini*, *macrocephalus*, *Haematopinus eurytenuis*, *Haematopinus suis*, *Pediculus humanus capitis*, *Pediculus humanus corporis*, *Phylloera vastatrix*, *Phthirus pubis*, *Solenopotes capillatus*;

del orden Mallophagida y los subórdenes Amblycerina y Ischnocerina, por ejemplo, *Trimenopon* spp., *Menopon* spp., *Trinoton* spp., *Bovicola* spp., *Werneckiella* spp., *Lepikentron* spp., *Damalina* spp., *Trichodectes* spp., *Felicola* spp.; algunos ejemplos particulares son: *Bovicola bovis*, *Bovicola ovis*, *Bovicola limbata*, *Damalina bovis*, *Trichodectes canis*, *Felicola subrostratus*, *Bovicola caprae*, *Lepikentron ovis*, *Werneckiella equi*;

del orden Diptera y los subórdenes Nematocera y Brachycera, por ejemplo, *Aedes* spp., *Anopheles* spp., *Culex* spp., *Simulium* spp., *Eusimulium* spp., *Phlebotomus* spp., *Lutzomyia* spp., *Culicoides* spp., *Chrysops* spp., *Odagmia* spp., *Wilhelmia* spp., *Hybomitra* spp., *Atylotus* spp., *Tabanus* spp., *Haematopota* spp., *Philipomyia* spp., *Braula* spp., *Musca* spp., *Hydrotaea* spp., *Stomoxys* spp., *Haematobia* spp., *Morelia* spp.,

5 Fannia spp., Glossina spp., Calliphora spp., Lucilia spp., Chrysomya spp., Wohlfahrtia spp., Sarcophaga spp., Oestrus spp., Hypoderma spp., Gasterophilus spp., Hippobosca spp., Lipoptena spp., Melophagus spp., Rhinosternus spp., Tipula spp.; algunos ejemplos particulares son: Aedes aegypti, Aedes albopictus, Aedes taeniorhynchus, Anopheles gambiae, Anopheles maculipennis, Calliphora erythrocephala, Chrysosoma pluvialis, Culex quinquefasciatus, Culex pipiens, Culex tarsalis, Fannia canicularis, Sarcophaga carnaria, Stomoxys calcitrans, Tipula paludosa, Lucilia cuprina, Lucilia sericata, Simulium reptans, Phlebotomus papatasi, Phlebotomus longipalpis, Odagmia ornata, Wilhelmia equina, Boophthora erythrocephala, Tabanus bromius, Tabanus spodopterus, Tabanus atratus, Tabanus sudeticus, Hybomitra ciurea, Chrysops caecutiens, Chrysops relictus, Haematopota pluvialis, Haematopota italica, Musca autumnalis, Musca domestica, Haematobia irritans irritans, Haematobia irritans exigua, Haematobia stimulans, Hydrotaea irritans, Hydrotaea albipuncta, Chrysomya cloropyga, Chrysomya bezziana, Oestrus ovis, Hypoderma bovis, Hypoderma lineatum, Przhivalskiana silenus, Dermatobia hominis, Melophagus ovinus, Lipoptena capreoli, Lipoptena cervi, Hippobosca variegata, Hippobosca equina, Gasterophilus intestinalis, Gasterophilus haemorroidalis, Gasterophilus inermis, Gasterophilus nasalis, Gasterophilus nigricornis, Gasterophilus pecorum, Braula coeca;

del orden Siphonaptera, por ejemplo, Pulex spp., Ctenocephalides spp., Tunga spp., Xenopsylla spp., Ceratophyllus spp.; algunos ejemplos particulares son: Ctenocephalides canis, Ctenocephalides felis, Pulex irritans, Tunga penetrans, Xenopsylla cheopis;

del orden Heteroptera, por ejemplo, Cimex spp., Triatoma spp., Rhodnius spp., Panstrongylus spp.

20 Del orden Blattellidae, por ejemplo, Blatta orientalis, Periplaneta americana, Blattella germanica, Supella spp. (por ejemplo, Supella longipalpa);

25 de la subclase Acari (Acarina) y los órdenes Meta y Mesostigmata, por ejemplo, Argas spp., Ornithodoros spp., Otobius spp., Ixodes spp., Amblyomma spp., Rhipicephalus (Boophilus) spp., Dermacentor spp., Haemaphysalis spp., Hyalomma spp., Dermanyssus spp., Rhipicephalus spp. (el género original de garrapatas con varios hospedadores) Ornithonyssus spp., Pneumonyssus spp., Raillietia spp., Pneumonyssus spp., Sternostoma spp., Varroa spp., Acarapis spp.; algunos ejemplos particulares son: Argas persicus, Argas reflexus, Ornithodoros moubata, Otobius megnini, Rhipicephalus (Boophilus) microplus, Rhipicephalus (Boophilus) decoloratus, Rhipicephalus (Boophilus) annulatus, Rhipicephalus (Boophilus) calceatus, Hyalomma anatolicum, Hyalomma aegypticum, Hyalomma marginatum, Hyalomma transiens, Rhipicephalus evertsi, Ixodes ricinus, Ixodes hexagonus, Ixodes canisuga, Ixodes pilosus, Ixodes rubicundus, Ixodes scapularis, Ixodes holociclus, Haemaphysalis concinna, Haemaphysalis punctata, Haemaphysalis cinnabarina, Haemaphysalis otophila, Haemaphysalis leachi, Haemaphysalis longicornis, Dermacentor marginatus, Dermacentor reticulatus, Dermacentor pictus, Dermacentor albipictus, Dermacentor andersoni, Dermacentor variabilis, Hyalomma mauritanicum, Rhipicephalus sanguineus, Rhipicephalus bursa, Rhipicephalus appendiculatus, Rhipicephalus capensis, Rhipicephalus turanicus, Rhipicephalus zambeziensis, Amblyomma americanum, Amblyomma variegatum, Amblyomma maculatum, Amblyomma hebraeum, Amblyomma cajennense, Dermanyssus gallinae, Ornithonyssus bursa, Ornithonyssus sylviarum, Varroa jacobsoni;

40 del orden Actinoptera (Prostigmata) y Acaridida (Astigmata), por ejemplo, Acarapis spp., Cheyletiella spp., Ornithocheyletiella spp., Myobia spp., Psorergates spp., Demodex spp., Trombicula spp., Listrophorus spp., Acarus spp., Tyrophagus spp., Caloglyphus spp., Hypodectes spp., Pterolichus spp., Psoroptes spp., Chorioptes spp., Otodectes spp., Sarcoptes spp., Notoedres spp., Knemidocoptes spp., Cytodites spp., Laminosioptes spp.; algunos ejemplos particulares son: Cheyletiella yasguri, Cheyletiella blakei, Demodex canis, Demodex bovis, Demodex ovis, Demodex caprae, Demodex equi, Demodex caballi, Demodex suis, Neotrombicula autumnalis, Neotrombicula desalei, Neoschongastia xerothermobia, Trombicula akamushi, Otodectes cynotis, Notoedres cati, Sarcoptes canis, Sarcoptes bovis, Sarcoptes ovis, Sarcoptes rupicaprae (=S. caprae), Sarcoptes equi, Sarcoptes suis, Psoroptes ovis, Psoroptes cuniculi, Psoroptes equi, Chorioptes bovis, Psorergates ovis, Pneumonyssoides mange, Pneumonyssoides caninum, Acarapis woodi.

50 Los compuestos activos de acuerdo con la invención también son adecuados para controlar artrópodos, helmintos y protozoos, que ataquen a animales. Los animales incluyen ganado agrícola tal como, por ejemplo, vacas, ovejas, cabras, caballos, cerdos, burros, camellos, búfalos, conejos, pollos, pavos, patos, gansos, peces de piscifactoría, abejas melíferas. Además, algunos animales incluyen animales domésticos - también denominados animales de compañía - tales como, por ejemplo, perros, gatos, aves enjauladas, peces de acuario y lo que se conoce como animales experimentales, tales como, por ejemplo, hámsteres, cobayas, ratas y ratones.

55 Mediante el control de estos artrópodos, helmintos y/o protozoos, se pretende reducir las muertes y mejorar la producción (en el caso de carne, leche, lana, pieles, huevos, miel y similares) y la salud del animal hospedador, de forma que sea posible un mantenimiento más económico y simple mediante el uso de los compuestos activos de acuerdo con la invención.

Por ejemplo, es deseable prevenir o interrumpir la captación de sangre por parte de los parásitos desde los hospedadores (cuando sea aplicable). El control de los parásitos también puede ayudar a prevenir la transmisión de agentes infecciosos.

5 El término "controlar" según se usa en el presente documento con respecto al campo veterinario, significa que los compuestos activos son eficaces para reducir la incidencia del respectivo parásito, en un animal infestado con dichos parásitos, hasta unos niveles inocuos. Más específicamente, "controlar", según se usa en el presente documento, significa que el compuesto activo es eficaz eliminando el respectivo parásito, inhibiendo su crecimiento o inhibiendo su proliferación.

10 Generalmente, cuando se usan para el tratamiento de animales, los compuestos activos de acuerdo con la invención pueden aplicarse directamente. Preferiblemente se aplican en forma de composiciones farmacéuticas que pueden contener excipientes y/o auxiliares farmacéuticamente aceptables que son conocidos en la técnica.

15 En el campo veterinario y en el cuidado de animales, los compuestos activos se aplican (= se administran) de la forma conocida mediante una administración enteral en forma, por ejemplo, de comprimidos, cápsulas, bebidas, pociones, gránulos, pastas, bolos, procedimientos de alimentación artificial, supositorios; mediante una administración parenteral, tal como, por ejemplo, mediante inyecciones (intramuscular, subcutánea, intravenosa, intraperitoneal y similares), implantes, mediante aplicación nasal, mediante aplicación dérmica en forma, por ejemplo, de baños o inmersiones, pulverizaciones, vertido y goteo, lavado, espolvoreado y con la ayuda de artículos formados que comprenden el compuesto activo tales como collares, etiquetas auriculares, etiquetas en la cola, bandas en las extremidades, ronzales, dispositivos de marcaje y similares. Los compuestos activos pueden
20 formularse como champús o como formaciones adecuadas utilizables en aerosoles, en pulverizadores no presurizados, por ejemplo, pulverizadores de bomba y pulverizadores atomizadores.

25 Cuando se usan en el ganado, en las aves, en los animales domésticos y similares, los compuestos activos de acuerdo con la invención pueden aplicarse en forma de formulaciones (por ejemplo, polvos, polvos humectables, ["WP"], emulsiones, concentrados emulsionables ["EC"], fluidos, concentrados homogéneos de soluciones y suspensiones ["SC"]) que comprenden los compuestos activos en una cantidad de entre el 1 y el 80 % en peso, tanto directamente como después de una dilución (por ejemplo, una dilución de entre 100 y 10.000 veces), o incluso en forma de un baño químico.

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

En la presente invención, una sustancia con acción insecticida frente a plagas que incluyen todas éstas se denomina insecticida.

35 Un compuesto activo de la presente invención puede prepararse en las formas de formulación convencionales, cuando se usa como insecticida. Algunos ejemplos de formas de formulación incluyen soluciones, emulsiones, polvos humectables, gránulos dispersables en agua, suspensiones, polvos, espumas, pastas, comprimidos, gránulos, aerosoles, materiales naturales y sintéticos infiltrados con el compuesto activo, microcápsulas, agentes de recubrimiento de semillas, formulaciones usadas con un aparato de combustión (por ejemplo, cartuchos de fumigación y de ahumado, latas, bobinas o similares como aparato de combustión), ULV (niebla fría, niebla cálida), y similares.

40 Estas formulaciones pueden producirse mediante procedimientos que son conocidos *per se*. Por ejemplo, una formulación puede producirse mezclando el compuesto activo con un revelador, es decir, un diluyente o portador líquido; un diluyente o portador de gas licuado; un diluyente o portador sólido y opcionalmente con un tensioactivo, es decir, un agente emulsionante y/o dispersante y/o espumante.

45 En el caso de usar agua como revelador, por ejemplo, también puede usarse un disolvente orgánico como disolvente auxiliar.

50 Algunos ejemplos de diluyente o portador líquido incluyen hidrocarburos aromáticos (por ejemplo, xileno, tolueno, alquilnaftaleno y similares), hidrocarburos aromáticos clorados o alifáticos clorados (por ejemplo, clorobenzenos, cloruros de etileno, cloruros de metileno), hidrocarburos alifáticos (por ejemplo, ciclohexanos), parafinas (por ejemplo, fracciones de aceite mineral), alcoholes (por ejemplo, butanol, glicoles y sus éteres, ésteres y similares), cetonas (por ejemplo, acetona, metil etil cetona, metil isobutil cetona, ciclohexanona y similares), disolventes fuertemente polares (por ejemplo, dimetilformamida, dimetilsulfóxido y similares), agua y similares.

El diluyente o portador de gas licuado puede ser uno que sea gaseoso a la temperatura normal y a la presión normal, por ejemplo, propulsores de aerosoles tales como butano, propano, gas nitrógeno, dióxido de carbono e hidrocarburos halogenados.

55 Algunos ejemplos de diluyente sólido incluyen minerales naturales pulverizados (por ejemplo, caolín, arcilla, talco, tiza, cuarzo, atapulgita, montmorillonita, tierra de diatomeas, y similares), minerales sintéticos pulverizados (por

ejemplo, ácido silícico muy dispersado, alúmina, silicatos y similares), y similares.

Algunos ejemplos de portador sólido para gránulos incluyen rocas pulverizadas y tamizadas (por ejemplo, calcita, mármol, piedra pómez, sepiolita, dolomita y similares), gránulos sintéticos de polvo inorgánico y orgánico, partículas finas de materiales orgánicos (por ejemplo, serrín, cáscaras de coco, mazorcas de maíz, tallos de tabaco y similares), y similares.

Algunos ejemplos de agente emulsionante y/o espumante incluyen emulsionantes no iónicos y aniónicos [por ejemplo, ésteres de ácidos grasos de polioxietileno, éteres de alcohol de ácidos grasos de polioxietileno (por ejemplo, alquilaril poliglicol éter, sulfonatos de alquilo, sulfatos de alquilo, sulfonatos de arilo y similares), hidrolizado de albúmina, y similares.

Algunos ejemplos de dispersantes incluyen aguas de desecho de sulfito de lignina y metil celulosa.

También pueden usarse agentes fijadores en las formulaciones (polvos, gránulos, emulsiones) y algunos ejemplos de los agentes fijadores incluyen carboximetil celulosa, polímeros naturales y sintéticos (por ejemplo, goma arábiga, alcohol polivinílico, acetato de polivinilo, y similares) y similares.

También pueden usarse colorantes, y algunos ejemplos de colorantes incluyen pigmentos inorgánicos (por ejemplo, óxido de hierro, óxido de titanio, azul de Prusia y similares), colorantes orgánicos tales como colorantes de alizarina, colorantes azo o colorantes metálicos de ftalocianina, y además, oligoelementos tales como sales de hierro, de manganeso, de boro, de cobre, de cobalto, de molibdeno y de cinc.

Las formulaciones pueden contener en general el principio activo en una cantidad que varía entre el 0,1 y el 95 % en peso, y preferiblemente entre el 0,5 y el 90 % en peso.

El compuesto de acuerdo con la presente invención también puede existir en una mezcla con otros compuestos activos, por ejemplo, insecticidas, cebos venenosos, bactericidas, acaricidas, nematocidas, fungicidas, reguladores del crecimiento, herbicidas y similares, en forma de sus formas de formulación útiles comercialmente y en las formas de aplicación preparadas a partir de esas formulaciones.

El contenido del compuesto de acuerdo con la presente invención en una forma de aplicación comercialmente útil puede variar en un amplio intervalo.

La concentración del compuesto activo de acuerdo con la presente invención en el uso real puede estar, por ejemplo, en el intervalo de entre el 0,0000001 y el 100 % en peso, y preferiblemente de entre el 0,00001 y el 1 % en peso.

Los compuestos de acuerdo con la presente invención pueden usarse mediante los procedimientos convencionales que sean apropiados para la forma de uso.

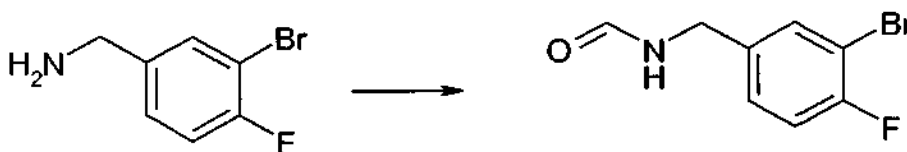
Cuando el compuesto activo de la presente invención se usa frente a plagas sanitarias y plagas asociadas con productos almacenados, tiene una estabilidad eficaz frente a todos los materiales alcalinos en cal, y también muestra una excelente eficacia residual en madera y suelo.

A continuación se ejemplifica la presente invención mediante los siguientes ejemplos, pero la invención no pretende estar limitada a los mismos.

Además, en los ejemplos Me representa Metilo, Ac representa acetilo y Ms representa metansulfonilo. Las referencias a la temperatura ambiente significan unas temperaturas de entre aproximadamente 18 y aproximadamente 30° C.

Ejemplo A: síntesis de 5-[3-(3.5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)-3.4-dihidro-2H-pirrol-5-il]-2-(1H-1.2.4-triazol-1-il) benzonitrilo (Compuesto N° 2)

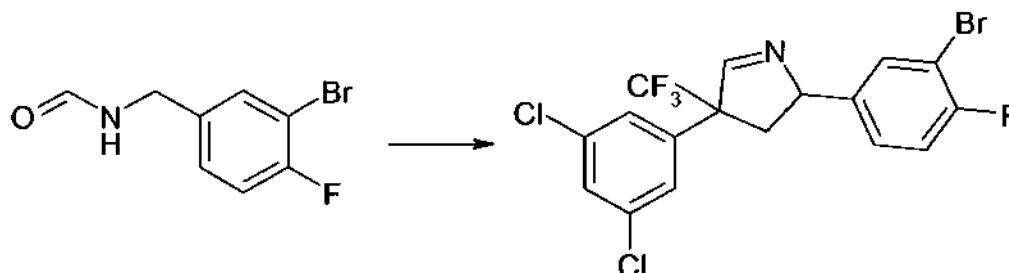
Etapas 1. Síntesis de N-(3-bromo-4-fluorobencil) formamida



Se añadió gota a gota etil éster del ácido fórmico (1,48 g) a 1-(3-bromo-4-fluorofenil) metanamina (3,40 g) que estaba en agitación bajo enfriamiento con hielo (0 °C). La mezcla de reacción se agitó como estaba durante 2 horas, después se devolvió a la temperatura ambiente y se agitó durante otras 2 horas. La mezcla de reacción se sometió directamente a una purificación mediante cromatografía en gel de sílice, para obtener N-(3-bromo-4-fluorobencil) formamida (2,7 g) con un rendimiento del 69 %.

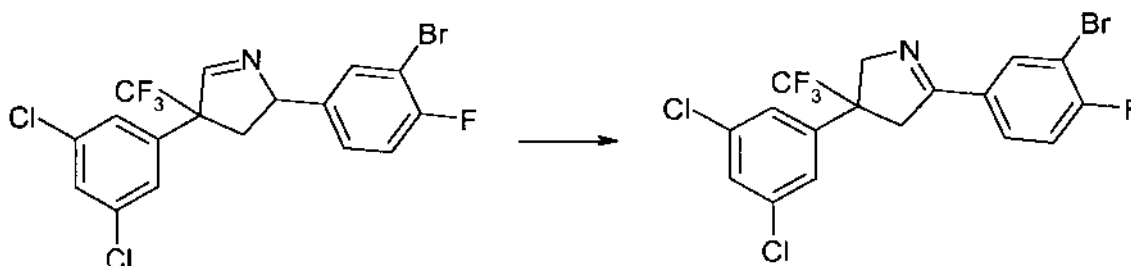
RMN-¹H (CDCl₃) δ: 4,47 (2H, d), 7,06 - 7,33 (3H, m), 8,26 (1H, s)

Etapla 2. Síntesis de 2-(3-bromo-4-fluorofenil)-4-(3,5-diclorofenil)-4-(trifluorometil)-3,4-dihidro-2H-pirrol



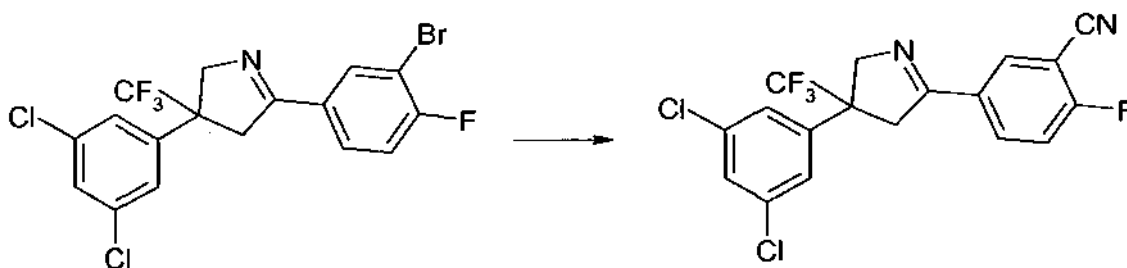
- 5 Mientras se agitaban en tolueno (40 ml) bajo enfriamiento con hielo (0 °C) N-(3-bromo-4-fluorobencil) formamida (2,70 g) y trietilamina (3,50 g), se añadió oxicloruro de fósforo (1,90 g) a los mismos. Después, la mezcla de reacción se agitó durante 3 horas a la temperatura ambiente. Se añadió cuidadosamente agua (100 ml) a la mezcla de reacción y se añadió una solución saturada de hidrogenocarbonato de sodio para neutralizar la mezcla de reacción. La capa acuosa se separó y se extrajo con tolueno (60 ml x 2). Las capas orgánicas combinadas se lavaron con una solución saturada de hidrogenocarbonato de sodio y con salmuera saturada, posteriormente se secaron sobre sulfato de magnesio y el agente secante se separó mediante filtración. Al filtrado se añadieron 1,3-dicloro-5-[1-(trifluorometil)etenil] benceno (2,1 g) y óxido de cobre (II) (0,2 g). La mezcla se calentó a reflujo durante 3 días. La mezcla de reacción se devolvió a la temperatura ambiente, y el filtrado se lavó con una solución acuosa saturada de hidrogenocarbonato de sodio y con salmuera saturada, y después se secó sobre sulfato de magnesio. Después de filtrar la mezcla de reacción, el disolvente se eliminó por destilación a presión reducida, para obtener el 2-(3-bromo-4-fluorofenil)-4-(3,5-diclorofenil)-4-(trifluorometil)-3,4-dihidro-2H-pirrol en bruto (0,88 g).

Etapla 3. Síntesis de 5-(3-bromo-4-fluorofenil)-3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)-3,4-dihidro-2H-pirrol.



- 20 A una solución de 2-(3-bromo-4-fluorofenil)-4-(3,5-diclorofenil)-4-(trifluorometil)-3,4-dihidro-2H-pirrol (0,88 g) en THF (13 ml), se añadió t-BuOK (0,24 g) bajo enfriamiento con hielo. La mezcla se devolvió a la temperatura ambiente y se agitó durante 16 horas. Se añadió agua a la mezcla de reacción, y la capa acuosa se separó y se extrajo con acetato de etilo. Las capas orgánicas combinadas se lavaron con salmuera saturada y se secaron sobre sulfato de magnesio. Después de filtrar la mezcla de reacción, el disolvente se eliminó por destilación a presión reducida, y la mezcla resultante se purificó mediante una cromatografía en gel de sílice, para obtener el 5-(3-bromo-4-fluorofenil)-3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)-3,4-dihidro-2H-pirrol (0,88 g) con un rendimiento del 100 %.
- 25 RMN-¹H (CDCl₃) δ: 3,42 (2H, d), 3,75 (2H, d), 4,43 (2H, d), 4,88 (2H, d), 7,10 - 7,39 (3H, m), 7,86 - 8,08 (3H, m)

Etapla 4. Síntesis de 5-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)-3,4-dihidro-2H-pirrol-5-ill-2-fluorobenzonitrilo.

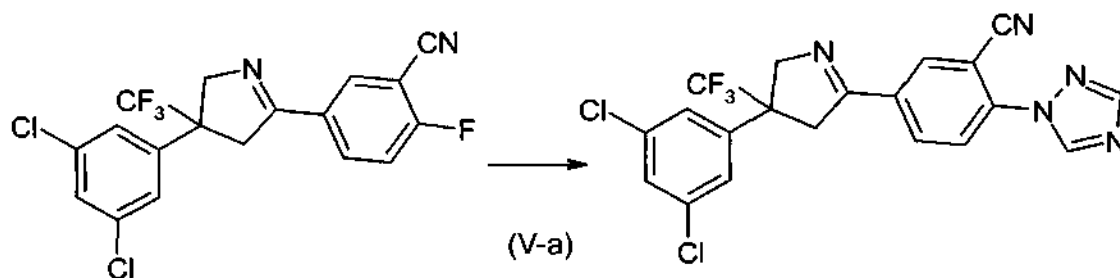


- 30 Se disolvió 5-(3-bromo-4-fluorofenil)-3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)-3,4-dihidro-2H-pirrol (0,88 g) en DMF (10 ml), y la solución se desaireó y después se dejó reposar en una atmósfera de argón. A la mezcla de reacción se

añadieron $\text{Zn}(\text{CN})_2$ (0,45 g) y $\text{Pd}(\text{PPh}_3)_4$ (0,67 g). La mezcla se agitó durante 4 horas a 90 °C. La mezcla de reacción se devolvió a la temperatura ambiente y después se añadió a la misma acetato de etilo. La mezcla de reacción se lavó con una solución acuosa saturada de hidrogenocarbonato de sodio y después se secó sobre sulfato de magnesio. Después de filtrar la mezcla de reacción, el disolvente se eliminó por destilación a presión reducida, y la mezcla resultante se purificó mediante una cromatografía en gel de sílice, para obtener el 5-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)-3,4-dihidro-2H-pirrol-5-il]-2-fluorobenzonitrilo (0,25 g) con un rendimiento del 32 %.

RMN- ^1H (CDCl_3) δ : 3,44 (1H, d), 3,76 (1H, d), 4,46 (1H, d), 4,91 (1H, d), 7,12 - 8,16 (6H, m)

Etapla 5. Síntesis de 5-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)-3,4-dihidro-2H-pirrol-5-il]-2-(1H-1,2,4-triazol-1-il) benzonitrilo.

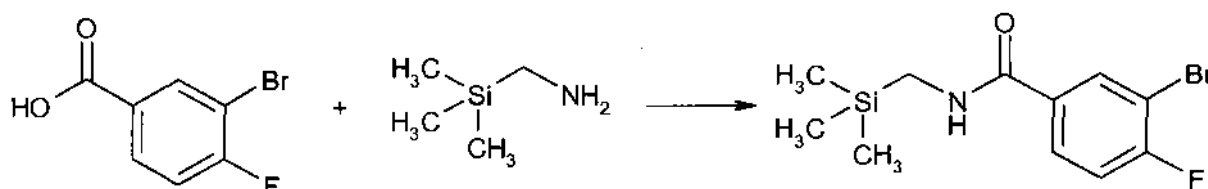


Se agitó una solución mixta de 5-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)-3,4-dihidro-2H-pirrol-5-il]-2-fluorobenzonitrilo (250 g), 1H-1,2,4-triazol (52 mg) y carbonato de potasio (103 mg) en DMF (1 ml) durante 3 horas a 80 °C. La mezcla de reacción se devolvió a la temperatura ambiente, se añadió agua a la misma, y la mezcla se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con salmuera saturada y después se secó sobre sulfato de magnesio. Después de filtrar la mezcla de reacción, el disolvente se eliminó por destilación a presión reducida, y la mezcla resultante se purificó mediante una cromatografía en gel de sílice, para obtener el 5-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)-3,4-dihidro-2H-pirrol-5-il]-2-(1H-1,2,4-triazol-1-il) benzonitrilo (130 mg) con un rendimiento del 46 %.

RMN- ^1H (CDCl_3) δ : 3,50 (1H, d), 3,82 (1H, d), 4,51 (1H, d), 4,96 (1H, d), 7,41 (1H, m), 7,93 - 8,33 (4H, m), 8,90 (1H, d)

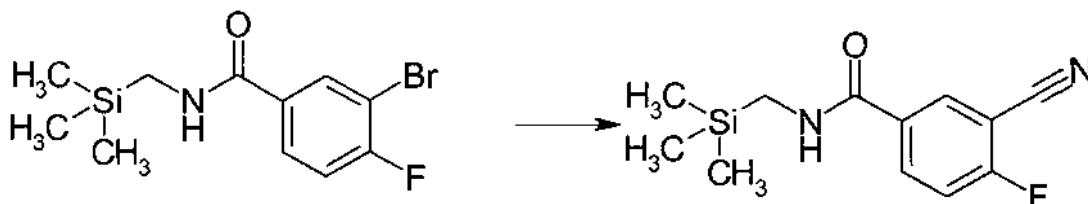
Ejemplo B: síntesis de 2(1H-1,2,4-triazol-1-il)-5-[3-(3,4,5-triclorofenil)-3-(trifluorometil)-3,4-dihidro-2H-pirrol-5-il] benzonitrilo (Nº 1 - 78)

Etapla 1. Síntesis de 3-bromo-4-fluoro-N-[(trimetilsilil)metil] benzamida



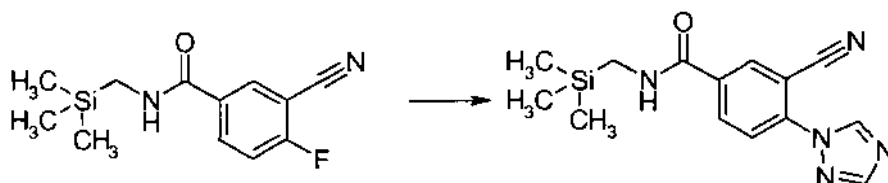
Se disolvió ácido 3-bromo-4-fluorobenzoico (5,0 g) en acetato de etilo y se añadió cloruro de tionilo (5,4 g) y DMF (3 gotas). La mezcla se calentó a reflujo durante 2 horas y después el disolvente se eliminó por destilación a presión reducida. El residuo se disolvió en THF y 1-(trimetilsilil) metilamina (2,6 g) y se añadió trietilamina (2,9 g) al mismo bajo enfriamiento (0 °C). La mezcla de reacción se agitó durante 3 horas a la temperatura ambiente. Se añadió agua a la mezcla de reacción y se extrajo con acetato de etilo. La capa orgánica se lavó con una solución saturada de hidrogenocarbonato de sodio, posteriormente se secó sobre sulfato de magnesio. Después de filtrar la mezcla de reacción, el disolvente se eliminó por destilación a presión reducida, y la mezcla resultante se purificó mediante una cromatografía en gel de sílice, para obtener la 3-bromo-4-fluoro-N-[(trimetilsilil)metil] benzamida (6,9 g) con un rendimiento del 100 %.

RMN- ^1H (CDCl_3) δ : 0,11 (9H, s), 2,93 (2H, s), 5,87 (1H, s), 7,16 (1H, t), 7,66 (1H, m), 7,95 (1H, d),

Etapa 2. Síntesis de 3-ciano-4-fluoro-N-[(trimetilsilil)metil] benzamida.

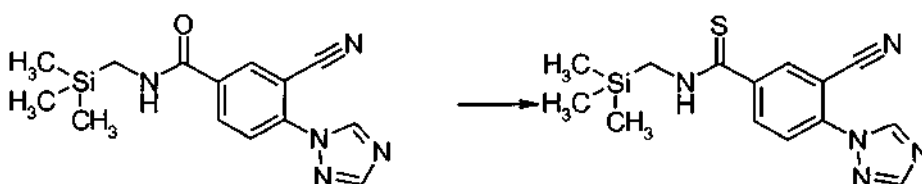
Se disolvió 3-bromo-4-fluoro-N-[(trimetilsilil)metil] benzamida (5,0 g) en DMF y se añadieron cianuro de cinc (1,4 g) y tetraquis(trifenilfosfina) paladio (1,9 g) al mismo en una atmósfera de argón. La mezcla de reacción se agitó durante 4 horas a 90 °C. La mezcla de reacción se devolvió a la temperatura ambiente. La mezcla se diluyó con acetato de etilo y se lavó con una solución saturada de hidrogenocarbonato de sodio, posteriormente se secó sobre sulfato de magnesio. Después de filtrar la mezcla de reacción, el disolvente se eliminó por destilación a presión reducida, y la mezcla resultante se purificó mediante una cromatografía en gel de sílice, para obtener la 3-ciano-4-fluoro-N-[(trimetilsilil)metil] benzamida (4,0 g) con un rendimiento del 97 %.

RMN-¹H (CDCl₃) δ: 0,2 (9H, s), 2,97 (2H, d), 5,94 (1H, s), 7,26 - 7,32 (2H, m), 7,98 - 8,02 (2H, m),

Etapa 3. Síntesis de 3-ciano-4-(1H-1,2,4-triazol-1-il)-N-[(trimetilsilil)metil] benzamida.

A una solución de 3-ciano-4-fluoro-N-[(trimetilsilil)metil] benzamida (1,5 g) en DMF se añadió triazol (0,5 g) y carbonato de potasio (1,0 g). La mezcla se agitó durante 3 horas a 80 °C. La mezcla de reacción se devolvió a la temperatura ambiente, se añadió agua a la misma, y la capa acuosa se extrajo con acetato de etilo. Las capas orgánicas combinadas, se lavaron con una solución saturada de hidrogenocarbonato de sodio, posteriormente se secaron sobre sulfato de magnesio. Después de filtrar la mezcla de reacción, el disolvente se eliminó por destilación a presión reducida, y la mezcla resultante se purificó mediante una cromatografía en gel de sílice, para obtener la 3-ciano-4-(1H-1,2,4-triazol-1-il)-N-[(trimetilsilil)metil] benzamida (1,1 g) con un rendimiento del 61 %.

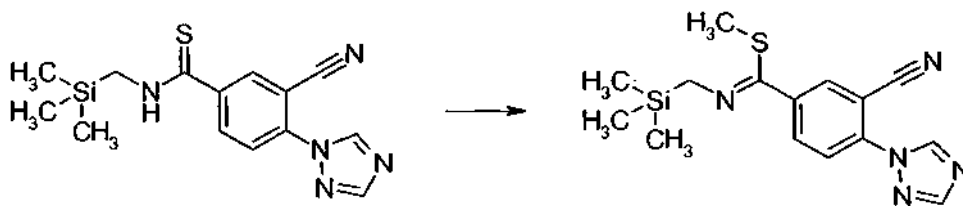
RMN-¹H (CDCl₃) δ: 0,20 (9H, s), 3,01 (2H, d), 6,01 (1H, s), 7,91 (1H, d), 8,12 (1H, d), 8,21 (2H, m), 8,88 (1H, s),

Etapa 4. Síntesis de 3-ciano-4-(1H-1,2,4-triazol-1-il)-N-[(trimetilsilil)metil] bencenocarbotoamida.

Se disolvió 3-ciano-4-(1H-1,2,4-triazol-1-il)-N-[(trimetilsilil)metil] benzamida (1,1 g) con tolueno. A la mezcla se le añadió reactivo de Lawesson (1,5 g) y se calentó a reflujo durante 5 horas. La mezcla de reacción se devolvió a la temperatura ambiente, se añadió agua a la misma y la capa acuosa se extrajo con acetato de etilo. Las capas orgánicas combinadas se lavaron con una solución saturada de hidrogenocarbonato de sodio, posteriormente se secaron sobre sulfato de magnesio. Después de filtrar la mezcla de reacción, el disolvente se eliminó por destilación a presión reducida, y la mezcla resultante se purificó mediante una cromatografía en gel de sílice, para obtener la 3-ciano-4-(1H-1,2,4-triazol-1-il)-N-[(trimetilsilil)metil] bencenocarbotoamida (1,5 g).

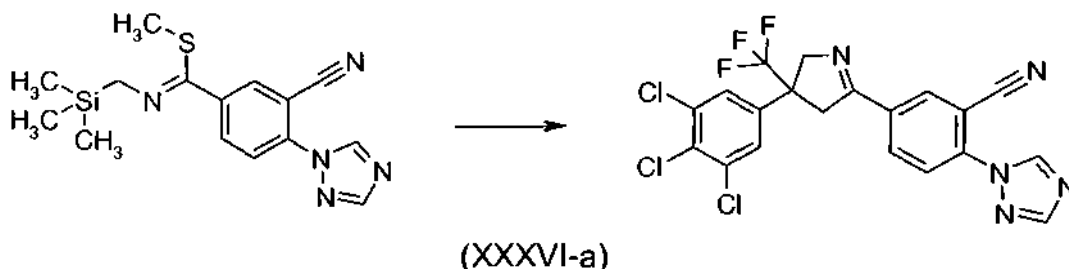
RMN-¹H (CDCl₃) δ: 0,21 (9H, s), 3,56 (2H, d), 8,03 (5H, m).

Etapa 5. Síntesis de 3-ciano-4-(1H-1,2,4-triazol-1-il)-N-[(trimetilsilil)metil] bencenocarbimidotioato de metilo (Nº 12 - 39).



- 5 A una solución de 3-ciano-4-(1H-1,2,4-triazol-1-il)-N-[(trimetilsilil)metil] bencenocarbamioamida (1,5 g) en THF se
añadió t-BuOK (0,64 g) bajo enfriamiento (0 °C). Después de agitar durante 15 minutos, se añadió gota a gota
yoduro de metilo (0,81 g) a la mezcla bajo enfriamiento (0 °C). El líquido de la reacción se devolvió a la temperatura
ambiente y se agitó durante 2 horas. Se añadió agua a la mezcla de reacción y la capa acuosa se extrajo con
10 acetato de etilo. La capa orgánica combinada se lavó con una solución saturada de hidrogenocarbonato de sodio,
posteriormente se secó sobre sulfato de magnesio. Después de filtrar la mezcla de reacción, el disolvente se eliminó
por destilación a presión reducida, y la mezcla resultante se purificó mediante una cromatografía en gel de sílice,
para obtener el 3-ciano-4-(1H-1,2,4-triazol-1-il)-N-[(trimetilsilil)metil] bencenocarbimidotioato de metilo con un
rendimiento del 64 %.
15 RMN-¹H (CDCl₃) δ: 0,13 (9H, s), 2,14 (3H, s), 3,74 (2H, s), 7,81 - 7,87 (1H, m), 7,97 - 8,01 (2H, m), 8,08 (1H, s), 8,22
(1H, s), 8,83 (1H, s).

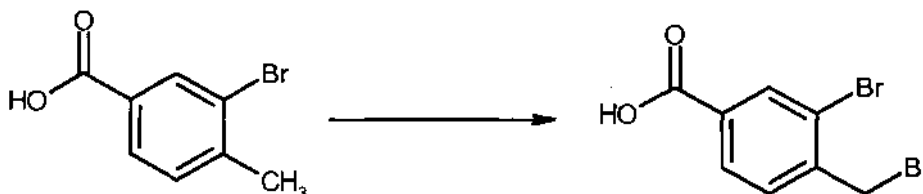
Etapa 6. Síntesis de 2-(1H-1,2,4-triazol-1-il)-5-[3-(3,4,5-triclorofenil)-3-(trifluorometil)-3,4-dihidro-2H-pirrol-5-il] benzonitrilo.



- 20 Se disolvieron 3-ciano-4-(1H-1,2,4-triazol-1-il)-N-[(trimetilsilil)metil] bencenocarbimidotioato de metilo (0,2 g) y 1,2,3-
tricloro-5-[1-(trifluorometil)etenil] benceno (0,17 g) en THF y se enfriaron hasta -5 °C en agitación. Adicionalmente se
añadió una solución de fluoruro de tetrabutilamonio (0,099 ml de 1,0 M en THF) en THF durante 10 minutos en una
atmósfera de argón. La mezcla de reacción se agitó durante 30 minutos a la misma temperatura y se devolvió
gradualmente a la temperatura ambiente, y después se agitó 4 horas. Se añadió agua al líquido de la reacción y la
25 capa acuosa se extrajo con acetato de etilo. Las capas orgánicas combinadas se lavaron con salmuera acuosa
saturada, posteriormente se secaron sobre sulfato de magnesio. Después de filtrar la mezcla de reacción, el
disolvente se eliminó por destilación a presión reducida, y la mezcla resultante se purificó mediante una
cromatografía en gel de sílice para obtener el 2-(1H-1,2,4-triazol-1-il)-5-[3-(3,4,5-triclorofenil)-3-(trifluorometil)-3,4-
dihidro-2H-pirrol-5-il] benzonitrilo (0,25 g) con un rendimiento del 85 %.
30 RMN-¹H (CDCl₃) δ: 3,48 (1H, d), 3,82 (1H, d), 4,50 (1H, d), 4,96 (1H, d), 7,41 (2H, s), 7,94 (1H, d), 8,22 - 8,32 (3H,
m), 8,90 (1H, s),

Ejemplo C (no de acuerdo con la invención): síntesis de N-12-bromo-4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)-3,4-dihidro-2H-pirrol-5-il]bencil] acetamida (Nº 2 - 13).

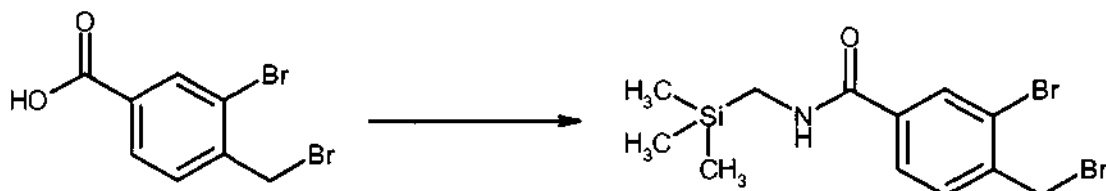
Etapa 1. Síntesis del ácido 3-bromo-4-(bromometil) benzoico.



- 35 Se suspendieron ácido 3-bromo-4-metilbenzoico (10 g), N-bromosuccinimida (8,7 g) y 2,2'-azobisisobutironitrilo (0,4
g) en tetracloruro de carbono (50 ml) y después se calentó a reflujo durante 2 horas. La mezcla se devolvió a la

temperatura ambiente y se añadió una solución acuosa de ácido cítrico al 15 % (20 ml) y se agitó durante algún tiempo. Los cristales resultantes se filtraron y se lavaron con la solución acuosa al 15 % de ácido cítrico (20 ml), y después se secaron para obtener el ácido 3-bromo-4-(bromometil) benzoico (6 g).
 RMN-¹H (CDCl₃) δ: 4,62 (2H, s), 7,57-7,58 (1H, m), 8,01-8,04 (1H, m), 8,32 (1H, d)

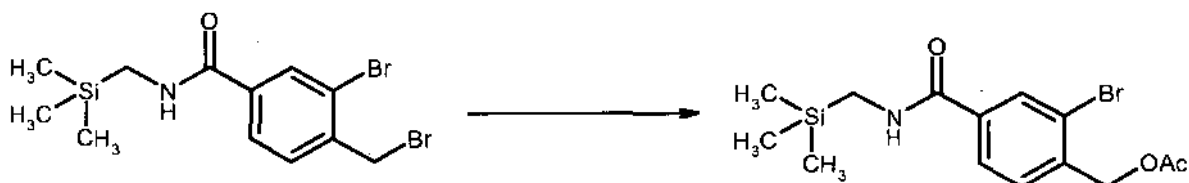
5 Etapla 2. Síntesis de 3-bromo-4-(bromometil)-N-[(trimetilsilil)metil] benzamida.



Se disolvieron ácido 3-bromo-4-(bromometil) benzoico (5 g), 1-(trimetilsilil) metilamina (1,76 g), N,N-dimetilaminopiridina (0,1 g) y clorhidrato de N-(3-dimetilaminopropil)-N'-etilcarbodiimida (4,3 g) en diclorometano (30 ml), y se agitó durante 5 horas a la temperatura ambiente. Se añadió agua a la mezcla de reacción y después se separó la capa orgánica y se secó sobre sulfato de magnesio. Después de filtrar la mezcla de reacción, el disolvente se eliminó por destilación a presión reducida, y la mezcla resultante se purificó mediante una cromatografía en gel de sílice, para obtener la 3-bromo-4-(bromometil)-N-[(trimetilsilil)metil] benzamida (4 g).

RMN-¹H (CDCl₃) δ: 0,13 (9H, s), 2,94 - 2,98 (2H, m), 4,71 (2H, s), 5,99 (1H, s), 7,53 - 7,55 (1H, m), 7,64 - 7,67 (1H, m), 7,95 - 7,96 (1H, m)

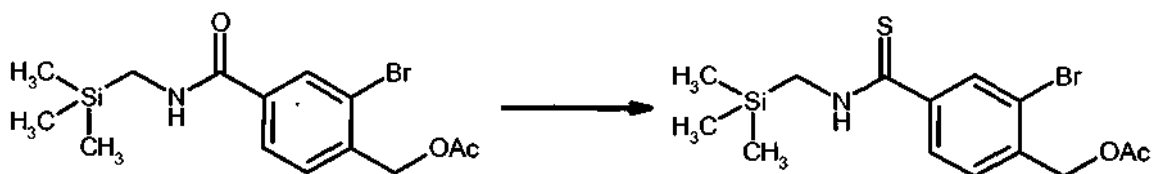
15 Etapla 3. Síntesis de acetato de 2-bromo-4-[(trimetilsilil)metil]carbamoil} bencilo



Se agitó una solución mixta de acetato de sodio (2,8 g), 3-bromo-4-(bromometil)-N-[(trimetilsilil)metil] benzamida (6,5 g) en DMF (30 ml) durante 3 horas a 70 °C. El líquido de la reacción se devolvió a la temperatura ambiente y se diluyó con t-butil metil éter. La mezcla se lavó con agua y salmuera acuosa saturada, posteriormente se secó sobre sulfato de magnesio. Después de separar el agente secante mediante filtración, el líquido de la reacción se eliminó por destilación a presión reducida, y la mezcla resultante se purificó mediante una cromatografía en gel de sílice, para obtener el acetato de 2-bromo-4-[(trimetilsilil)metil]carbamoil} bencilo (2,4 g).

RMN-¹H (CDCl₃) δ: 0,13 (9H, s), 2,16 (3H, s), 2,96 (2H, d), 5,21 (2H, s), 5,96 (1H, s), 7,44 - 7,47 (1H, m), 7,64 - 7,67 (1H, m), 7,94 - 7,95 (1H, m)

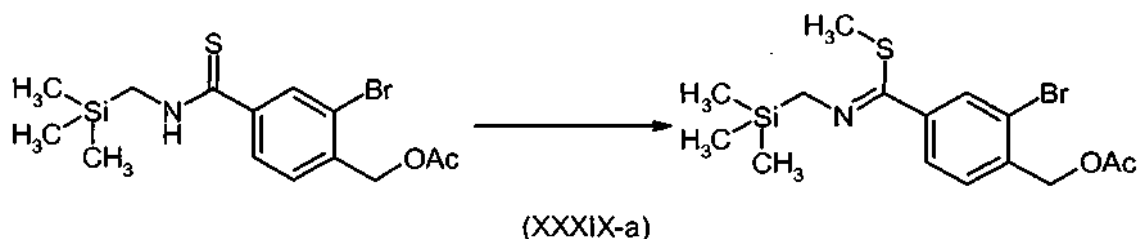
25 Etapla 4. Síntesis de acetato de 2-bromo-4-[(trimetilsilil)metil]carbamoil} bencilo



Se suspendieron acetato de 2-bromo-4-[(trimetilsilil)metil]carbamoil} bencilo (2,4 g) y reactivo de Lawesson (2,7 g) con tolueno. La mezcla se calentó a reflujo durante 2 horas. La mezcla de reacción se devolvió a la temperatura ambiente, se lavó con agua y salmuera acuosa saturada, posteriormente se secó sobre sulfato de magnesio. Después de filtrar la mezcla de reacción, el disolvente se eliminó por destilación a presión reducida, y la mezcla resultante se purificó mediante una cromatografía en gel de sílice, para obtener el acetato de 2-bromo-4-[(trimetilsilil)metil]carbamoil} bencilo (1,8 g).

RMN-¹H (CDCl₃) δ: 0,18 (9H, s), 2,15 (3H, s), 3,51 (2H, d), 5,18 (2H, s), 7,38 - 7,41 (1H, m), 7,58 - 7,60 (2H, m), 7,90 - 7,90 (1H, m)

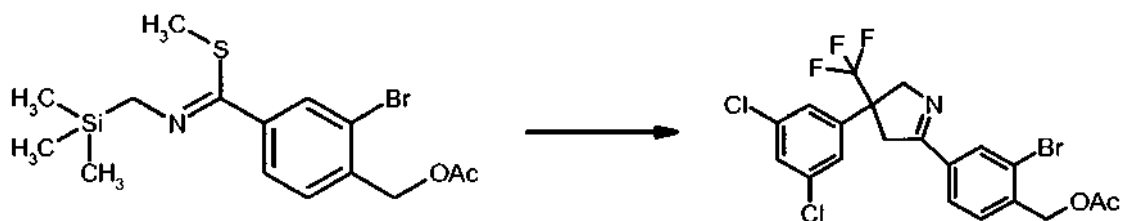
Etapas 5. Síntesis de acetato de 2-bromo-4-[(metilsulfanil){[(trimetisilil)metil]imino}metil] bencilo (N° 13 - 9).



Se agitó una solución mixta de yoduro de metilo (0,69 g), carbonato de potasio (0,80 g) y acetato de 2-bromo-4-[[[(trimetisilil)metil]carbamotioil] bencilo (1,8 g) en DMF (30 ml) durante 2 horas a la temperatura ambiente. La mezcla se diluyó con t-butil metil éter y se lavó con agua y salmuera acuosa saturada, posteriormente se secó sobre sulfato de magnesio. Después de filtrar la mezcla de reacción, el disolvente se eliminó por destilación a presión reducida, y la mezcla resultante se purificó mediante una cromatografía en gel de sílice, para obtener el acetato de 2-bromo-4-[[[(metilsulfanil){[(trimetisilil)metil]imino}metil] bencilo (0,95 g).

RMN-¹H (CDCl₃) δ: 0,11 (9H, s), 2,09 (3H, s), 2,14 (3H, s), 3,64 (2H, s), 5,20 (2H, s), 7,42 - 7,47 (2H, m), 7,71 - 7,74 (1H, m)

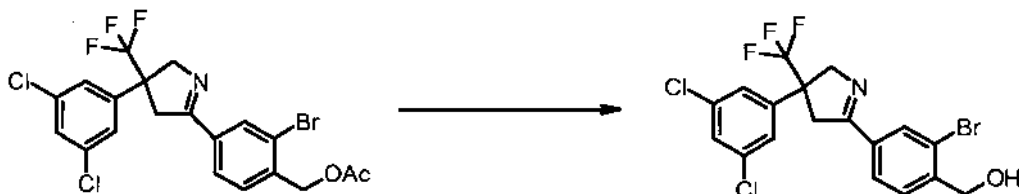
Etapas 6. Síntesis de acetato de 2-bromo-4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)-3,4-dihidro-2H-pirrol-5-il] bencilo



En una atmósfera de argón se enfrió una solución mixta de acetato de 2-bromo-4-[[[(metilsulfanil){[(trimetisilil)metil]imino}metil] bencilo (0,90 g) y 1,3-dicloro-5-(3,3,3-trifluoroprop-1-en-2-il) benceno (0,56 g) en THF hasta -5 °C con agitación, y a la misma se añadió gradualmente una solución de fluoruro de tetrabutilamonio (0,56 ml de 1,0 M en THF). La mezcla de reacción se agitó durante 20 horas a la temperatura ambiente. La mezcla de reacción se diluyó con t-butil metil éter y se lavó con agua y salmuera acuosa saturada, posteriormente se secó sobre sulfato de magnesio. Después de filtrar la mezcla de reacción, el disolvente se eliminó por destilación a presión reducida, y la mezcla resultante se purificó mediante una cromatografía en gel de sílice, para obtener el acetato de 2-bromo-4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)-3,4-dihidro-2H-pirrol-5-il] bencilo (1,1 g).

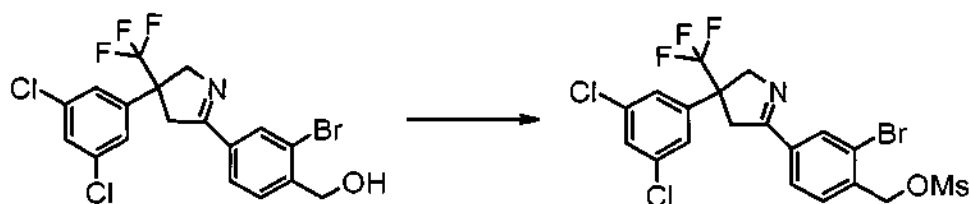
RMN-¹H (CDCl₃) δ: 2,17 (3H, s), 3,43 (1H, d), 3,73 - 3,79 (1H, m), 4,45 (1H, d), 4,87 - 4,92 (1H, m), 5,23 (2H, s), 7,25 - 7,28 (2H, m), 7,38 - 7,38 (1H, m), 7,48 - 7,50 (1H, m), 7,77 - 7,80 (1H, m), 8,07 - 8,08 (1H, m)

Etapas 7. Síntesis de {2-bromo-4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)-3,4-dihidro-2H-pirrol-5-il]fenil} metanol.

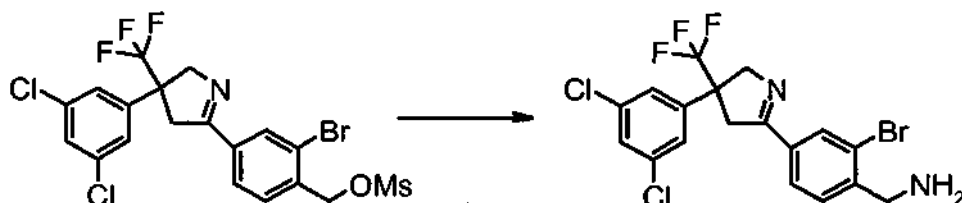


A una solución de acetato de 2-bromo-4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)-3,4-dihidro-2H-pirrol-5-il] bencilo (1,1 g) en metanol (20 ml) se añadió metóxido de sodio (0,1 g), y la solución se agitó durante 1 hora a la temperatura ambiente. La mezcla de reacción se devolvió a la temperatura ambiente y después se diluyó con t-butil metil éter, se lavó con agua y salmuera acuosa saturada y posteriormente se secó sobre sulfato de magnesio. Después de filtrar la mezcla de reacción, el disolvente se eliminó por destilación a presión reducida, y la mezcla resultante se purificó mediante una cromatografía en gel de sílice, para obtener el {2-bromo-4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)-3,4-dihidro-2H-pirrol-5-il]fenil} metanol (0,95 g).

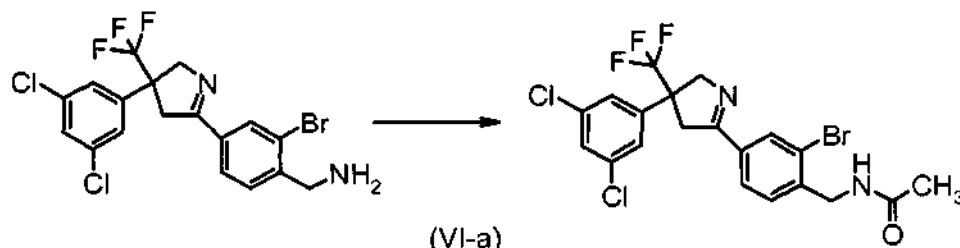
RMN-¹H (CDCl₃) δ: 3,44 (1H, d), 3,74 - 3,80 (1H, m), 4,45 (1H, d), 4,83 - 4,89 (3H, m), 7,30 - 7,34 (3H, m), 7,59 - 7,61 (1H, m), 7,78 - 7,81 (1H, m), 8,05 - 8,06 (1H, m)

Etapla 8. Síntesis de metansulfonato de 2-bromo-4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)-3,4-dihidro-2H-pirrol-5-il] bencilo

- 5 A una solución de {2-bromo-4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)-3,4-dihidro-2H-pirrol-5-il]fenil} metanol (0,95 g) y trietilamina (0,41 g) en diclorometano se añadió gradualmente cloruro de metansulfonilo (0,35 g), y la mezcla se agitó durante 2 horas a la temperatura ambiente. El líquido de la reacción se lavó con agua y salmuera acuosa saturada, posteriormente se secó sobre sulfato de magnesio. Después de filtrar la mezcla de reacción, el disolvente se eliminó por destilación a presión reducida, para obtener el metansulfonato de 2-bromo-4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)-3,4-dihidro-2H-pirrol-5-il] bencilo (1,0 g).
- 10 RMN-¹H (CDCl₃) δ: 3,07 (3H, s), 3,44 (1H, d), 3,74 - 3,80 (1H, m), 4,46 (1H, d), 4,88 - 4,94 (1H, m), 5,36 (2H, s), 7,24 - 7,28 (2H, m), 7,38 - 7,39 (1H, m), 7,58 - 7,60 (1H, m), 7,81 - 7,84 (1H, m), 8,12 - 8,13 (1H, m)

Etapla 9. Síntesis de 1-{2-bromo-4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)-3,4-dihidro-2H-pirrol-5-il]fenil} metanamina.

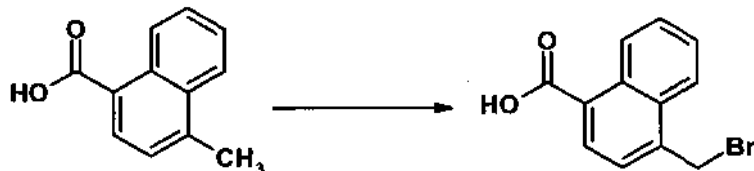
- 15 Se añadió gota a gota una solución de metansulfonato de 2-bromo-4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)-3,4-dihidro-2H-pirrol-5-il] bencilo (1,0 g) en THF (5 ml) a una solución mixta de amoníaco acuoso (30 %, 30 ml), metanol (30 ml) y THF (30 ml), y la mezcla de reacción se agitó durante 20 horas a la temperatura ambiente. La mezcla se concentró a presión reducida para dar un material residual. El residuo se disolvió con t-butil metil éter y se lavó con agua y salmuera acuosa saturada, posteriormente se secó sobre sulfato de magnesio. Después de separar el agente secante mediante filtración, el líquido de la reacción se eliminó por destilación a presión reducida, para obtener la 1-{2-bromo-4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)-3,4-dihidro-2H-pirrol-5-il]fenil} metanamina (0,8 g).
- 20 RMN-¹H (CDCl₃) δ: 3,43 (1H, d), 3,73 - 3,79 (1H, m), 4,43 - 4,48 (3H, m), 4,88 (1H, d), 7,25 - 7,28 (2H, m), 7,37 - 7,38 (1H, m), 7,59 - 7,62 (1H, m), 7,75 - 7,78 (1H, m), 8,05 - 8,06 (1H, m)

Etapla 10. Síntesis de N-{2-bromo-4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)-3,4-dihidro-2H-pirrol-5-il]bencil} acetamida

- 25 A una solución de 1-{2-bromo-4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)-3,4-dihidro-2H-pirrol-5-il]fenil} metanamina (0,15 g) en THF (10 ml) se añadió anhídrido acético (0,04 g), y la mezcla se agitó durante 1 hora a la temperatura ambiente. La mezcla se concentró a presión reducida para dar un material residual que se purificó mediante una cromatografía en gel de sílice, para obtener la N-{2-bromo-4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)-3,4-dihidro-2H-pirrol-5-il]bencil} acetamida (0,1 g).
- 30 RMN-¹H (CDCl₃) δ: 2,04 (3H, s), 3,41 (1H, d), 3,73 - 3,77 (1H, m), 4,43 - 4,53 (3H, m), 4,89 (1H, d), 5,98 (1H, s), 7,24 - 7,28 (2H, m), 7,38 - 7,38 (1H, m), 7,47 - 7,49 (1H, m), 7,71 - 7,78 (1H, m), 8,07 - 8,07 (1H, m)

Ejemplo D (no de acuerdo con la invención): síntesis de N-([4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)-3,4-dihidro-2H-pirrol-5-il]naftalen-1-il]metil) acetamida (N° 11 - 1).

Etapas 1: Síntesis del ácido 4-(bromometil)naftalen-1-carboxílico



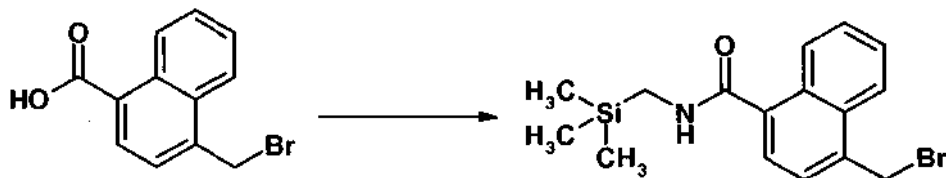
5

Se suspendieron ácido 4-metilnaftalen-1-carboxílico (5 g), N-bromosuccinimida (5,7 g) y 2,2'-azobisisobutironitrilo (0,2 g) en tetracloruro de carbono (50 ml) y después se calentaron a reflujo durante 2 horas. La mezcla se devolvió a la temperatura ambiente y se añadió una solución acuosa de ácido cítrico al 15 % (20 ml) y se agitó durante algún tiempo. Los cristales resultantes se filtraron y se lavaron con la solución acuosa de ácido cítrico al 15 % (20 ml) y después se secaron, para obtener el ácido 4-(bromometil)naftalen-1-carboxílico (7 g).

10

RMN-¹H (acetona-d₆) δ: 5,19 (2H, s), 7,69 - 7,76 (3H, m), 8,23 - 8,29 (2H, m), 9,04 - 9,06 (1H, m)

Etapas 2. Síntesis de 4-(bromometil)-N-[(trimetilsilil)metil]naftalen-1-carboxamida.



Se disolvieron ácido 4-(bromometil)naftalen-1-carboxílico (7 g), 1-(trimetilsilil)metilamina (2,7 g), N,N-dimetilaminopiridina (0,1 g) y clorhidrato de N-(3-dimetilaminopropil)-N'-etilcarbodiimida (6,6 g) en diclorometano (30 ml), y se agitaron durante 5 horas a la temperatura ambiente. Se añadió agua a la mezcla de reacción y después las capas orgánicas se separaron y se secaron sobre sulfato de magnesio. Después de filtrar la mezcla de reacción, el disolvente se eliminó por destilación a presión reducida, y la mezcla resultante se purificó mediante una cromatografía en gel de sílice, para obtener la 4-(bromometil)-N-[(trimetilsilil)metil]naftalen-1-carboxamida (3 g).

20

RMN-¹H (CDCl₃) δ: 0,16 (9H, s), 3,07 (2H, d), 5,05 (2H, s), 5,80 (1H, s), 7,48 - 7,67 (4H, m), 8,16 - 8,18 (1H, m), 8,29 - 8,31 (1H, m)

Etapas 3. Síntesis de acetato de (4-[(trimetilsilil)metil]carbamoil)naftalen-1-il) metilo



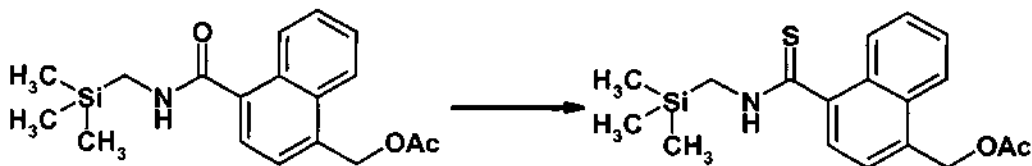
25

Se agitó una solución mixta de acetato de sodio (1,1 g), 4-(bromometil)-N-[(trimetilsilil)metil]naftalen-1-carboxamida (2,5 g) en DMF (30 ml) durante 3 horas a 70 °C. La mezcla de reacción se devolvió a la temperatura ambiente y se diluyó con t-butil metil éter. La mezcla se lavó con agua y salmuera acuosa saturada, posteriormente se secó sobre sulfato de magnesio. Después de filtrar la mezcla de reacción, el disolvente se eliminó por destilación a presión reducida, y la mezcla resultante se purificó mediante una cromatografía en gel de sílice, para obtener el acetato de (4-[(trimetilsilil)metil]carbamoil)naftalen-1-il) metilo (1,3 g).

30

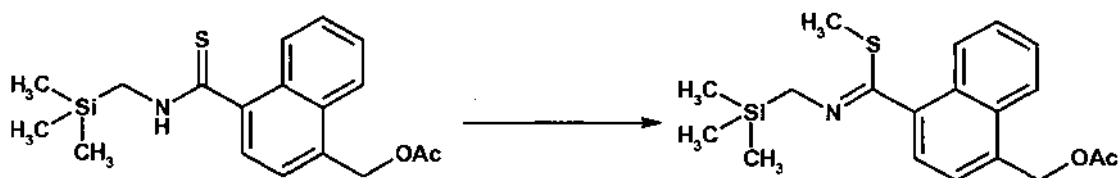
RMN-¹H (CDCl₃) δ: 0,15 (9H, s), 2,11 (3H, s), 3,07 (2H, d), 5,57 (2H, s), 5,80 (1H, s), 7,52 - 7,61 (4H, m), 8,01 - 8,06 (1H, m), 8,29 - 8,33 (1H, m)

Etapla 4. Síntesis de acetato de (4{[(trimetilsilil)metil]carbamoil}naftalen-1-il) metilo



Se suspendieron acetato de (4{[(trimetilsilil)metil]carbamoil}naftalen-1-il) metilo (2,0 g) y reactivo de Lawesson (2,4 g) con tolueno (30 ml). La mezcla se calentó a reflujo durante 2 horas. La mezcla de reacción se devolvió a la temperatura ambiente, se lavó con agua y salmuera acuosa saturada, posteriormente se secó sobre sulfato de magnesio. Después de filtrar la mezcla de reacción, el disolvente se eliminó por destilación a presión reducida, y la mezcla resultante se purificó mediante una cromatografía en gel de sílice, para obtener el acetato de (4{[(trimetilsilil)metil]carbamoil}naftalen-1-il) metilo (1,2 g).

Etapla 5. Síntesis de acetato de {4-[(Z)-(metilsulfanil){[(trimetilsilil)metil]imino}metil]naftalen-1-il} metilo (N° 15 - 2)



A una solución mixta de yoduro de metilo (0,60 g) y acetato de (4{[(trimetilsilil)metil]carbamoil}naftalen-1-il) metilo (1,2 g) en THF (30 ml) se añadió gradualmente t-butoxido de potasio (0,45 g), y la mezcla se agitó durante 20 minutos a la misma temperatura. La mezcla se diluyó con t-butil metil éter y se lavó con agua y salmuera acuosa saturada, posteriormente se secó sobre sulfato de magnesio. Después de filtrar la mezcla de reacción, el disolvente se eliminó por destilación a presión reducida, para obtener el acetato de {4-[(Z)-(metilsulfanil){[(trimetilsilil)metil]imino}metil]naftalen-1-il} metilo (1,1 g).

RMN-¹H (CDCl₃) δ: 0,22 (9H, s), 2,14 - 2,15 (6H, m), 3,67 (2H, s), 5,59 (2H, s), 7,56 - 7,61 (4H, m), 7,82 - 7,83 (1H, m), 8,06 - 8,15 (1H, m)

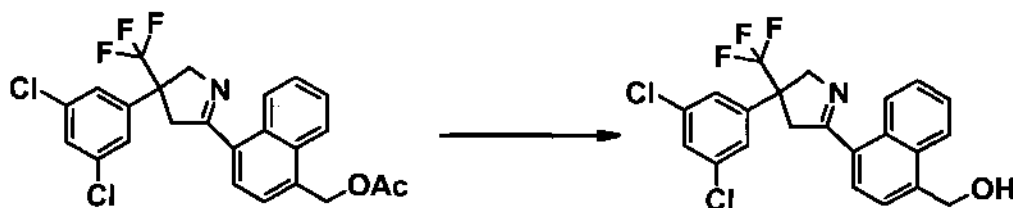
Etapla 6. Síntesis de acetato de {4-[3-(3,4,5-triclorofenil)-3-(trifluorometil)-3,4-dihidro-2H-pirrol-5-il]naftalen-1-il} metilo



En una atmósfera de argón se enfrió una solución mixta de acetato de {4-[(Z)-(metilsulfanil){[(trimetilsilil)metil]imino}metil]naftalen-1-il} metilo (1,0 g) y 1,3-dicloro-5-(3,3,3-trifluoroprop-1-en-2-il) benceno (0,77 g) en THF hasta -5 °C con agitación, y a la misma se añadió gradualmente una solución de fluoruro de tetrabutilamonio (0,27 ml de 1,0 M en THF). La mezcla de reacción se agitó durante 20 horas a la temperatura ambiente. La mezcla de reacción se diluyó con t-butil metil éter y se lavó con agua y salmuera acuosa saturada, posteriormente se secó sobre sulfato de magnesio. Después de filtrar la mezcla de reacción, el disolvente se eliminó por destilación a presión reducida, y la mezcla resultante se purificó mediante una cromatografía en gel de sílice, para obtener el acetato de {4-[3-(3,4,5-triclorofenil)-3-(trifluorometil)-3,4-dihidro-2H-pirrol-5-il]naftalen-1-il} metilo (0,66 g).

RMN-¹H (CDCl₃) δ: 2,13 (3H, s), 3,63 (1H, d), 3,85 - 3,91 (1H, m), 4,59 (1H, d), 5,04 - 5,10 (1H, m), 5,60 (2H, s), 7,59 - 7,64 (4H, m), 8,05 - 8,07 (1H, m), 8,91 - 8,94 (1H, m)

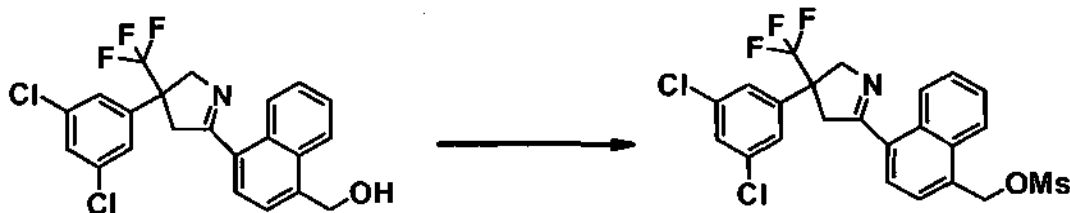
Etapa 7. Síntesis de {4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)-3,4-dihidro-2H-pirrol-5-il]naftalen-1-il} metanol.



A una solución de acetato de {4-[3-(3,4,5-triclorofenil)-3-(trifluorometil)-3,4-dihidro-2H-pirrol-5-il]naftalen-1-il} metilo (0,66 g) en metanol (5 ml) se añadió metóxido de sodio (76 mg) a la temperatura ambiente. La mezcla se agitó durante 3 horas y se concentró a presión reducida y después se añadió agua. La mezcla se extrajo con acetato de etilo y la capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio. Después de filtrar la mezcla de reacción, el disolvente se eliminó por destilación a presión reducida, para obtener el compuesto deseado en forma de un producto en bruto (0,6 g).

RMN-¹H (CDCl₃) δ: 1,58 (1H, s a), 3,63 (1H, d), 3,89 (1H, d), 4,58 (1H, d), 5,07 (1H, d), 5,17 (2H, s), 7,44 (2H, s), 7,50 - 7,70 (4H, m), 8,06 - 8,09 (1H, m), 8,88 - 8,91 (1H, m).

Etapa 8. Síntesis de metansulfonato de {4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)-3,4-dihidro-2H-pirrol-5-il]naftalen-1-il} metilo



Se disolvieron {4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)-3,4-dihidro-2H-pirrol-5-il]naftalen-1-il} metanol (0,6 g) y trietilamina (0,35 g) en THF (5 ml), y se añadió gradualmente cloruro de metansulfonilo (0,15 ml). La mezcla se agitó durante 1 hora y después se añadió agua. La mezcla se extrajo con acetato de etilo, y la capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio. Después de filtrar la mezcla de reacción, el disolvente se eliminó por destilación a presión reducida, para obtener el compuesto deseado en forma de un producto en bruto (0,7 g).

RMN-¹H (CDCl₃) δ: 2,88 (3H, s), 3,64 (1H, d), 3,88 (1H, d), 4,60 (1H, d), 5,08 (1H, d), 5,74 (2H, s), 7,44 (2H, s), 7,62 - 7,72 (4H, m), 8,09 - 8,18 (1H, m), 8,86 - 8,93 (1H, m).

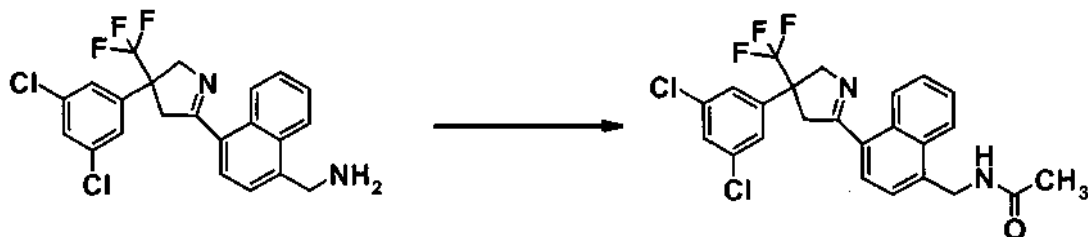
Etapa 9. Síntesis de 1-{4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)-3,4-dihidro-2H-pirrol-5-il]naftalen-1-il} metanamina (N° 11 - 18)



Se disolvió metansulfonato de {4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)-3,4-dihidro-2H-pirrol-5-il]naftalen-1-il} metilo (0,7 g) en un disolvente mixto de THF (20 ml) y metanol (20 ml), y se añadió al mismo una solución de amoníaco acuoso (28 %, 20 ml). La mezcla se agitó durante 12 horas y después se añadió agua. La mezcla se extrajo con acetato de etilo, y la capa orgánica se secó sobre sulfato de magnesio. Después de filtrar la mezcla de reacción, el disolvente se eliminó por destilación a presión reducida, para obtener el compuesto deseado en forma de un producto en bruto (0,48 g).

RMN-¹H (CDCl₃) δ: 1,61 (2H, s), 3,64 (1H, d), 3,90 (1H, d), 4,39 (2H, s), 4,58 (1H, d), 5,07 (1H, d), 7,44 (2H, s), 7,52 - 7,69 (4H, m), 8,09 - 8,16 (1H, m), 9,00 - 8,94 (1H, m).

Etapa 10. Síntesis de N-({4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)-3,4-dihidro-2H-pirrol-5-il]naftalen-1-il}metil)acetamida



- 5 Se disolvió 1-({4-[3-(3,5-diclorofenil)-3-(trifluorometil)-3,4-dihidro-2H-pirrol-5-il]naftalen-1-il} metanamina (0,1 g) en THF (10 ml), y se añadió a la misma anhídrido acético (0,04 g). La mezcla se agitó durante 4 horas a la temperatura ambiente. La mezcla se concentró a presión reducida para dar un material residual que se purificó mediante una cromatografía en gel de sílice, para obtener el compuesto deseado (63 mg) con un rendimiento del 58 %.
- RMN-¹H (CDCl₃) δ: 2,04 (3H, s), 3,62 (1H, d), 3,87 (1H, d), 4,59 (1H, d), 4,93 (2H, d), 5,07 (1H, d), 5,70 (1H, s a), 7,53 - 7,41 (3H, m), 7,70 - 7,57 (3H, m), 8,15 - 8,01 (1H, m), 8,99 - 8,88 (1H, m)

- 10 Los compuestos de la presente invención obtenidos de acuerdo con los anteriores ejemplos de síntesis A a D y los procedimientos de producción (a) a (g) y (p) se presentan en las Tablas 1, 2 y 11. Además, los intermedios se presentan en las Tablas 3 a 10 y en las Tablas 12 a 15.

En las Tablas 1 a 10 y en las Tablas 12 a 13 y 18, A1 y A4 representan C-H.

- 15 En las tablas, las abreviaturas son como sigue. Me: metilo, Et: etilo, Pr: propilo, Bu: butilo, Ph: fenilo, py: piridilo, n-Pr: normal-propilo, iso-Pr: isopropilo, terc-Bu: terc-butilo, cyc-Pr: ciclopropilo.

Tabla 1

Nº	B ¹	B ²	B ³	A ¹	A ²	G	(Z) _k
1 - 1	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-H	G1	H
1 - 2	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-H	G2	H
1 - 3	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-H	G3	H
1 - 4	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-H	G4	H
1 - 5	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-H	G5	H
1 - 6	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-H	G6	H
1 - 7	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-H	G7	H
1 - 8	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-H	G8	H
1 - 9	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-H	G9	H
1 - 10	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-F	G6	H
1 - 11	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-F	G8	H
1 - 12	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-F	G9	H
1 - 13	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-Cl	G6	H
1 - 14	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-Cl	G8	H
1 - 15	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-Cl	G9	H
1 - 16	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-Br	G1	H
1 - 17	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-Br	G2	H
1 - 18	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-Br	G3	H
1 - 19	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-Br	G4	H
1 - 20	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-Br	G5	H
1 - 21	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-Br	G6	H
1 - 22	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-Br	G7	H
1 - 23	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-Br	G8	H
1 - 24	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-Br	G9	H
1 - 25	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-I	G6	H
1 - 26	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-I	G8	H
1 - 27	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-I	G9	H
1 - 28	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-Me	G6	H

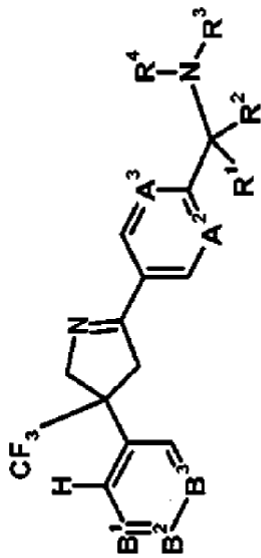
(continuación)

Nº	B¹	B²	B³	A¹	A²	G	(Z) _k
1 - 29	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-Me	G8	H
1 - 30	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-CF ₃	G6	H
1 - 31	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-CF ₃	G8	H
1 - 32	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-NO ₂	G6	H
1 - 33	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-NO ₂	G8	H
1 - 34	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-CN	G1	H
1 - 35	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-CN	G2	H
1 - 36	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-CN	G3	H
1 - 37	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-CN	G4	H
1 - 38	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-CN	G5	H
1 - 39	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-CN	G6	H
1 - 40	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-CN	G7	H
1 - 41	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-CN	G8	H
1 - 42	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-CN	G9	H
1 - 43	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-NO ₂	G6	H
1 - 44	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-NO ₂	G8	H
1 - 45	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-CH ₃	G6	H
1 - 46	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-OMe	G6	H
1 - 47	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-SOMe	G6	H
1 - 48	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-SO ₂ Me	G6	H
1 - 49	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-SCF ₃	G6	H
1 - 50	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-S(O)CF ₃	G6	H
1 - 51	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-S(O) ₂ CF ₃	G6	H
1 - 52	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-OCH ₃	G6	H
1 - 53	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-OCF ₃	G6	H
1 - 54	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-OH	G6	H
1 - 55	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-SH	G6	H
1 - 56	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-NH ₂	G6	H
1 - 57	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-NHCOCH ₃	G6	H
1 - 58	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-NHCO ₂ CH ₃	G6	H
1 - 59	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-NHCO ₂ -CH ₂ CCl ₃	G6	H
1 - 60	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-CN	G2	3-NO ₂
1 - 61	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-CN	G2	3-CN
1 - 62	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-CN	G6	3-NO ₂
1 - 63	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-CN	G6	3-CN
1 - 64	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-CN	G2	3-Cl
1 - 65	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-CN	G2	3-Br
1 - 66	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-CN	G2	3-CH ₃
1 - 67	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-CN	G2	3-CF ₃
1 - 68	C-Cl	C-H	C-H	C-H	C-CN	G6	H
1 - 69	C-Cl	C-H	C-H	C-H	C-CN	G8	H
1 - 70	C-CF ₃	C-H	C-H	C-H	C-CN	G6	H
1 - 71	C-CF ₃	C-H	C-H	C-H	C-CN	G8	H
1 - 72	C-CF ₃	C-H	C-CF ₃	C-H	C-CN	G6	H
1 - 73	C-CF ₃	C-H	C-CF ₃	C-H	C-CN	G8	H
1 - 74	C-NO ₂	C-H	C-H	C-H	C-CN	G6	H
1 - 75	C-NO ₂	C-H	C-H	C-H	C-CN	G8	H
1 - 76	C-Cl	C-Cl	C-H	C-H	C-CN	G6	H
1 - 77	C-Cl	C-Cl	C-H	C-H	C-CN	G8	H
1 - 78	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H	C-CN	G6	H
1 - 79	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H	C-CN	G8	H
1 - 80	C-CH ₃	C-H	C-H	C-H	C-CN	G6	H
1 - 81	C-OCH ₃	C-H	C-H	C-H	C-CN	G6	H
1 - 82	C-CN	C-H	C-H	C-H	C-CN	G6	H
1 - 83	C-OCF ₃	C-H	C-H	C-H	C-CN	G6	H
1 - 84	C-SCH ₃	C-H	C-H	C-H	C-CN	G6	H
1 - 85	C-S(O)CH ₃	C-H	C-H	C-H	C-CN	G6	H
1 - 86	C-S(O) ₂ CH ₃	C-H	C-H	C-H	C-CN	G6	H
1 - 87	C-SCF ₃	C-H	C-H	C-H	C-CN	G6	H
1 - 88	C-S(O)CF ₃	C-H	C-H	C-H	C-CN	G6	H
1 - 89	C-S(O) ₂ CF ₃	C-H	C-H	C-H	C-CN	G6	H
1 - 90	C-OH	C-H	C-H	C-H	C-CN	G6	H
1 - 91	C-SH	C-H	C-H	C-H	C-CN	G6	H
1 - 92	C-Cl	C-H	C-Cl	N	C-Br	G6	H
1 - 93	C-Cl	C-H	C-Cl	N	C-CN	G6	H
1 - 94	C-Br	C-H	C-Br	C-H	C-CN	G6	H
1 - 95	C-Cl	C-Cl	C-CF ₃	C-H	C-CN	G6	H
1 - 96	C-Cl	C-H	C-Cl	N	C-CN	G2	4-CN
1 - 97	C-Cl	C-H	C-Cl	N	C-CN	G2	4-NO ₂
1 - 98	C-Cl	C-H	C-Cl	N	C-CN	G2	4-Cl
1 - 99	C-Cl	C-H	C-Cl	N	C-CN	G8	5-CH ₃
1 - 100	C-Cl	C-H	C-Cl	N	C-CN	G9	5-CH ₃
1 - 101	C-Cl	C-H	C-Cl	N	C-CN	G2	3-CH ₃ , 5-NH ₂

(continuación)

N°	B ¹	B ²	B ³	A ²	A ³	G	(Z) _k
1 - 102	C-Cl	C-H	C-Cl	N	C-CN	G2	3-CH3, 5-NHCOCH3
1 - 103	C-CH3	C-NO ₂	C-CH3	C-H	C-CN	G6	H

Tabla 2 (Los Ejemplos de la Tabla 2 no están de acuerdo con la invención)



N°	B'	B ²	B ³	A ²	A ³	R'	R ²	R ³	R'	R ²	R ³
2 - 1	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-H						H
2 - 2	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-H						MeCO
2 - 3	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-H						MeCO
2 - 4	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-H						2-py-CO
2 - 5	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-H						HCO
2 - 6	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-H						MeCO
2 - 7	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-H						2-py-CH ₂
2 - 8	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-H						EtCO
2 - 9	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-H						Me ₂ NCO
2 - 10	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-H						MeSO ₂
2 - 11	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-H						2-py-CH ₂
2 - 12	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-H						2-py-CH ₂
2 - 13	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-H						2-py-CH ₂
2 - 14	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-H						H
2 - 15	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-H						MeCO
2 - 16	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-H						MeCO
2 - 17	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-H						MeCO
2 - 18	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-H						MeCO
2 - 19	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-H						EtCO
2 - 20	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-H						n-PrCO
2 - 21	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-H						Iso-PrCO
2 - 22	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-H						terc-BuCO
2 - 23	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-H						CF ₃ CO
2 - 24	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-H						PhCO
2 - 25	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-H						2-py-CO
2 - 26	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-H						3-py-CO
2 - 27	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-H						4-py-CO
2 - 28	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-H						2-F-PhCO

(continuación)

Nº	B ¹	B ²	B ³	A ²	A ³	R ¹	R ²	R ⁴	R ³
2-29	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-Br	H	H	3-F-PhCO	H
2-30	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-Br	H	H	4-F-PhCO	H
2-31	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-Br	H	H	2-Cl-PhCO	H
2-32	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-Br	H	H	3-Cl-PhCO	H
2-33	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-Br	H	H	4-Cl-PhCO	H
2-34	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-Br	H	H	2-Br-PhCO	H
2-35	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-Br	H	H	2-Me-PhCO	H
2-36	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-Br	H	H	CH ₂ =CH-CO	H
2-37	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-Br	H	H	HC≡C-CO	H
2-38	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-Br	H	H	MeSO ₂	H
2-39	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-Br	H	H	CF ₃ SO ₂	H
2-40	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-Br	H	H	MeNHCO	H
2-41	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-Br	H	H	Me ₂ NCO	H
2-42	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-Br	H	H	MeOC(=O)	H
2-43	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-Br	H	H	MeSC(=O)	H
2-44	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-Br	H	H	MeCS	H
2-45	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-Br	H	H	MeON(Me)CO	H
2-46	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-Br	H	H	MeCO	Me
2-47	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-Br	H	H	MeCO	Et
2-48	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-Br	H	H	MeCO	XOIXO
2-49	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-Br	H	H	MeCO	HC≡C-CH ₂ -
2-50	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-Br	H	H	MeCO	PhCH ₂
2-51	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-Br	H	H	MeCO	CN
2-52	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-Br	H	H	MeCO	CH ₂ CF ₃
2-53	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-Br	H	H	MeCO	cyc-Pr
2-54	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-Br	H	H	-C(O)CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	
2-55	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-Br	H	H	-CO-NMe-N=N-	
2-56	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-Br	H	H	-C(=N-NO ₂)-NH-CH ₁ CH ₂ -	
2-57	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-F	H	H	MeCO	H
2-58	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-Cl	H	H	MeCO	H
2-59	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-Cl	H	H	MeCO	H
2-60	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-NO ₂	H	H	MeCO	H
2-61	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-CN	H	H	MeCO	2-py-CH ₂
2-62	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-CN	H	H	MeCO	H
2-63	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-Me	H	H	MeCO	H
2-64	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-Me	H	H	MeCO	2-py-CH ₂
2-65	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-SMe	H	H	MeCO	H
2-66	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-S(O)Me	H	H	MeCO	H
2-67	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-S(O) ₂ Me	H	H	MeCO	H
2-68	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-SCF ₃	H	H	MeCO	H
2-69	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-S(OCF ₃)	H	H	MeCO	H
2-70	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-S(O) ₂ CF ₃	H	H	MeCO	H
2-71	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-OCF ₃	H	H	MeCO	H

(continuación)

Nº	B ¹	B ²	B ³	A ²	A ³	R ¹	R ²	R ⁴	R ³
2-72	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-OCF ₃	H	H	MeCO	H
2-73	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-OH	H	H	MeCO	H
2-74	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-SH	H	H	MeCO	H
2-75	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-NH ₂	H	H	MeCO	H
2-76	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-NHCOCH ₃	H	H	MeCO	H
2-77	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-NHCO ₂ CH ₃	H	H	MeCO	H
2-78	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-NHCO ₂ CH ₂ CCl ₃	H	H	MeCO	H
2-79	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-Br	Me	H	MeCO	H
2-80	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-Br	Me	Me	MeCO	H
2-81	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-H	cyc-Pr	H	MeCO	H
2-82	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-H	CF ₃	H	MeCO	H
2-83	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-H	CO ₂ Me	H	MeCO	H
2-84	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-H	CH ₂ =CH	H	MeCO	H
2-85	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-H	HC≡C	H	MeCO	H
2-86	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-H	-CH ₂ CH ₂	H	MeCO	H
2-87	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-H	H	H	MeCO	H
2-88	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-H	H	H	MeCO	NH ₂
2-89	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-H	H	H	MeCO	-NHCOMe
2-90	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-Br	H	H	MeCO	-N=CMe ₂
2-91	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-H	H	H	MeCO	OH
2-92	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-H	H	H	MeCO	OMe
2-93	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-Br	H	H	MeCO	H
2-94	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H	C-Br	H	H	MeCO	H
2-95	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H	C-Br	H	H	MeCO	H
2-96	C-Cl	C-Me	C-Cl	C-H	C-Br	H	H	MeCO	H
2-97	C-F	C-F	C-F	C-H	C-Br	H	H	MeCO	H
2-98	C-Br	C-Br	C-Br	C-H	C-Br	H	H	MeCO	H
2-99	C-Cl	C-CF ₃	C-Cl	C-H	C-Br	H	H	MeCO	H
2-100	C-Cl	C-Cl	C-CF ₃	C-H	C-Br	H	H	MeCO	H
2-101	C-Cl	C-Br	C-Cl	C-H	C-Br	H	H	MeCO	H
2-102	C-Br	C-Cl	C-Br	C-H	C-Br	H	H	MeCO	H
2-103	C-Cl	C-NH ₂	C-Cl	C-H	C-Br	H	H	MeCO	H
2-104	C-Br	C-NH ₂	C-Br	C-H	C-Br	H	H	MeCO	H
2-105	C-F	C-F	C-F	C-H	C-Br	H	H	EtCO	H
2-106	C-Br	C-Br	C-Br	C-H	C-Br	H	H	EtCO	H
2-107	C-Cl	C-CF ₃	C-Cl	C-H	C-Br	H	H	EtCO	H
2-108	C-Cl	C-Cl	C-CF ₃	C-H	C-Br	H	H	EtCO	H
2-109	C-Cl	C-Br	C-Cl	C-H	C-Br	H	H	EtCO	H
2-110	C-Br	C-Cl	C-Br	C-H	C-Br	H	H	EtCO	H
2-111	C-Cl	C-NH ₂	C-Cl	C-H	C-Br	H	H	EtCO	H
2-112	C-Br	C-NH ₂	C-Br	C-H	C-Br	H	H	EtCO	H
2-113	C-F	C-H	C-H	C-H	C-Br	H	H	MeCO	H
2-114	C-Cl	C-H	C-H	C-H	C-Br	H	H	MeCO	H

(continuación)

Nº	B ¹	B ²	B ³	A ²	A ³	R ¹	R ²	R ⁴	R ³
2-115	C-CF ₃	C-H	C-H	C-H	C-Br	H	H	MeCO	H
2-116	C-H	C-CF ₃	C-H	C-H	C-Br	H	H	MeCO	H
2-117	C-CF ₃	C-H	C-CF ₃	C-H	C-Br	H	H	MeCO	H
2-118	C-NO ₂	C-H	C-H	C-H	C-Br	H	H	MeCO	H
2-119	C-Cl	C-H	C-Cl	N	C-H	H	H	MeCO	H
2-120	C-CH ₃	C-H	C-H	C-H	C-H	H	H	MeCO	H
2-121	C-OCH ₃	C-H	C-H	C-H	C-Br	H	H	MeCO	H
2-122	C-CN	C-H	C-H	C-H	C-Br	H	H	MeCO	H
2-123	C-OCF ₃	C-H	C-H	C-H	C-H	H	H	MeCO	H
2-124	C-SCH ₃	C-H	C-H	C-H	C-H	H	H	MeCO	H
2-125	C-S(O)CH ₃	C-H	C-H	C-H	C-H	H	H	MeCO	H
2-126	C-S(O) ₂ CH ₃	C-H	C-H	C-H	C-H	H	H	MeCO	H
2-127	C-SCF ₃	C-H	C-H	C-H	C-H	H	H	MeCO	H
2-128	C-S(OCF ₃)	C-H	C-H	C-H	C-H	H	H	MeCO	H
2-129	C-S(O) ₂ CF ₃	C-H	C-H	C-H	C-H	H	H	MeCO	H
2-130	C-OH	C-H	C-H	C-H	C-H	H	H	MeCO	H
2-131	C-SH	C-H	C-H	C-H	C-H	H	H	MeCO	H
2-132	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-Br	H	H	MeCO	H
2-133	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H	C-Br	H	H	MeCO	H
2-134	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H	C-Br	H	H	MeCO	H
2-135	C-Cl	C-Me	C-Cl	C-H	C-Br	H	H	MeCO	H
2-136	C-F	C-F	C-F	C-H	C-Br	H	H	MeCO	H
2-137	C-Br	C-Br	C-Br	C-H	C-Br	H	H	MeCO	H
2-138	C-Cl	C-CF ₃	C-Cl	C-H	C-Br	H	H	MeCO	H
2-139	C-Cl	C-Cl	C-CF ₃	C-H	C-Br	H	H	MeCO	H
2-140	C-Cl	C-Br	C-Cl	C-H	C-Br	H	H	MeCO	H
2-141	C-Br	C-Cl	C-Br	C-H	C-Br	H	H	MeCO	H
2-142	C-Cl	C-NH ₂	C-Cl	C-H	C-Br	H	H	MeCO	H
2-143	C-Br	C-NH ₂	C-Br	C-H	C-Br	H	H	MeCO	H
2-144	C-F	C-F	C-F	C-H	C-Br	H	H	EtCO	H
2-145	C-Br	C-Br	C-Br	C-H	C-Br	H	H	EtCO	H
2-146	C-Cl	C-CF ₃	C-Cl	C-H	C-Br	H	H	EtCO	H
2-147	C-Cl	C-Cl	C-CF ₃	C-H	C-Br	H	H	EtCO	H
2-148	C-Cl	C-Br	C-Cl	C-H	C-Br	H	H	EtCO	H
2-149	C-Br	C-Cl	C-Br	C-H	C-Br	H	H	EtCO	H
2-150	C-Cl	C-NH ₂	C-Cl	C-H	C-Br	H	H	EtCO	H
2-151	C-Br	C-NH ₂	C-Br	C-H	C-Br	H	H	EtCO	H
2-152	C-F	C-H	C-H	C-H	C-Br	H	H	MeCO	H
2-153	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-Br	H	H	cyc-PtCO	H
2-154	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-Br	H	H	CF ₃ CH ₂ CO	H
2-155	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H	C-Cl	H	H	HCO	H
2-156	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H	C-Cl	H	H	MeCO	H

(continuación)

N°	B ¹	B ²	B ³	A ²	A ³	R ¹	R ²	R ⁴	R ³
2 - 157	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H		C-Cl	H	EtCO	H
2 - 158	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H		C-Cl	H	cyc-PrCO	H
2 - 159	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H		C-Cl	H	CF ₃ CH ₂ CO	H
2 - 160	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H		C-CF ₃	H	MeCO	H
2 - 161	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H		C-CF ₃	H	MeCO	H
2 - 162	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H		C-CF ₃	H	EtCO	H
2 - 163	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H		C-CF ₃	H	c-PrCO	H
2 - 164	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H		C-CF ₃	H	CF ₃ CH ₂ CO	H
2 - 165	C-CF ₃	C-H	C-CF ₃	C-H		C-CF ₃	H	MeCO	H
2 - 166	C-CF ₃	C-H	C-CF ₃	C-H		C-CF ₃	H	EtCO	H
2 - 167	C-CF ₃	C-H	C-CF ₃	C-H		C-CF ₃	H	cyc-PrCO	H
2 - 168	C-CF ₃	C-H	C-CF ₃	C-H		C-CF ₃	H	CF ₃ CH ₂ CO	H
2 - 169	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H		C-Br	H	EtCO	H
2 - 170	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H		C-Br	H	cyc-PrCO	H
2 - 171	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H		C-Br	H	CF ₃ CH ₂ CO	H
2 - 172	C-Cl	C-Cl	C-CF ₃	C-H		C-Br	H	cyc-PrCO	H
2 - 173	C-Cl	C-Cl	C-CF ₃	C-H		C-Br	H	CF ₃ CH ₂ CO	H
2 - 174	C-Br	C-H	C-Br	C-H		C-Br	H	MeCO	H
2 - 175	C-Br	C-H	C-Br	C-H		C-Br	H	EtCO	H
2 - 176	C-Br	C-H	C-Br	C-H		C-Br	H	cyc-PrCO	H
2 - 177	C-Br	C-H	C-Br	C-H		C-Br	H	CF ₃ CH ₂ CO	H
2 - 178	C-CF ₃	C-H	C-CF ₃	C-H		C-Br	H	EtCO	H
2 - 179	C-CF ₃	C-H	C-CF ₃	C-H		C-Br	H	cyc-PrCO	H
2 - 180	C-CF ₃	C-H	C-CF ₃	C-H		C-Br	H	CF ₃ CH ₂ CO	H
2 - 181	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H		C-CN	H	EtCO	H
2 - 182	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H		C-CN	H	cyc-PrCO	H
2 - 183	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H		C-CN	H	CF ₃ CH ₂ CO	H
2 - 184	C-Br	C-H	C-Br	C-H		C-CN	H	MeCO	H
2 - 185	C-Br	C-H	C-Br	C-H		C-CN	H	CF ₃ CH ₂ CO	H
2 - 186	C-CF ₃	C-H	C-CF ₃	C-H		C-CN	H	MeCO	H
2 - 187	C-CF ₃	C-H	C-CF ₃	C-H		C-CN	H	EtCO	H
2 - 188	C-CF ₃	C-H	C-CF ₃	C-H		C-CN	H	cyc-PrCO	H
2 - 189	C-CF ₃	C-H	C-CF ₃	C-H		C-CN	H	CF ₃ CH ₂ CO	H
2 - 190	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H		C-CN	H	MeCO	H
2 - 191	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H		C-CN	H	EtCO	H
2 - 192	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H		C-CN	H	cyc-PrCO	H
2 - 193	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H		C-CN	H	CF ₃ CH ₂ CO	H
2 - 194	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H		C-Br	H	H	H
2 - 195	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H		C-Br	H	EtNHCO	H
2 - 196	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H		C-Br	H	n-PrNHCO	H
2 - 197	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H		C-CF ₃	H	terc-BuOCO	H
2 - 198	C-CF ₃	C-Cl	C-CF ₃	C-H		C-CF ₃	H	terc-BuOCO	H
2 - 199	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H		C-Cl	H	EtNHCO	H

(continuación)

Nº	B ¹	B ²	B ³	A ²	A ³	R ¹	R ²	R ⁴	R ³
2-200	C-CF ₃	C-H	C-CF ₃	C-H		C-CF ₃	H	EtNHCO	H
2-201	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H		C-CF ₃	H	EtNHCO	H
2-202	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H		C-Br	H	terc-BuOCO	H
2-203	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H		C-Br	H	CF ₃ CO	H
2-204	C-Cl	C-Cl	C-CF ₃	C-H		C-CF ₃	H	CH ₃ CO	H
2-205	C-Cl	C-Cl	C-CF ₃	C-H		C-CF ₃	H	EtCO	H
2-206	C-Cl	C-Cl	C-CF ₃	C-H		C-CF ₃	H	CF ₃ CH ₂ CO	H
2-207	C-Cl	C-Cl	C-CF ₃	C-H		C-CF ₃	H	ciclo-PrCO	H
2-208	C-Cl	C-Cl	C-CF ₃	C-H		C-CF ₃	H	EtNHCO	H
2-209	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H		C-CF ₃	H	CHSSCH ₂ Co	H
2-210	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H		C-CF ₃	H	EtCO	H
2-211	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H		C-CF ₃	H	CF ₃ CH ₂ CO	H
2-212	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H		C-CF ₃	H	ciclo-PrCO	H
2-213	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H		C-CF ₃	H	EtNHCO	H
2-214	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H		C-CF ₃	H	CH ₃ SCH ₂ CO	H
2-215	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H		C-CF ₃	H	CH ₃ SOCH ₂ CO	H
2-216	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H		C-CF ₃	H	CH ₃ SO ₂ CH ₂ CO	H
2-217	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H		C-CF ₃	H	CH ₃ SOCH ₂ C O	H
2-218	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H		C-CF ₃	H	CH ₃ SO ₂ CH ₂ C O	H
2-219	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H		C-Me	H	MeCO	H
2-220	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H		C-Me	H	EtCO	H
2-221	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H		C-Me	H	CF ₃ CH ₂ CO	H
2-222	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H		C-Me	H	ciclo-PrCO	H
2-223	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H		C-Me	H	EtNHCO	H
2-224	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H		C-Me	H	CH ₃ SCH ₂ CO	H
2-225	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H		C-Me	H	CH ₃ SOCH ₂ CO	H
2-226	C-CF ₃	C-H	C-CF ₃	C-H		C-Me	H	MeCO	H
2-227	C-CF ₃	C-H	C-CF ₃	C-H		C-Me	H	EtCO	H
2-228	C-CF ₃	C-H	C-CF ₃	C-H		C-Me	H	CF ₃ CH ₂ CO	H
2-229	C-CF ₃	C-H	C-CF ₃	C-H		C-Me	H	ciclo-PrCO	H
2-230	C-CF ₃	C-H	C-CF ₃	C-H		C-Me	H	EtNHCO	H
2-231	C-CF ₃	C-H	C-CF ₃	C-H		C-Me	H	CH ₃ SCH ₂ CO	H
2-232	C-CF ₃	C-H	C-CF ₃	C-H		C-Me	H	CH ₃ SOCH ₂ C O	H
2-233	C-CF ₃	C-H	C-CF ₃	C-H		C-Me	H	CH ₃ SO ₂ CH ₂ CO	H
2-234	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H		C-NO ₂	H	MeCO	H
2-235	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H		C-NO ₂	H	EtCO	H
2-236	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H		C-NO ₂	H	CF ₃ CH ₂ CO	H
2-237	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H		C-NO ₂	H	ciclo-PrCO	H
2-238	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H		C-NO ₂	H	EtNHCO	H
2-239	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H		C-NO ₂	H	CH ₃ SCH ₂ CO	H
2-240	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H		C-NO ₂	H	CH ₃ SOCH ₂ CO	H
2-241	C-CF ₃	C-H	C-CF ₃	C-H		C-NO ₂	H	MeCO	H
2-242	C-CF ₃	C-H	C-CF ₃	C-H		C-NO ₂	H	EtCO	H

(continuación)

Nº	B ¹	B ²	B ³	A ²	A ³	R ¹	R ²	R ⁴	R ³
2-243	C-CF ₃	C-H	C-CF ₃	C-H		C-NO ₂	H	CF ₃ CH ₂ CO	H
2-244	C-CF ₃	C-H	C-CF ₃	C-H		C-NO ₂	H	ciclo-PrCO	H
2-245	C-CF ₃	C-H	C-CF ₃	C-H		C-NO ₂	H	EtNHCO	H
2-246	C-CF ₃	C-H	C-CF ₃	C-H		C-NO ₂	H	CH ₃ SCH ₂ CO	H
2-247	C-CF ₃	C-H	C-CF ₃	C-H		C-NO ₂	H	CH ₃ SOCH ₂ CO	H
2-248	C-CF ₃	C-H	C-CF ₃	C-H		C-NO ₂	H	CH ₃ SO ₂ CH ₂ CO	H
2-249	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H		C-F	H	MeCO	H
2-250	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H		C-F	H	EtCO	H
2-251	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H		C-F	H	CF ₃ CH ₂ CO	H
2-252	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H		C-F	H	ciclo-PrCO	H
2-253	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H		C-F	H	EtNHCO	H
2-254	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H		C-F	H	CH ₃ SCH ₂ CO	H
2-255	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H		C-F	H	CH ₃ SOCH ₂ CO	H
2-256	C-CF ₃	C-H	C-CF ₃	C-H		C-F	H	MeCO	H
2-257	C-CF ₃	C-H	C-CF ₃	C-H		C-F	H	EtCO	H
2-258	C-CF ₃	C-H	C-CF ₃	C-H		C-F	H	CF ₃ CH ₂ CO	H
2-259	C-CF ₃	C-H	C-CF ₃	C-H		C-F	H	ciclo-PrCO	H
2-260	C-CF ₃	C-H	C-CF ₃	C-H		C-F	H	EtNHCO	H
2-261	C-CF ₃	C-H	C-CF ₃	C-H		C-F	H	CH ₃ SCH ₂ CO	H
2-262	C-CF ₃	C-H	C-CF ₃	C-H		C-F	H	CH ₃ SOCH ₂ CO	H
2-263	C-CF ₃	C-H	C-CF ₃	C-H		C-F	H	CH ₃ SO ₂ CH ₂ CO	H
2-264	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H		C-Cl	H	CH ₃ SCH ₂ CO	H
2-265	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H		C-Cl	H	CH ₃ SOCH ₂ CO	H
2-266	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H		C-Cl	H	CH ₃ SO ₂ CH ₂ CO	H
2-267	C-CF ₃	C-H	C-CF ₃	C-H		C-Cl	H	MeCO	H
2-268	C-CF ₃	C-H	C-CF ₃	C-H		C-Cl	H	EtCO	H
2-269	C-CF ₃	C-H	C-CF ₃	C-H		C-Cl	H	CF ₃ CH ₂ CO	H
2-270	C-CF ₃	C-H	C-CF ₃	C-H		C-Cl	H	ciclo-PrCO	H
2-271	C-CF ₃	C-H	C-CF ₃	C-H		C-Cl	H	EtNHCO	H
2-272	C-CF ₃	C-H	C-CF ₃	C-H		C-Cl	H	CH ₃ SCH ₂ CO	H
2-273	C-CF ₃	C-H	C-CF ₃	C-H		C-Cl	H	CH ₃ SOCH ₂ CO	H
2-274	C-CF ₃	C-H	C-CF ₃	C-H		C-Cl	H	CH ₃ SO ₂ CH ₂ CO	H
2-275	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H		C-Br	H	CH ₃ SCH ₂ CO	H
2-276	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H		C-Br	H	CH ₃ SOCH ₂ CO	H
2-277	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H		C-Br	H	CH ₃ SO ₂ CH ₂ CO	H
2-278	C-CF ₃	C-H	C-CF ₃	C-H		C-Br	H	CH ₃ SCH ₂ CO	H
2-279	C-CF ₃	C-H	C-CF ₃	C-H		C-Br	H	CH ₃ SOCH ₂ CO	H
2-280	C-CF ₃	C-H	C-CF ₃	C-H		C-Br	H	CH ₃ SO ₂ CH ₂ CO	H
2-281	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H		C-Cl	H	MeCO	H
2-282	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H		C-Cl	H	EtCO	H
2-283	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H		C-Cl	H	CF ₃ CH ₂ CO	H
2-284	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H		C-Cl	H	ciclo-PrCO	H
2-285	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H		C-Cl	H	EtNHCO	H

(continuación)

Nº	B ¹	B ²	B ³	A ²	A ³	R ¹	R ²	R ⁴	R ³
2-286	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H		C-1	H	CH ₃ SCH ₂ CO	H
2-287	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H		C-1	H	CH ₃ SOCH ₂ C O	H
2-288	C-CF ₃	C-H	C-CF ₃	C-H		C-1	H	MeCO	H
2-289	C-CF ₃	C-H	C-CF ₃	C-H		C-1	H	EtCO	H
2-290	C-CF ₃	C-H	C-CF ₃	C-H		C-1	H	CF ₃ CH ₂ CO	H
2-291	C-CF ₃	C-H	C-CF ₃	C-H		C-1	H	ciclo-PrCO	H
2-292	C-CF ₃	C-H	C-CF ₃	C-H		C-1	H	EtNHCO	H
2-293	C-CF ₃	C-H	C-CF ₃	C-H		C-1	H	CH ₃ SCH ₂ CO	H
2-294	C-CF ₃	C-H	C-CF ₃	C-H		C-1	H	CH ₃ SOCH ₂ CO	H
2-295	C-CF ₃	C-H	C-CF ₃	C-H		C-1	H	CH ₃ SO ₂ CH ₂ CO	H
2-296	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H		C-SMe	H	MeCO	H
2-297	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H		C-SMe	H	EtCO	H
2-298	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H		C-SMe	H	CF ₃ CH ₂ CO	H
2-299	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H		C-SMe	H	ciclo-PrCO	H
2-300	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H		C-SMe	H	EtNHCO	H
2-301	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H		C-SMe	H	CH ₃ SCH ₂ CO	H
2-302	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H		C-SMe	H	CH ₃ SOCH ₂ C O	H
2-303	C-CF ₃	C-H	C-CF ₃	C-H		C-SMe	H	MeCO	H
2-304	C-CF ₃	C-H	C-CF ₃	C-H		C-SMe	H	EtCO	H
2-305	C-CF ₃	C-H	C-CF ₃	C-H		C-SMe	H	CF ₃ CH ₂ CO	H
2-306	C-CF ₃	C-H	C-CF ₃	C-H		C-SMe	H	ciclo-PrCO	H
2-307	C-CF ₃	C-H	C-CF ₃	C-H		C-SMe	H	EtNHCO	H
2-308	C-CF ₃	C-H	C-CF ₃	C-H		C-SMe	H	CH ₃ SCH ₂ CO	H
2-309	C-CF ₃	C-H	C-CF ₃	C-H		C-SMe	H	CH ₃ SOCH ₂ C O	H
2-310	C-CF ₃	C-H	C-CF ₃	C-H		C-SMe	H	CH ₃ SO ₂ CH ₂ C O	H
2-311	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H		C-SCF ₃	H	MeCO	H
2-312	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H		C-SCF ₃	H	EtCO	H
2-313	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H		C-SCF ₃	H	CF ₃ CH ₂ CO	H
2-314	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H		C-SCF ₃	H	ciclo-PrCO	H
2-315	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H		C-SCF ₃	H	EtNHCO	H
2-316	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H		C-SCF ₃	H	CH ₃ SCH ₂ CO	H
2-317	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H		C-SCF ₃	H	CH ₃ SOCH ₂ C O	H
2-318	C-CF ₃	C-H	C-CF ₃	C-H		C-SCF ₃	H	MeCO	H
2-319	C-CF ₃	C-H	C-CF ₃	C-H		C-SCF ₃	H	EtCO	H
2-320	C-CF ₃	C-H	C-CF ₃	C-H		C-SCF ₃	H	CF ₃ CH ₂ CO	H
2-321	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H		C-SCF ₃	H	MeCO	H
2-322	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H		C-SCF ₃	H	EtCO	H
2-323	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H		C-SCF ₃	H	CF ₃ CH ₂ CO	H
2-324	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H		C-CF ₃	H	ciclo-PrCH ₂ CO	H
2-325	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H		C-CF ₃	H	MeCOCH ₂ CO	H
2-326	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H		C-CF ₃	H	ciclo-PrNHCO	H
2-327	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H		C-CF ₃	H	CH ₃ CH ₂ NHCO	H
2-328	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H		C-CF ₃	H	CH ₂ =CHCH ₂ NHCO	H

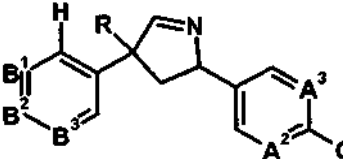
(continuación)

Nº	B ¹	B ²	B ³	A ²	A ³	R ¹	R ²	R ⁴	R ³
2-329	C-CF ₃	C-H	C-H	C-H	C-CF ₃	H	H	MeCO	H
2-330	C-CF ₃	C-H	C-H	C-H	C-CF ₃	H	H	EtCO	H
2-331	C-CF ₃	C-H	C-H	C-H	C-CF ₃	H	H	CF ₃ CH ₂ CO	H
2-332	C-CF ₃	C-F	C-H	C-H	C-CF ₃	H	H	MeCO	H
2-333	C-CF ₃	C-F	C-H	C-H	C-CF ₃	H	H	EtCO	H
2-334	C-CF ₃	C-F	C-H	C-H	C-CF ₃	H	H	ciclo-PrCO	H
2-335	C-CF ₃	C-H	C-Cl	C-H	C-CF ₃	H	H	MeCO	H
2-336	C-CF ₃	C-H	C-Cl	C-H	C-CF ₃	H	H	EtCO	H
2-337	C-CF ₃	C-H	C-Cl	C-H	C-CF ₃	H	H	EtNHCO	H
2-338	C-Br	C-H	C-Br	C-H	C-CF ₃	H	H	MeCO	H
2-339	C-Br	C-H	C-Br	C-H	C-CF ₃	H	H	EtCO	H
2-340	C-Br	C-H	C-Br	C-H	C-CF ₃	H	H	ciclo-PrCH ₂ CO	H
2-341	C-Cl	C-CF ₃	C-Cl	C-H	C-CF ₃	H	H	MeCO	H
2-342	C-Cl	C-CF ₃	C-Cl	C-H	C-CF ₃	H	H	EtCO	H
2-343	C-Cl	C-CF ₃	C-Cl	C-H	C-CF ₃	H	H	ciclo-PrCH ₂ CO	H
2-344	C-Cl	C-Cl	C-H	C-H	C-CF ₃	H	H	MeCO	H
2-345	C-Cl	C-Cl	C-H	C-H	C-CF ₃	H	H	EtCO	H
2-346	C-Cl	C-Cl	C-H	C-H	C-CF ₃	H	H	ciclo-PrCO	H
2-347	C-F	C-F	C-F	C-H	C-CF ₃	H	H	MeCO	H
2-348	C-F	C-F	C-F	C-H	C-CF ₃	H	H	EtCO	H
2-349	C-F	C-F	C-F	C-H	C-CF ₃	H	H	EtNHCO	H
2-350	C-OCF ₃	C-H	C-H	C-H	C-CF ₃	H	H	MeCO	H
2-351	C-OCF ₃	C-H	C-H	C-H	C-CF ₃	H	H	EtCO	H
2-352	C-OCF ₃	C-H	C-H	C-H	C-CF ₃	H	H	ciclo-PrCH ₂ CO	H
2-353	C-NO ₂	C-H	C-H	C-H	C-CF ₃	H	H	MeCO	H
2-354	C-NO ₂	C-H	C-H	C-H	C-CF ₃	H	H	EtCO	H
2-355	C-NO ₂	C-H	C-H	C-H	C-CF ₃	H	H	CF ₃ CH ₂ CO	H
2-356	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H	C-CF ₃	Me	H	MeCO	H
2-357	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H	C-CF ₃	Me	H	EtCO	H
2-358	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H	C-CF ₃	Me	H	CF ₃ CH ₂ CO	H
2-359	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H	C-CF ₃	Me	H	ciclo-PrCO	H
2-360	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H	C-CF ₃	Me	H	EtNHCO	H
2-361	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H	C-CF ₃	Me	H	CH ₃ SOCH ₂ CO	H
2-362	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H	C-CF ₃	Me	H	CH ₃ SOCH ₂ CO	H
2-363	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H	C-CF ₃	Me	H	CH ₃ SO ₂ CH ₂ CO	H
2-364	C-CF ₃	C-H	C-CF ₃	C-H	C-CF ₃	Me	H	MeCO	H
2-365	C-CF ₃	C-H	C-CF ₃	C-H	C-CF ₃	Me	H	EtCO	H
2-366	C-CF ₃	C-H	C-CF ₃	C-H	C-CF ₃	Me	H	CF ₃ CH ₂ CO	H
2-367	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H	C-Br	Me	H	MeCO	H
2-368	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H	C-Br	Me	H	EtCO	H
2-369	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H	C-Br	Me	H	ciclo-PrCO	H
2-370	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H	C-CF ₃	Me	Me	MeCO	H
2-371	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H	C-CF ₃	Me	Me	EtCO	H

(continuación)

Nº	B ¹	B ²	B ³	A ²	A ³	R ¹	R ²	R ⁴	R ³
2 - 372	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H		C-CF ₃	Me	CF ₃ CH ₂ CO	H
2 - 373	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H		C-CF ₃	Me	ciclo-PrCO	H
2 - 374	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H		C-CF ₃	Me	EtNHCO	H
2 - 375	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H		C-CF ₃	Me	CH ₃ SOCH ₂ CO	H
2 - 376	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H		C-CF ₃	Me	CH ₃ SOCH ₂ CO	H
2 - 377	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H		C-CF ₃	Me	CH ₃ SO ₂ CH ₂ CO	H
2 - 378	C-CF ₃	C-H	C-CF ₃	C-H		C-CF ₃	Me	MeCO	H
2 - 379	C-CF ₃	C-H	C-CF ₃	C-H		C-CF ₃	Me	EtCO	H
2 - 380	C-CF ₃	C-H	C-CF ₃	C-H		C-CF ₃	Me	CF ₃ CH ₂ CO	H
2 - 381	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H		C-Br	Me	MeCO	H
2 - 382	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H		C-Br	Me	EtCO	H
2 - 383	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H		C-Br	Me	ciclo-PrCO	H
2 - 384	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H		C-Br	-CH ₂ CH ₂ -	MeCO	H
2 - 385	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H		C-Br	-CH ₂ CH ₂ -	EtCO	H
2 - 386	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H		C-Br	-CH ₂ CH ₂ -	EtNHCO	H
2 - 387	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H		C-Br	-CH ₂ CH ₂ -	CF ₃ CH ₂ CO	H
2 - 388	C-CF ₃	C-H	C-CF ₃	C-H		C-Br	-CH ₂ CH ₂ -	MeCO	H
2 - 389	C-CF ₃	C-H	C-CF ₃	C-H		C-Br	-CH ₂ CH ₂ -	EtCO	H
2 - 390	C-CF ₃	C-H	C-CF ₃	C-H		C-Br	-CH ₂ CH ₂ -	EtNHCO	H
2 - 391	C-CF ₃	C-H	C-CF ₃	C-H		C-Br	-CH ₂ CH ₂ -	CF ₃ CH ₂ CO	H
2 - 392	C-CF ₃	C-Cl	C-CF ₃	C-H		C-CF ₃	H	terc-BuOCO	H

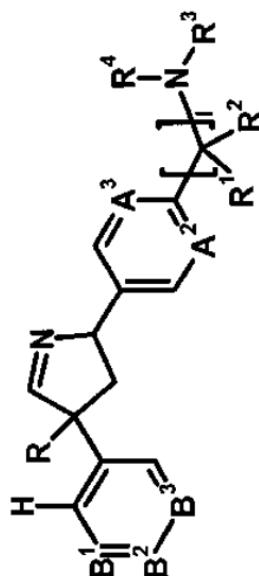
Tabla 3

								
Nº	B ¹	B ²	B ³	R	A ¹	A ²	G	(Z) _k
3 - 1	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-H	G1	H
3 - 2	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-H	G2	H
3 - 3	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-H	G3	H
3 - 4	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-H	G4	H
3 - 5	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-H	G5	H
3 - 6	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-H	G6	H
3 - 7	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-H	G7	H
3 - 8	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-H	G8	H
3 - 9	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-H	G9	H
3 - 10	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-F	G6	H
3 - 11	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-F	G8	H
3 - 12	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-F	G9	H
3 - 13	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-Cl	G6	H
3 - 14	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-Cl	G8	H
3 - 15	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-Cl	G9	H
3 - 16	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-Br	G1	H
3 - 17	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-Br	G2	H
3 - 18	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-Br	G3	H
3 - 19	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-Br	G4	H
3 - 20	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-Br	G5	H
3 - 21	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-Br	G6	H
3 - 22	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-Br	G7	H
3 - 23	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-Br	G8	H
3 - 24	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-Br	G9	H
3 - 25	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-I	G6	H
3 - 26	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-I	G8	H
3 - 27	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-I	G9	H
3 - 28	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-Me	G6	H
3 - 29	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-Me	G8	H
3 - 30	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-CF ₃	G6	H
3 - 31	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-CF ₃	G8	H
3 - 32	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-NO ₂	G6	H
3 - 33	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-NO ₂	G8	H
3 - 34	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-CN	G1	H
3 - 35	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-CN	G2	H
3 - 36	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-CN	G3	H
3 - 37	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-CN	G4	H
3 - 38	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-CN	G5	H
3 - 39	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-CN	G6	H
3 - 40	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-CN	G7	H
3 - 41	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-CN	G8	H
3 - 42	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-CN	G9	H
3 - 43	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-NO ₂	G6	H
3 - 44	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-NO ₂	G8	H
3 - 45	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-CH ₃	G6	H
3 - 46	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-Sme	G6	H
3 - 47	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-S(O)Me	G6	H
3 - 48	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-S(O) ₂ Me	G6	H
3 - 49	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-SCF ₃	G6	H
3 - 50	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-S(O)CF ₃	G6	H
3 - 51	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-S(O) ₂ CF ₃	G6	H
3 - 52	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-OCH ₃	G6	H
3 - 53	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-OCF ₃	G6	H
3 - 54	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-OH	G6	H

(continuación)

Nº	B ¹	B ²	B ³	R	A ¹	A ²	G	(Z) _k
3 - 55	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-SH	G6	H
3 - 56	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-NH ₂	G6	H
3 - 57	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-NHCOCH ₃	G6	H
3 - 58	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-NHCO ₂ CH ₃	G6	H
3 - 59	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-NHCO ₂ CH ₂ CCl ₃	G6	H
3 - 60	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-CN	G2	3-NO ₂
3 - 61	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-CN	G2	3-CN
3 - 62	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-CN	G6	3-NO ₂
3 - 63	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-CN	G6	3-CN
3 - 64	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-CN	G2	3-Cl
3 - 65	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-CN	G2	3-Br
3 - 66	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-CN	G2	3-CH ₃
3 - 67	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-CN	G2	3-CF ₃
3 - 68	C-Cl	C-H	C-H	CF ₃	C-H	C-CN	G6	H
3 - 69	C-Cl	C-H	C-H	CF ₃	C-H	C-CN	G8	H
3 - 70	C-CF ₃	C-H	C-H	CF ₃	C-H	C-CN	G6	H
3 - 71	C-CF ₃	C-H	C-H	CF ₃	C-H	C-CN	G8	H
3 - 72	C-CF ₃	C-H	C-CF ₃	CF ₃	C-H	C-CN	G6	H
3 - 73	C-CF ₃	C-H	C-CF ₃	CF ₃	C-H	C-CN	G8	H
3 - 74	C-NO ₂	C-H	C-H	CF ₃	C-H	C-CN	G6	H
3 - 75	C-NO ₂	C-H	C-H	CF ₃	C-H	C-CN	G8	H
3 - 76	C-Cl	C-Cl	C-H	CF ₃	C-H	C-CN	G6	H
3 - 77	C-Cl	C-Cl	C-H	CF ₃	C-H	C-CN	G8	H
3 - 78	C-Cl	C-Cl	C-Cl	CF ₃	C-H	C-CN	G6	H
3 - 79	C-Cl	C-Cl	C-Cl	CF ₃	C-H	C-CN	G8	H
3 - 80	C-CH ₃	C-H	C-H	CF ₃	C-H	C-CN	G6	H
3 - 81	C-OCH ₃	C-H	C-H	CF ₃	C-H	C-CN	G6	H
3 - 82	C-CN	C-H	C-H	CF ₃	C-H	C-CN	G6	H
3 - 83	C-OCF ₃	C-H	C-H	CF ₃	C-H	C-CN	G6	H
3 - 84	C-SCH ₃	C-H	C-H	CF ₃	C-H	C-CN	G6	H
3 - 85	C-S(O)CH ₃	C-H	C-H	CF ₃	C-H	C-CN	G6	H
3 - 86	C-S(O) ₂ CH ₃	C-H	C-H	CF ₃	C-H	C-CN	G6	H
3 - 87	C-SCF ₃	C-H	C-H	CF ₃	C-H	C-CN	G6	H
3 - 88	C-S(O)CF ₃	C-H	C-H	CF ₃	C-H	C-CN	G6	H
3 - 89	C-S(O) ₂ CF ₃	C-H	C-H	CF ₃	C-H	C-CN	G6	H
3 - 90	C-OH	C-H	C-H	CF ₃	C-H	C-CN	G6	H
3 - 91	C-SH	C-H	C-H	CF ₃	C-H	C-CN	G6	H
3 - 92	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	N	C-Br	G6	H
3 - 93	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	N	C-CN	G6	H

Tabla 4(Los Ejemplos de la tabla 4 no son de acuerdo con la invención)



N°	BI	B2	B3	R	A2	A3	R1	R2	R4	R3	I
4 - 1	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-H	H	H	MeCO	H	1
4 - 2	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-H	H	H	MeCO	MeCO	1
4 - 3	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-H	H	H	MeCO	2-py-CO	1
4 - 4	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-H	H	H	HCO	2-py-CH ₂	1
4 - 5	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-H	H	H	MeCO	2-py-CH ₂	1
4 - 6	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-H	H	H	EtCO	2-py-CH ₂	1
4 - 7	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-H	H	H	Me ₂ NCO	2-py-CH ₂	1
4 - 8	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-H	H	H	MeSO ₂	2-py-CH ₂	1
4 - 9	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-H	H	H	2-py-CO	2-py-CH ₂	1
4 - 10	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-H	GN	H	MeCO	H	1
4 - 11	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-H	GN	H	MeCO	2-py-CH ₂	1
4 - 12	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-Br	H	H	HCO	H	1
4 - 13	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-Br	H	H	MeCO	H	1
4 - 14	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-Br	H	H	MeCO	MeCO	1
4 - 15	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-Br	H	H	MeCO	2-py-CH ₂	1
4 - 16	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-Br	H	H	MeCO	3-py-CH ₂	1
4 - 17	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-Br	H	H	MeCO	4-py-CH ₂	1
4 - 18	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-Br	H	H	MeCO	Ph-CH ₂	1
4 - 19	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-Br	H	H	EtCO	H	1
4 - 20	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-Br	H	H	n-PrCO	H	1
4 - 21	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-Br	H	H	Iso-PrCO	H	1
4 - 22	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-Br	H	H	terc-BuOO	H	1
4 - 23	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-Br	H	H	CF ₃ CO	H	1
4 - 24	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-Br	H	H	PhCO	H	1
4 - 25	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-Br	H	H	2-py-CO	H	1
4 - 26	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-Br	H	H	3-py-CO	H	1
4 - 27	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-Br	H	H	4-py-CO	H	1
4 - 28	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-Br	H	H	2-F-PhCO	H	1
4 - 29	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-Br	H	H	3-F-PhCO	H	1
4 - 30	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-Br	H	H	4-F-PhCO	H	1

(continuación)

Nº	BI	B2	B3	R	A2	A3	R1	R2	R4	R3	I
4 - 31	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-Br	H	H	2-Cl-PhCO	H	1
4 - 32	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-Br	H	H	3-Cl-PhCO	H	1
4 - 33	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-Br	H	H	4-Cl-PhCO	H	1
4 - 34	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-Br	H	H	2-Br-PhCO	H	1
4 - 35	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-Br	H	H	2-Me-PhCO	H	1
4 - 36	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-Br	H	H	CH ₂ =CH-CO	H	1
4 - 37	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-Br	H	H	HC≡C-CO	H	1
4 - 38	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-Br	H	H	MeSO ₂	H	1
4 - 39	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-Br	H	H	CFSSO ₂	H	1
4 - 40	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-Br	H	H	MeNHCO	H	1
4 - 41	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-Br	H	H	Me ₂ NCO	H	1
4 - 42	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-Br	H	H	MeOC(=O)	H	1
4 - 43	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-Br	H	H	MeSC(=O)	H	1
4 - 44	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-Br	H	H	MeCS	H	1
4 - 45	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-Br	H	H	MeON(Me)CO	H	1
4 - 46	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-Br	H	H	MeCO	Me	1
4 - 47	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-Br	H	H	MeCO	Et	1
4 - 48	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-Br	H	H	MeCO	CH ₂ =CH-	1
4 - 49	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-Br	H	H	MeCO	HC≡C-CH ₂ -	1
4 - 50	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-Br	H	H	MeCO	PhCH ₂	1
4 - 51	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-Br	H	H	MeCO	CN	1
4 - 52	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-Br	H	H	MeCO	CH ₂ CFS	1
4 - 53	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-Br	H	H	MeCO	cyc-Pr	1
4 - 54	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-Br	H	H	-C(O)CH ₂ CH ₂ CH ₂ -	1	1
4 - 55	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-Br	H	H	-CO-NMe-N=N-	1	1
4 - 56	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-Br	H	H	C(=N-NO ₂)-NH-CH ₂ -CH ₂ -	1	1
4 - 57	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-F	H	H	MeCO	H	1
4 - 58	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-Cl	H	H	MeCO	H	1
4 - 59	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-I	H	H	MeCO	H	1
4 - 60	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-NO ₂	H	H	MeCO	H	1
4 - 61	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-CN	H	H	MeCO	2-py-CH ₂	1
4 - 62	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-CN	H	H	MeCO	H	1
4 - 63	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-Me	H	H	MeCO	H	1
4 - 64	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-Me	H	H	MeCO	2-py-CH ₂	1
4 - 65	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-SMe	H	H	MeCO	H	1
4 - 66	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-S(O)Me	H	H	MeCO	H	1
4 - 67	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-S(O) ₂ Me	H	H	MeCO	H	1
4 - 68	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-SCF ₃	H	H	MeCO	H	1
4 - 69	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-S(O)CF ₃	H	H	MeCO	H	1

(continuación)

Nº	BI	B2	B3	R	A2	A3	R1	R2	R4	R3	I
4-70	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-S(O) ₂ CF ₃	H	H	MeCO	H	1
4-71	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-OCH ₃	H	H	MeCO	H	1
4-72	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-OCF ₃	H	H	MeCO	H	1
4-73	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-OH	H	H	MeCO	H	1
4-74	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-SH	H	H	MeCO	H	1
4-75	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-NH ₂	H	H	MeCO	H	1
4-76	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-NHCOCH ₃	H	H	MeCO	H	1
4-77	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-NHCO ₂ CH ₃	H	H	MeCO	H	1
4-78	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-NHCO ₂ CH ₂ COCl ₃	H	H	MeCO	H	1
4-79	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-Br	Me	H	MeCO	H	1
4-80	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-Br	Me	Me	MeCO	H	1
4-81	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-H	cyc-Pr	H	MeCO	H	1
4-82	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-H	CFS	H	MeCO	H	1
4-83	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-H	CO ₂ Me	H	MeCO	H	1
4-84	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-H	HC ₂ =CH	H	MeCO	H	1
4-85	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-H	HC≡C	H	MeCO	H	1
4-86	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-H	-CH ₂ CH ₂ -	H	MeCO	H	1
4-87	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-H	H	H	MeCO	H	1
4-88	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-H	H	H	MeCO	NH ₂	1
4-89	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-H	H	H	MeCO	-NHCOMe	1
4-90	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-Br	H	H	MeCO	-N=CMMe ₂	1
4-91	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-H	H	H	MeCO	OH	1
4-92	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-H	H	H	MeCO	OMe	1
4-93	C-Cl	C-H	C-Cl	CH ₃	C-H	C-Br	H	H	MeCO	H	1
4-94	C-Cl	C-Cl	C-H	CH ₃	C-H	C-Br	H	H	MeCO	H	1
4-95	C-Cl	C-Cl	C-Cl	CH ₃	C-H	C-Br	H	H	MeCO	H	1
4-96	C-Cl	C-Me	C-Cl	CH ₃	C-H	C-Br	H	H	MeCO	H	1
4-97	C-F	C-F	C-F	CH ₃	C-H	C-Br	H	H	MeCO	H	1
4-98	C-Br	C-Br	C-Br	CH ₃	C-H	C-Br	H	H	MeCO	H	1
4-99	C-Cl	C-CF ₃	C-Cl	CH ₃	C-H	C-Br	H	H	MeCO	H	1
4-100	C-Cl	C-Cl	C-CF ₃	CH ₃	C-H	C-Br	H	H	MeCO	H	1
4-101	C-Cl	C-Br	C-Cl	CH ₃	C-H	C-Br	H	H	MeCO	H	1
4-102	C-Br	C-Cl	C-Br	CH ₃	C-H	C-Br	H	H	MeCO	H	1
4-103	C-Cl	C-NH ₂	C-Cl	CH ₃	C-H	C-Br	H	H	MeCO	H	1
4-104	C-Br	C-NH ₂	C-Br	CH ₃	C-H	C-Br	H	H	MeCO	H	1
4-105	C-F	C-F	C-F	CH ₃	C-H	C-Br	H	H	EtCO	H	1
4-106	C-Br	C-Br	C-Br	CH ₃	C-H	C-Br	H	H	EtCO	H	1
4-107	C-Cl	C-CF ₃	C-Cl	CH ₃	C-H	C-Br	H	H	EtCO	H	1
4-108	C-Cl	C-Cl	C-CF ₃	CH ₃	C-H	C-Br	H	H	EtCO	H	1
4-109	C-Cl	C-Br	C-Cl	CH ₃	C-H	C-Br	H	H	EtCO	H	1

(continuación)

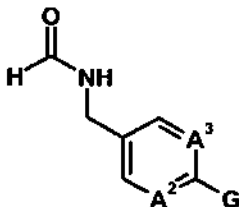
Nº	BI	B2	B3	R	A2	A3	R1	R2	R4	R3	I
4 - 110	C-Br	C-Cl	C-Br	CH ₃	C-H	C-Br	H	H	EtCO	H	1
4 - 111	C-Cl	C-NH ₂	C-Cl	CH ₃	C-H	C-Br	H	H	EtCO	H	1
4 - 112	C-Br	C-NH ₂	C-Br	CH ₃	C-H	C-Br	H	H	EtCO	H	1
4 - 113	C-F	C-H	C-H	CH ₃	C-H	C-Br	H	H	MeCO	H	1
4 - 114	C-Cl	C-H	C-H	CF ₃	C-H	C-Br	H	H	MeCO	H	1
4 - 115	C-CF ₃	C-H	C-H	CF ₃	C-H	C-Br	H	H	MeCO	H	1
4 - 116	C-H	C-CF ₃	C-H	CF ₃	C-H	C-Br	H	H	MeCO	H	1
4 - 117	C-CF ₃	C-H	C-CF ₃	CF ₃	C-H	C-Br	H	H	MeCO	H	1
4 - 118	C-NO ₂	C-H	C-H	CF ₃	C-H	C-Br	H	H	MeCO	H	1
4 - 119	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	N	C-H	H	H	MeCO	H	1
4 - 120	C-CH ₃	C-H	C-H	CF ₃	C-H	C-H	H	H	MeCO	H	1
4 - 121	C-OCH ₃	C-H	C-H	CF ₃	C-H	C-H	H	H	MeCO	H	1
4 - 122	C-CN	C-H	C-H	CF ₃	C-H	C-Br	H	H	MeCO	H	1
4 - 123	C-OCF ₃	C-H	C-H	CF ₃	C-H	C-H	H	H	MeCO	H	1
4 - 124	C-SCH ₃	C-H	C-H	CF ₃	C-H	C-H	H	H	MeCO	H	1
4 - 125	C-S(O)CH ₃	C-H	C-H	CF ₃	C-H	C-H	H	H	MeCO	H	1
4 - 126	C-S(O)2CH ₃	C-H	C-H	CF ₃	C-H	C-H	H	H	MeCO	H	1
4 - 127	C-SCF ₃	C-H	C-H	CF ₃	C-H	C-H	H	H	MeCO	H	1
4 - 128	C-S(O)CF ₃	C-H	C-H	CF ₃	C-H	C-H	H	H	MeCO	H	1
4 - 129	C-S(O)2CF ₃	C-H	C-H	CF ₃	C-H	C-H	H	H	MeCO	H	1
4 - 130	C-OH	C-H	C-H	CF ₃	C-H	C-H	H	H	MeCO	H	1
4 - 131	C-SH	C-H	C-H	CF ₃	C-H	C-H	H	H	MeCO	H	1
4 - 132	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃	C-H	C-Br	H	H	MeCO	H	2
4 - 133	C-Cl	C-Cl	C-H	CF ₃	C-H	C-Br	H	H	MeCO	H	1
4 - 134	C-Cl	C-Cl	C-Cl	CF ₃	C-H	C-Br	H	H	MeCO	H	1
4 - 135	C-Cl	C-Me	C-Cl	CF ₃	C-H	C-Br	H	H	MeCO	H	1
4 - 136	C-F	C-F	C-F	CF ₃	C-H	C-Br	H	H	MeCO	H	1
4 - 137	C-Br	C-Br	C-Br	CF ₃	C-H	C-Br	H	H	MeCO	H	1
4 - 138	C-Cl	C-CF ₃	C-Cl	CF ₃	C-H	C-Br	H	H	MeCO	H	1
4 - 139	C-Cl	C-Cl	C-CF ₃	CF ₃	C-H	C-Br	H	H	MeCO	H	1
4 - 140	C-Cl	C-Br	C-Cl	CF ₃	C-H	C-Br	H	H	MeCO	H	1
4 - 141	C-Br	C-Cl	C-Br	CF ₃	C-H	C-Br	H	H	MeCO	H	1
4 - 142	C-Cl	C-NH ₂	C-Cl	CF ₃	C-H	C-Br	H	H	MeCO	H	1
4 - 143	C-Br	C-NH ₂	C-Br	CF ₃	C-H	C-Br	H	H	MeCO	H	1
4 - 144	C-F	C-F	C-F	CF ₃	C-H	C-Br	H	H	EtCO	H	1
4 - 145	C-Br	C-Br	C-Br	CF ₃	C-H	C-Br	H	H	EtCO	H	1
4 - 146	C-Cl	C-CF ₃	C-Cl	CF ₃	C-H	C-Br	H	H	EtCO	H	1
4 - 147	C-Cl	C-Cl	C-CF ₃	CF ₃	C-H	C-Br	H	H	EtCO	H	1
4 - 148	C-Cl	C-Br	C-Cl	CF ₃	C-H	C-Br	H	H	EtCO	H	1
4 - 149	C-Br	C-Cl	C-Br	CF ₃	C-H	C-Br	H	H	EtCO	H	1

(continuación)

Nº	BI	B2	B3	R	A2	A3	R1	R2	R4	R3	I
4 - 150	C-Cl	C-NH ₂	C-Cl	CF ₃	C-H	C-Br	H	H	EtCO	H	1
4 - 151	C-Br	C-NH ₂	C-Br	CF ₃	C-H	C-Br	H	H	EtCO	H	1
4 - 152	C-F	C-H	C-H	CF ₃	C-H	C-Br	H	H	MeCO	H	1

Los compuestos de fórmula XXXIV están ejemplificados en las tablas 5, 6, 7 y 8:

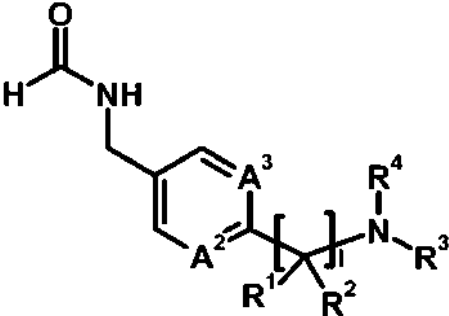
Tabla 5

				
Nº	A²	A³	G	(Z) _k
5 - 1	C-H	C-H	G1	H
5 - 2	C-H	C-H	G2	H
5 - 3	C-H	C-H	G3	H
5 - 4	C-H	C-H	G4	H
5 - 5	C-H	C-H	G5	H
5 - 6	C-H	C-H	G6	H
5 - 7	C-H	C-H	G7	H
5 - 8	C-H	C-H	G8	H
5 - 9	C-H	C-H	G9	H
5 - 10	C-H	C-F	G6	H
5 - 11	C-H	C-F	G8	H
5 - 12	C-H	C-F	G9	H
5 - 13	C-H	C-Cl	G6	H
5 - 14	C-H	C-Cl	G8	H
5 - 15	C-H	C-Cl	G9	H
5 - 16	C-H	C-Br	G1	H
5 - 17	C-H	C-Br	G2	H
5 - 18	C-H	C-Br	G3	H
5 - 19	C-H	C-Br	G4	H
5 - 20	C-H	C-Br	G5	H
5 - 21	C-H	C-Br	G6	H
5 - 22	C-H	C-Br	G7	H
5 - 23	C-H	C-Br	G8	H
5 - 24	C-H	C-Br	G9	H
5 - 25	C-H	C-I	G6	H
5 - 26	C-H	C-I	G8	H
5 - 27	C-H	C-I	G9	H
5 - 28	C-H	C-Me	G6	H
5 - 29	C-H	C-Me	G8	H
5 - 30	C-H	C-CF ₃	G6	H
5 - 31	C-H	C-CF ₃	G8	H

(continuación)

Nº	A ²	A ³	G	(Z) _k
5 - 32	C-H	C-SCF ₃	G6	H
5 - 33	C-H	C-S(O)CF ₃	G6	H
5 - 34	C-H	C-S(O) ₂ CF ₃	G6	H
5 - 35	C-H	C-CN	G1	H
5 - 36	C-H	C-CN	G2	H
5 - 37	C-H	C-CN	G2	3-NO ₂
5 - 38	C-H	C-CN	G2	3-CN
5 - 39	C-H	C-CN	G2	3-Cl
5 - 40	C-H	C-CN	G2	3-Br
5 - 41	C-H	C-CN	G2	3-CH ₃
5 - 42	C-H	C-CN	G2	3-CF ₃
5 - 43	C-H	C-CN	G3	H
5 - 44	C-H	C-CN	G4	H
5 - 45	C-H	C-CN	G5	H
5 - 46	C-H	C-CN	G6	H
5 - 47	C-H	C-CN	G6	3-NO ₂
5 - 48	C-H	C-CN	G6	3-CN
5 - 49	C-H	C-CN	G7	H
5 - 50	C-H	C-CN	G8	H
5 - 51	C-H	C-CN	G9	H
5 - 52	C-H	C-SMe	G6	H
5 - 53	C-H	C-S(O)Me	G6	H
5 - 54	C-H	C-S(O) ₂ Me	G6	H
5 - 55	C-H	C-NH ₂	G6	H
5 - 56	C-H	C-NHCO ₂ CH ₂ CCl ₃	G6	H
5 - 57	C-H	C-NHCO ₂ CH ₃	G6	H
5 - 58	C-H	C-NHCOCH ₃	G6	H
5 - 59	C-H	C-NO ₂	G6	H
5 - 60	C-H	C-NO ₂	G8	H
5 - 61	C-H	C-OCF ₃	G6	H
5 - 62	C-H	C-OH	G6	H
5 - 63	C-H	C-SH	G6	H
5 - 64	N	C-Br	G6	H
5 - 65	N	C-CN	G6	H

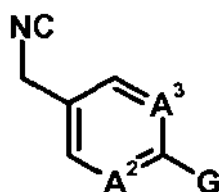
Tabla 6

							
Nº	A¹	A²	R¹	R²	R³	R⁴	I
6 - 1	C-H	C-H	H	H	HCO	2-py-CH₂	1
6 - 2	C-H	C-H	H	H	MeCO	H	1
6 - 3	C-H	C-H	H	H	MeCO	MeCO	1
6 - 4	C-H	C-H	H	H	MeCO	2-py-CO	1
6 - 5	C-H	C-H	H	H	MeCO	2-py-CH₂	1
6 - 6	C-H	C-H	H	H	MeCO	NH₂	1
6 - 7	C-H	C-H	H	H	MeCO	NHCOMe	1
6 - 8	C-H	C-H	H	H	MeCO	OH	1
6 - 9	C-H	C-H	H	H	MeCO	MeO	1
6 - 10	C-H	C-H	H	H	EtCO	2-py-CH₂	1
6 - 11	C-H	C-H	H	H	2-py-CO	2-py-CH₂	1
6 - 12	C-H	C-H	H	H	Me₂NCO	2-py-CH₂	1
6 - 13	C-H	C-H	H	H	MeSO₂	2-py-CH₂	1
6 - 14	C-H	C-H	CF₃	H	MeCO	H	1
6 - 15	C-H	C-H	CH₂CH₂	H	MeCO	H	1
6 - 16	C-H	C-H	CH₂=CH	H	MeCO	H	1
6 - 17	C-H	C-H	HC≡C	H	MeCO	H	1
6 - 18	C-H	C-H	CN	H	MeCO	H	1
6 - 19	C-H	C-H	CN	H	MeCO	2-py-CH₂	1
6 - 20	C-H	C-H	CO₂Me	H	MeCO	H	1
6 - 21	C-H	C-H	cyc-Pr	H	MeCO	H	1
6 - 22	C-H	C-F	H	H	MeCO	H	1
6 - 23	C-H	C-Cl	H	H	MeCO	H	1
6 - 24	C-H	C-Br	H	H	HCO	H	1
6 - 25	C-H	C-Br	H	H	MeCO	H	1
6 - 26	C-H	C-Br	H	H	MeCO	H	2
6 - 27	C-H	C-Br	H	H	MeCO	Me	1
6 - 28	C-H	C-Br	H	H	MeCO	Et	1
6 - 29	C-H	C-Br	H	H	MeCO	CH₂=CH	1
6 - 30	C-H	C-Br	H	H	MeCO	HC≡C-CH₂	1
6 - 31	C-H	C-Br	H	H	MeCO	PhCH₂	1
6 - 32	C-H	C-Br	H	H	MeCO	CN	1
6 - 33	C-H	C-Br	H	H	MeCO	CH₂CF₃	1
6 - 34	C-H	C-Br	H	H	MeCO	cyc-Pr	1
6 - 35	C-H	C-Br	H	H	MeCO	2-py-CH₂	1
6 - 36	C-H	C-Br	H	H	MeCO	3-py-CH₂	1
6 - 37	C-H	C-Br	H	H	MeCO	4-py-CH₂	1
6 - 38	C-H	C-Br	H	H	MeCO	MeCO	1
6 - 39	C-H	C-Br	H	H	EtCO	H	1
6 - 40	C-H	C-Br	H	H	EtCO	H	1
6 - 41	C-H	C-Br	H	H	n-PrCO	H	1
6 - 42	C-H	C-Br	H	H	iso-PrCO	H	1
6 - 43	C-H	C-Br	H	H	terc-BuCO	H	1
6 - 44	C-H	C-Br	H	H	CH₂=CHCO	H	1
6 - 45	C-H	C-Br	H	H	HC=CCO	H	1
6 - 46	C-H	C-Br	H	H	CF₃CO	H	1
6 - 47	C-H	C-Br	H	H	PhCO	H	1
6 - 48	C-H	C-Br	H	H	2-F-PhCO	H	1
6 - 49	C-H	C-Br	H	H	3-F-PhCO	H	1
6 - 50	C-H	C-Br	H	H	4-F-PhCO	H	1
6 - 51	C-H	C-Br	H	H	2-Cl-PhCO	H	1
6 - 52	C-H	C-Br	H	H	3-Cl-PhCO	H	1
6 - 53	C-H	C-Br	H	H	4-Cl-PhCO	H	1
6 - 54	C-H	C-Br	H	H	2-Br-PhCO	H	1
6 - 55	C-H	C-Br	H	H	2-Me-PhCO	H	1
6 - 56	C-H	C-Br	H	H	2-piridilCO	H	1
6 - 57	C-H	C-Br	H	H	3-py-CO	H	1
6 - 58	C-H	C-Br	H	H	4-py-CO	H	1
6 - 59	C-H	C-Br	H	H	MeSO₂	H	1

(continuación)

Nº	A ¹	A ²	R ¹	R ²	R ³	R ⁴	I
6 - 60	C-H	C-Br	H	H	CF ₃ SO ₂	H	1
6 - 61	C-H	C-Br	H	H	MeHNCO	H	1
6 - 62	C-H	C-Br	H	H	Me ₂ NCO	H	1
6 - 63	C-H	C-Br	H	H	MeOC(=O)	H	1
6 - 64	C-H	C-Br	H	H	MeSC(=O)	H	1
6 - 65	C-H	C-Br	H	H	MeCS	H	1
6 - 66	C-H	C-Br	H	H	MeON(Me)CO	H	1
6 - 67	C-H	C-Br	H	H	-C(O)CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		1
6 - 68	C-H	C-Br	H	H	-CO-NMe-N=N-		1
6 - 69	C-H	C-Br	H	H	-C(=N-NO ₂)-NH-CH ₂ -CH ₂ -		1
6 - 70	C-H	C-Br	H	H	MeCO	N=CMe ₂	1
6 - 71	C-H	C-Br	Me	H	MeCO	H	1
6 - 72	C-H	C-Br	Me	Me	MeCO	H	1
6 - 73	C-H	C-I	H	H	MeCO	H	1
6 - 74	C-H	C-NO ₂	H	H	MeCO	H	1
6 - 75	C-H	C-CN	H	H	MeCO	2-py-CH ₂	1
6 - 76	C-H	C-CN	H	H	MeCO	H	1
6 - 77	C-H	C-Me	H	H	MeCO	H	1
6 - 78	C-H	C-Me	H	H	MeCO	2-py-CH ₂	1
6 - 79	C-H	C-SMe	H	H	MeCO	H	1
6 - 80	C-H	C-S(O)Me	H	H	MeCO	H	1
6 - 81	C-H	C-S(O) ₂ Me	H	H	MeCO	H	1
6 - 82	C-H	C-CF ₃ S	H	H	MeCO	H	1
6 - 83	C-H	C-S(O)CF ₃	H	H	MeCO	H	1
6 - 84	C-H	C-S(O) ₂ CF ₃	H	H	MeCO	H	1
6 - 85	C-H	C-OCH ₃	H	H	MeCO	H	1
6 - 86	C-H	C-OCF ₃	H	H	MeCO	H	1
6 - 87	C-H	C-OH	H	H	MeCO	H	1
6 - 88	C-H	C-SH	H	H	MeCO	H	1
6 - 89	C-H	C-NH ₂	H	H	MeCO	H	1
6 - 90	C-H	C-NHCOCH ₃	H	H	MeCO	H	1
6 - 91	C-H	C-NHCO ₂ CH ₃	H	H	MeCO	H	1
6 - 92	C-H	C-NHCO ₂ CH ₂ CCl ₃	H	H	MeCO	H	1
6 - 93	N	C-H	H	H	MeCO	H	1

Tabla 7



5

Nº	A ²	A ³	G	(Z) _K
7 - 1	C-H	C-H	G1	H
7 - 2	C-H	C-H	G2	H
7 - 3	C-H	C-H	G3	H
7 - 4	C-H	C-H	G4	H
7 - 5	C-H	C-H	G5	H
7 - 6	C-H	C-H	G6	H
7 - 7	C-H	C-H	G7	H

Nº	A ²	A ³	G	(Z) _K
7 - 8	C-H	C-H	G8	H
7 - 9	C-H	C-H	G9	H
7 - 10	C-H	C-F	G6	H
7 - 11	C-H	C-F	G8	H
7 - 12	C-H	C-F	G9	H
7 - 13	C-H	C-Cl	G6	H
7 - 14	C-H	C-Cl	G8	H

(continuación)

Nº	A ²	A ³	G	(Z) _K		Nº	A ²	A ³	G	(Z) _K
7 - 15	C-H	C-Cl	G9	H		7 - 41	C-H	C-CN	G2	3-CH ₃
7 - 16	C-H	C-Br	G1	H		7 - 42	C-H	C-CN	G2	3-CF ₃
7 - 17	C-H	C-Br	G2	H		7 - 43	C-H	C-CN	G3	H
7 - 18	C-H	C-Br	G3	H		7 - 44	C-H	C-CN	G4	H
7 - 19	C-H	C-Br	G4	H		7 - 45	C-H	C-CN	G5	H
7 - 20	C-H	C-Br	G5	H		7 - 46	C-H	C-CN	G6	H
7 - 21	C-H	C-Br	G6	H		7 - 47	C-H	C-CN	G6	3-NO ₂
7 - 22	C-H	C-Br	G7	H		7 - 48	C-H	C-CN	G6	3-CN
7 - 23	C-H	C-Br	G8	H		7 - 49	C-H	C-CN	G7	H
7 - 24	C-H	C-Br	G9	H		7 - 50	C-H	C-CN	G8	H
7 - 25	C-H	C-I	G6	H		7 - 51	C-H	C-CN	G9	H
7 - 26	C-H	C-I	G8	H		7 - 52	C-H	C-SMe	G6	H
7 - 27	C-H	C-I	G9	H		7 - 53	C-H	C-S(O)Me	G6	H
7 - 28	C-H	C-Me	G6	H		7 - 54	C-H	C-S(O) ₂ Me	G6	H
7 - 29	C-H	C-Me	G8	H		7 - 55	C-H	C-NH ₂	G6	H
7 - 30	C-H	C-CF ₃	G6	H		7 - 56	C-H	C-NHCO ₂ CH ₂ CCl ₃	G6	H
7 - 31	C-H	C-CF ₃	G8	H		7 - 57	C-H	C-NHCO ₂ CH ₃	G6	H
7 - 32	C-H	C-SCF ₃	G6	H		7 - 58	C-H	C-NHCOCH ₃	G6	H
7 - 33	C-H	C-S(O)CF ₃	G6	H		7 - 59	C-H	C-NO ₂	G6	H
7 - 34	C-H	C-S(O) ₂ CF ₃	G6	H		7 - 60	C-H	C-NO ₂	G8	H
7 - 35	C-H	C-CN	G1	H		7 - 61	C-H	C-OCF ₃	G6	H
7 - 36	C-H	C-CN	G2	H		7 - 62	C-H	C-OH	G6	H
7 - 37	C-H	C-CN	G2	3-NO ₂		7 - 63	C-H	C-SH	G6	H
7 - 38	C-H	C-CN	G2	3-CN		7 - 64	N	C-Br	G6	H
7 - 39	C-H	C-CN	G2	3-Cl		7 - 65	N	C-CN	G6	H
7 - 40	C-H	C-CN	G2	3-Br						

Tabla 8

Nº	A ²	A ³	R ¹	R ²	R ⁴	R ³	I
8 - 1	C-H	C-H	H	H	HCO	2-py-CH ₂	1
8 - 2	C-H	C-H	H	H	MeCO	H	1
8 - 3	C-H	C-H	H	H	MeCO	MeCO	1
8 - 4	C-H	C-H	H	H	MeCO	2-py-CO	1
8 - 5	C-H	C-H	H	H	MeCO	2-py-CH ₂	1
8 - 6	C-H	C-H	H	H	MeCO	NH ₂	1
8 - 7	C-H	C-H	H	H	MeCO	NHCOMe	1
8 - 8	C-H	C-H	H	H	MeCO	OH	1
8 - 9	C-H	C-H	H	H	MeCO	MeO	1
8 - 10	C-H	C-H	H	H	EtCO	2-py-CH ₂	1
8 - 11	C-H	C-H	H	H	2-py-CO	2-py-CH ₂	1
8 - 12	C-H	C-H	H	H	Me ₂ NCO	2-py-CH ₂	1
8 - 13	C-H	C-H	H	H	MeSO ₂	2-py-CH ₂	1
8 - 14	C-H	C-H	CF ₃	H	MeCO	H	1
8 - 15	C-H	C-H	CH ₂ CH ₂		MeCO	H	1
8 - 16	C-H	C-H	CH ₂ =CH	H	MeCO	H	1
8 - 17	C-H	C-H	HC≡C	H	MeCO	H	1
8 - 18	C-H	C-H	CN	H	MeCO	H	1
8 - 19	C-H	C-H	CN	H	MeCO	2-py-CH ₂	1
8 - 20	C-H	C-H	CO ₂ Me	H	MeCO	H	1
8 - 21	C-H	C-H	cyc-Pr	H	MeCO	H	1
8 - 22	C-H	C-F	H	H	MeCO	H	1
8 - 23	C-H	C-Cl	H	H	MeCO	H	1
8 - 24	C-H	C-Br	H	H	HCO	H	1
8 - 25	C-H	C-Br	H	H	MeCO	H	1
8 - 26	C-H	C-Br	H	H	MeCO	H	2
8 - 27	C-H	C-Br	H	H	MeCO	Me	1
8 - 28	C-H	C-Br	H	H	MeCO	Et	1
8 - 29	C-H	C-Br	H	H	MeCO		1
8 - 30	C-H	C-Br	H	H	MeCO	HC≡C-CH ₂	1
8 - 31	C-H	C-Br	H	H	MeCO	PhCH ₂	1

(continuación)

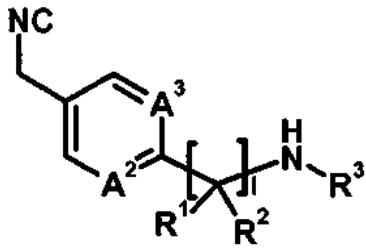
Nº	A ²	A ³	R ¹	R ²	R ⁴	R ³	I
8 - 32	C-H	C-Br	H	H	MeCO	CN	1
8 - 33	C-H	C-Br	H	H	MeCO	CH ₂ CF ₃	1
8 - 34	C-H	C-Br	H	H	MeCO	cyc-Pr	1
8 - 35	C-H	C-Br	H	H	MeCO	2-py-CH ₂	1
8 - 36	C-H	C-Br	H	H	MeCO	3-py-CH ₂	1
8 - 37	C-H	C-Br	H	H	MeCO	4-py-CH ₂	1
8 - 38	C-H	C-Br	H	H	MeCO	MeCO	1
8 - 39	C-H	C-Br	H	H	EtCO	H	1
8 - 40	C-H	C-Br	H	H	EtCO	H	1
8 - 41	C-H	C-Br	H	H	n-PrCO	H	1
8 - 42	C-H	C-Br	H	H	iso-PrCO	H	1
8 - 43	C-H	C-Br	H	H	terc-BuCO	H	1
8 - 44	C-H	C-Br	H	H	CH ₂ =CHCO	H	1
8 - 45	C-H	C-Br	H	H	HC≡CCO	H	1
8 - 46	C-H	C-Br	H	H	CF ₃ CO	H	1
8 - 47	C-H	C-Br	H	H	PhCO	H	1
8 - 48	C-H	C-Br	H	H	2-F-PhCO	H	1
8 - 49	C-H	C-Br	H	H	3-F-PhCO	H	1
8 - 50	C-H	C-Br	H	H	4-F-PhCO	H	1
8 - 51	C-H	C-Br	H	H	2-Cl-PhCO	H	1
8 - 52	C-H	C-Br	H	H	3-Cl-PhCO	H	1
8 - 53	C-H	C-Br	H	H	4-Cl-PhCO	H	1
8 - 54	C-H	C-Br	H	H	2-Br-PhCO	H	1
8 - 55	C-H	C-Br	H	H	2-Me-PhCO	H	1
8 - 56	C-H	C-Br	H	H	2-piridilCO	H	1
8 - 57	C-H	C-Br	H	H	3-py-CO	H	1
8 - 58	C-H	C-Br	H	H	4-py-CO	H	1
8 - 59	C-H	C-Br	H	H	MeSO ₂	H	1
8 - 60	C-H	C-Br	H	H	CF ₃ SO ₂	H	1
8 - 61	C-H	C-Br	H	H	MeHNCO	H	1
8 - 62	C-H	C-Br	H	H	Me ₂ NCO	H	1
8 - 63	C-H	C-Br	H	H	MeOC(=O)	H	1
8 - 64	C-H	C-Br	H	H	MeSC(=O)	H	1
8 - 65	C-H	C-Br	H	H	MeCS	H	1
8 - 66	C-H	C-Br	H	H	MeON(Me)CO	H	1
8 - 67	C-H	C-Br	H	H	-C(O)CH ₂ CH ₂ CH ₂ -		1
8 - 68	C-H	C-Br	H	H	-CO-NMe-N=N-		1

(continuación)

Nº	A ²	A ³	R ¹	R ²	R ⁴	R ³	I
8 - 69	C-H	C-Br	H	H	-C(=N-NO ₂)-NH-CH ₂ -CH ₂ -		1
8 - 70	C-H	C-Br	H	H	MeCO	N=CMe ₂	1
8 - 71	C-H	C-Br	Me	H	MeCO	H	1
8 - 72	C-H	C-Br	Me	Me	MeCO	H	1
8 - 73	C-H	C-I	H	H	MeCO	H	1
8 - 74	C-H	C-NO ₂	H	H	MeCO	H	1
8 - 75	C-H	C-CN	H	H	MeCO	2-py-CH ₂	1
8 - 76	C-H	C-CN	H	H	MeCO	H	1
8 - 77	C-H	C-Me	H	H	MeCO	H	1
8 - 78	C-H	C-Me	H	H	MeCO	2-py-CH ₂	1
8 - 79	C-H	C-SMe	H	H	MeCO	H	1
8 - 80	C-H	C-S(O)Me	H	H	MeCO	H	1
8 - 81	C-H	C-S(O) ₂ Me	H	H	MeCO	H	1
8 - 82	C-H	C-CF ₃ S	H	H	MeCO	H	1
8 - 83	C-H	C-S(O)CF ₃	H	H	MeCO	H	1
8 - 84	C-H	C-S(O) ₂ CF ₃	H	H	MeCO	H	1
8 - 85	C-H	C-OCH ₃	H	H	MeCO	H	1
8 - 86	C-H	C-OCF ₃	H	H	MeCO	H	1
8 - 87	C-H	C-OH	H	H	MeCO	H	1
8 - 88	C-H	C-SH	H	H	MeCO	H	1
8 - 89	C-H	C-NH ₂	H	H	MeCO	H	1
8 - 90	C-H	C-NHCOCH ₃	H	H	MeCO	H	1
8 - 91	C-H	C-NHCO ₂ CH ₃	H	H	MeCO	H	1
8 - 92	C-H	C-NHCO ₂ CH ₂ CCl ₃	H	H	MeCO	H	1
8 - 93	N	C-H	H	H	MeCO	H	1

Los compuestos de fórmula XXXV están ejemplificados en las tablas 9 y 10:

Tabla 9 (los ejemplos de la Tabla 9 no son de acuerdo con la invención)

						
Nº	A ²	A ³	R ¹	R ²	R ³	I
9 - 1	C-H	C-H	H	H	H	1
9 - 2	C-H	C-H	H	H	2-py-CH ₂	1

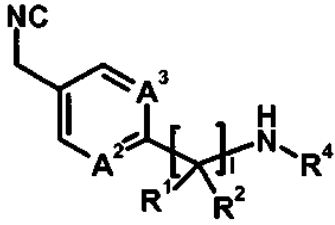
(continuación)

Nº	A ²	A ³	R ¹	R ²	R ³	I
9 - 3	C-H	C-H	H	H	NH ₂	1
9 - 4	C-H	C-H	H	H	NHCOMe	1
9 - 5	C-H	C-H	H	H	OH	1
9 - 6	C-H	C-H	H	H	MeO	1
9 - 7	C-H	C-H		H	H	1
9 - 8	C-H	C-H	CH ₂ CH ₂		H	1
9 - 9	C-H	C-H		H	H	1
9 - 10	C-H	C-H	HC≡C	H	H	1
9 - 11	C-H	C-H	CN	H	H	1
9 - 12	C-H	C-H	CN	H	2-py-CH ₂	1
9 - 13	C-H	C-H	CO ₂ Me	H	H	1
9 - 14	C-H	C-H	cyc-Pr	H	H	1
9 - 15	C-H	C-F	H	H	H	1
9 - 16	C-H	C-Cl	H	H	H	1
9 - 17	C-H	C-Br	H	H	H	1
9 - 18	C-H	C-Br	H	H	H	2
9 - 19	C-H	C-Br	H	H	Me	1
9 - 20	C-H	C-Br	H	H	Et	1
9 - 21	C-H	C-Br	H	H	CH ₂ =CH	1
9 - 22	C-H	C-Br	H	H	HC≡C-CH ₂	1
9 - 23	C-H	C-Br	H	H	PhCH ₂	1
9 - 24	C-H	C-Br	H	H	CN	1
9 - 25	C-H	C-Br	H	H	CH ₂ CF ₃	1
9 - 26	C-H	C-Br	H	H	cyc-Pr	1
9 - 27	C-H	C-Br	H	H	2-py-CH ₂	1
9 - 28	C-H	C-Br	H	H	3-py-CH ₂	1
9 - 29	C-H	C-Br	H	H	4-py-CH ₂	1
9 - 30	C-H	C-Br	H	H	MeCO	1
9 - 31	C-H	C-Br	H	H	N=CMe ₂	1
9 - 32	C-H	C-Br	Me	H	H	1
9 - 33	C-H	C-Br	Me	Me	H	1
9 - 34	C-H	C-I	H	H	H	1
9 - 35	C-H	C-NO ₂	H	H	H	1
9 - 36	C-H	C-CN	H	H	2-py-CH ₂	1
9 - 37	C-H	C-CN	H	H	H	1
9 - 38	C-H	C-Me	H	H	H	1

(continuación)

Nº	A ²	A ³	R ¹	R ²	R ³	I
9 - 39	C-H	C-Me	H	H	2-py-CH ₂	1
9 - 40	C-H	C-SMe	H	H	H	1
9 - 41	C-H	C-S(O)Me	H	H	H	1
9 - 42	C-H	C-S(O) ₂ Me	H	H	H	1
9 - 43	C-H	C-SCF ₃	H	H	H	1
9 - 44	C-H	C-S(O)CF ₃	H	H	H	1
9 - 45	C-H	C-S(O) ₂ CF ₃	H	H	H	1
9 - 46	C-H	C-OCH ₃	H	H	H	1
9 - 47	C-H	C-OCF ₃	H	H	H	1
9 - 48	C-H	C-OH	H	H	H	1
9 - 49	C-H	C-SH	H	H	H	1
9 - 50	C-H	C-NH ₂	H	H	H	1
9 - 51	C-H	C-NHCOCH ₃	H	H	H	1
9 - 52	C-H	C-NHCO ₂ CH ₃	H	H	H	1
9 - 53	C-H	C-NHCO ₂ CH ₂ CCl ₃	H	H	H	1
9 - 54	N	C-H	H	H	H	1

Tabla 10

						
Nº	A ²	A ³	R ¹	R ²	R ⁴	I
10 - 1	C-H	C-H	H	H	HCO	1
10 - 2	C-H	C-H	H	H	MeCO	1
10 - 3	C-H	C-H	H	H	EtCO	1
10 - 4	C-H	C-H	H	H	2-py-CO	1
10 - 5	C-H	C-H	H	H	Me ₂ NCO	1
10 - 6	C-H	C-H	H	H	MeSO ₂	1
10 - 7	C-H	C-H	CF ₃	H	MeCO	1
10 - 8	C-H	C-H	CH ₂ CH ₂		MeCO	1
10 - 9	C-H	C-H	CH ₂ =CH	H	MeCO	1
10 - 10	C-H	C-H	HC≡C	H	MeCO	1
10 - 11	C-H	C-H	CN	H	MeCO	1
10 - 12	C-H	C-H	CO ₂ Me	H	MeCO	1

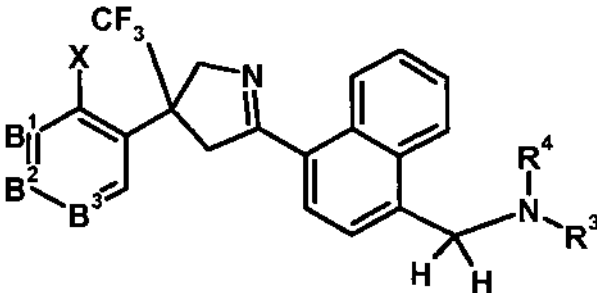
(continuación)

Nº	A ²	A ³	R ¹	R ²	R ⁴	I
10 - 13	C-H	C-H	cyc-Pr	H	MeCO	1
10 - 14	C-H	C-F	H	H	MeCO	1
10 - 15	C-H	C-Cl	H	H	MeCO	1
10 - 16	C-H	C-Br	H	H	HCO	1
10 - 17	C-H	C-Br	H	H	MeCO	1
10 - 18	C-H	C-Br	H	H	MeCO	2
10 - 19	C-H	C-Br	H	H	EtCO	1
10 - 20	C-H	C-Br	H	H	n-PrCO	1
10 - 21	C-H	C-Br	H	H	iso-PrCO	1
10 - 22	C-H	C-Br	H	H	terc-BuCO	1
10 - 23	C-H	C-Br	H	H	CH ₂ =CHCO	1
10 - 24	C-H	C-Br	H	H	HC=CCO	1
10 - 25	C-H	C-Br	H	H	CF ₃ CO	1
10 - 26	C-H	C-Br	H	H	PhCO	1
10 - 27	C-H	C-Br	H	H	2-F-PhCO	1
10 - 28	C-H	C-Br	H	H	3-F-PhCO	1
10 - 29	C-H	C-Br	H	H	4-F-PhCO	1
10 - 30	C-H	C-Br	H	H	2-Cl-PhCO	1
10 - 31	C-H	C-Br	H	H	3-Cl-PhCO	1
10 - 32	C-H	C-Br	H	H	4-Cl-PhCO	1
10 - 33	C-H	C-Br	H	H	2-Br-PhCO	1
10 - 34	C-H	C-Br	H	H	2-Me-PhCO	1
10 - 35	C-H	C-Br	H	H	2-py-CO	1
10 - 36	C-H	C-Br	H	H	3-py-CO	1
10 - 37	C-H	C-Br	H	H	4-py-CO	1
10 - 38	C-H	C-Br	H	H	MeSO ₂	1
10 - 39	C-H	C-Br	H	H	CF ₃ SO ₂	1
10 - 40	C-H	C-Br	H	H	MeHNCO	1
10 - 41	C-H	C-Br	H	H	Me ₂ NCO	1
10 - 42	C-H	C-Br	H	H	MeOC(=O)	1
10 - 43	C-H	C-Br	H	H	MeSC(=O)	1
10 - 44	C-H	C-Br	H	H	MeCS	1
10 - 45	C-H	C-Br	H	H	MeON(Me)CO	1
10 - 46	C-H	C-Br	H	H	MeCO	1
10 - 47	C-H	C-Br	Me	H	MeCO	1
10 - 48	C-H	C-Br	Me	Me	MeCO	1
10 - 49	C-H	C-I	H	H	MeCO	1

(continuación)

Nº	A ²	A ³	R ¹	R ²	R ⁴	I
10 - 50	C-H	C-NO ₂	H	H	MeCO	1
10 - 51	C-H	C-CN	H	H	MeCO	1
10 - 52	C-H	C-CN	H	H	MeCO	1
10 - 53	C-H	C-Me	H	H	MeCO	1
10 - 54	C-H	C-Me	H	H	MeCO	1
10 - 55	C-H	C-SMe	H	H	MeCO	1
10 - 56	C-H	C-S(O)Me	H	H	MeCO	1
10 - 57	C-H	C-S(O) ₂ Me	H	H	MeCO	1
10 - 58	C-H	C-SCF ₃	H	H	MeCO	1
10 - 59	C-H	C-S(O)CF ₃	H	H	MeCO	1
10 - 60	C-H	C-S(O) ₂ CF ₃	H	H	MeCO	1
10 - 61	C-H	C-OCH ₃	H	H	MeCO	1
10 - 62	C-H	C-OCF ₃	H	H	MeCO	1
10 - 63	C-H	C-OH	H	H	MeCO	1
10 - 64	C-H	C-SH	H	H	MeCO	1
10 - 65	C-H	C-NH ₂	H	H	MeCO	1
10 - 66	C-H	C-NHCOCH ₃	H	H	MeCO	1
10 - 67	C-H	C-NHCO ₂ CH ₃	H	H	MeCO	1
10 - 68	C-H	C-NHCO ₂ CH ₂ CCl ₃	H	H	MeCO	1
10 - 69	N	C-H	H	H	MeCO	1

Tabla 11 (los compuestos de la Tabla 11 no son de acuerdo con la invención)

					
Nº	BI	B2	B3	R4	R3
11 - 1	C-Cl	C-H	C-Cl	MeCO	H
11 - 2	C-Cl	C-H	C-Cl	EtCO	H
11 - 3	C-Cl	C-H	C-Cl	cyc-PrCO	H
11 - 4	C-Cl	C-H	C-Cl	CF ₃ C H ₂ CO	H
11 - 5	C-Cl	C-Cl	C-Cl	MeCO	H
11 - 6	C-Cl	C-Cl	C-Cl	EtCO	H
11 - 7	C-Cl	C-Cl	C-Cl	cyc-PrCO	H

(continuación)

Nº	BI	B2	B3	R4	R3
11 - 8	C-Cl	C-Cl	C-Cl	CF ₃ C H ₂ CO	H
11 - 9	C-CF ₃	C-H	C-CF ₃	MeCO	H
11 - 10	C-CF ₃	C-H	C-CF ₃	EtCO	H
11 - 11	C-CF ₃	C-H	C-CF ₃	cyc-PrCO	H
11 - 12	C-CF ₃	C-H	C-CF ₃	CF ₃ C H ₂ CO	H
11 - 13	C-Br	C-H	C-Br	MeCO	H
11 - 14	C-Cl	C-Cl	C-CF ₃	MeCO	H
11 - 15	C-Cl	C-Cl	C-CF ₃	EtCO	H
11 - 16	C-Cl	C-Cl	C-CF ₃	cyc-PrCO	H
11 - 17	C-Cl	C-Cl	C-CF ₃	CF ₃ C H ₂ CO	H
11 - 18	C-Cl	C-H	C-Cl	H	H
11 - 19	C-Cl	C-Cl	C-Cl	H	H
11 - 20	C-CF ₃	C-H	C-CF ₃	H	H
11 - 21	C-Br	C-H	C-Br	H	H
11 - 22	C-Cl	C-Cl	C-CF ₃	H	H

Los compuestos de fórmula (XXXIX) están ejemplificados en las tablas 12, 13, 14, 15 y 18:

Tabla 12

Nº	R1'	R2'	R3'	R4'	A2	A3	G	Z
12 - 1	Me	Me	Me	Me	C-H	C-H	G1	H
12 - 2	Me	Me	Me	Me	C-H	C-H	G2	H
12 - 3	Me	Me	Me	Me	C-H	C-H	G3	H
12 - 4	Me	Me	Me	Me	C-H	C-H	G4	H
12 - 5	Me	Me	Me	Me	C-H	C-H	G5	H
12 - 6	Me	Me	Me	Me	C-H	C-H	G6	H
12 - 7	Me	Me	Me	Me	C-H	C-H	G7	H
12 - 8	Me	Me	Me	Me	C-H	C-H	G8	H
12 - 9	Me	Me	Me	Me	C-H	C-H	G9	H
12 - 10	Me	Me	Me	Me	C-H	C-F	G6	H
12 - 11	Me	Me	Me	Me	C-H	C-F	G8	H
12 - 12	Me	Me	Me	Me	C-H	C-F	G9	H
12 - 13	Me	Me	Me	Me	C-H	C-Cl	G6	H

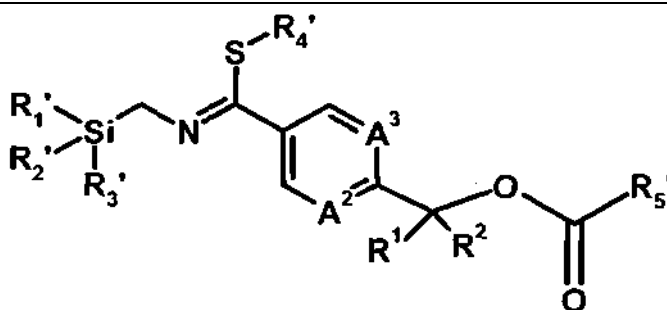
(continuación)

Nº	R1'	R2'	R3'	R4'	A2	A3	G	Z
12 - 14	Me	Me	Me	Me	C-H	C-Cl	G8	H
12 - 15	Me	Me	Me	Me	C-H	C-Cl	G9	H
12 - 16	Me	Me	Me	Me	C-H	C-Br	G1	H
12 - 17	Me	Me	Me	Me	C-H	C-Br	G2	H
12 - 18	Me	Me	Me	Me	C-H	C-Br	G3	H
12 - 19	Me	Me	Me	Me	C-H	C-Br	G4	H
12 - 20	Me	Me	Me	Me	C-H	C-Br	G5	H
12 - 21	Me	Me	Me	Me	C-H	C-Br	G6	H
12 - 22	Me	Me	Me	Me	C-H	C-Br	G7	H
12 - 23	Me	Me	Me	Me	C-H	C-Br	G8	H
12 - 24	Me	Me	Me	Me	C-H	C-Br	G9	H
12 - 25	Me	Me	Me	Me	C-H	C-I	G6	H
12 - 26	Me	Me	Me	Me	C-H	C-I	G8	H
12 - 27	Me	Me	Me	Me	C-H	C-I	G9	H
12 - 28	Me	Me	Me	Me	C-H	C-Me	G6	H
12 - 29	Me	Me	Me	Me	C-H	C-Me	G8	H
12 - 30	Me	Me	Me	Me	C-H	C-CF ₃	G6	H
12 - 31	Me	Me	Me	Me	C-H	C-CF ₃	G8	H
12 - 32	Me	Me	Me	Me	C-H	C-NO ₂	G6	H
12 - 33	Me	Me	Me	Me	C-H	C-NO ₂	G8	H
12 - 34	Me	Me	Me	Me	C-H	C-CN	G1	H
12 - 35	Me	Me	Me	Me	C-H	C-CN	G2	H
12 - 36	Me	Me	Me	Me	C-H	C-CN	G3	H
12 - 37	Me	Me	Me	Me	C-H	C-CN	G4	H
12 - 38	Me	Me	Me	Me	C-H	C-CN	G5	H
12 - 39	Me	Me	Me	Me	C-H	C-CN	G6	H
12 - 40	Me	Me	Me	Me	C-H	C-CN	G7	H
12 - 41	Me	Me	Me	Me	C-H	C-CN	G8	H
12 - 42	Me	Me	Me	Me	C-H	C-CN	G9	H
12 - 43	Me	Me	Me	Et	C-H	C-CN	G6	H
12 - 44	Me	Me	Me	PhCH ₂	C-H	C-CN	G6	H
12 - 45	Et	Et	Et	Me	C-H	C-CN	G6	H
12 - 46	Me	Me	terc-Bu	Me	C-H	C-CN	G6	H
12 - 47	Me	Me	Me	Et	C-H	C-Br	G6	H
12 - 48	Me	Me	Me	PhCH ₂	C-H	C-Br	G6	H
12 - 49	Et	Et	Et	Me	C-H	C-Br	G6	H
12 - 50	Me	Me	terc-Bu	Me	C-H	C-Br	G6	H

(continuación)

Nº	R1'	R2'	R3'	R4'	A2	A3	G	Z
12 - 51	Me	Me	Me	Et	C-H	C-H	G6	H
12 - 52	Me	Me	Me	PhCH ₂	C-H	C-H	G6	H
12 - 53	Et	Et	Et	Me	C-H	C-H	G6	H
12 - 54	Me	Me	terc-Bu	Me	C-H	C-H	G6	H
12 - 55	Me	Me	Me	H	C-H	C-CN	G6	H
12 - 56	Me	Me	Me	H	C-H	C-Br	G6	H
12 - 57	Me	Me	Me	H	C-H	C-NO ₂	G6	H

Tabla 13



Nº	R1'	R2'	R3'	R4'	A2	A3	R1	R2	R5'
13 - 1	Me	Me	Me	Me	CH	C-H	H	H	H
13 - 2	Me	Me	Me	Me	CH	C-H	H	H	Me
13 - 3	Me	Me	Me	Me	CH	C-H	H	H	Et
13 - 4	Me	Me	Me	Me	CH	C-H	H	H	n-Pr
13 - 5	Me	Me	Me	Me	CH	C-H	H	H	i-Pr
13 - 6	Me	Me	Me	Me	CH	C-H	H	H	n-Bu
13 - 7	Me	Me	Me	Me	CH	C-H	H	H	Ph
13 - 8	Me	Me	Me	Me	CH	C-Br	H	H	H
13 - 9	Me	Me	Me	Me	CH	C-Br	H	H	Me
13 - 10	Me	Me	Me	Me	CH	C-Br	H	H	Et
13 - 11	Me	Me	Me	Me	CH	C-Br	H	H	n-Pr
13 - 12	Me	Me	Me	Me	CH	C-Br	H	H	i-Pr
13 - 13	Me	Me	Me	Me	CH	C-Br	H	H	n-Bu
13 - 14	Me	Me	Me	Me	CH	C-Br	H	H	Ph
13 - 15	Me	Me	Me	Me	CH	C-Cl	H	H	Me
13 - 16	Me	Me	Me	Me	CH	C-Cl	H	H	Et
13 - 17	Me	Me	Me	Me	CH	C-Cl	H	H	n-Pr
13 - 18	Me	Me	Me	Me	CH	C-Cl	H	H	i-Pr
13 - 19	Me	Me	Me	Me	CH	C-Cl	H	H	n-Bu

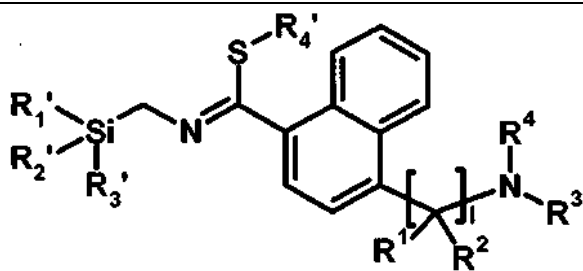
(continuación)

Nº	R1'	R2'	R3'	R4'	A2	A3	R1	R2	R5'
13 - 20	Me	Me	Me	Me	CH	C-Cl	H	H	Ph
13 - 21	Me	Me	Me	Me	CH	C-F	H	H	Me
13 - 22	Me	Me	Me	Me	CH	C-F	H	H	Et
13 - 23	Me	Me	Me	Me	CH	C-F	H	H	n-Pr
13 - 24	Me	Me	Me	Me	CH	C-F	H	H	i-Pr
13 - 25	Me	Me	Me	Me	CH	C-F	H	H	n-Bu
13 - 26	Me	Me	Me	Me	CH	C-F	H	H	Ph
13 - 27	Me	Me	Me	Me	CH	C-CF3	H	H	Me
13 - 28	Me	Me	Me	Me	CH	C-CF3	H	H	Et
13 - 29	Me	Me	Me	Me	CH	C-CF3	H	H	n-Pr
13 - 30	Me	Me	Me	Me	CH	C-CF3	H	H	i-Pr
13 - 31	Me	Me	Me	Me	CH	C-CF3	H	H	n-Bu
13 - 32	Me	Me	Me	Me	CH	C-CF3	H	H	Ph
13 - 33	Me	Me	Me	Me	CH	C-Me	H	H	Me
13 - 34	Me	Me	Me	Me	CH	C-Me	H	H	Et
13 - 35	Me	Me	Me	Me	CH	C-Me	H	H	n-Pr
13 - 36	Me	Me	Me	Me	CH	C-Me	H	H	i-Pr
13 - 37	Me	Me	Me	Me	CH	C-Me	H	H	n-Bu
13 - 38	Me	Me	Me	Me	CH	C-Me	H	H	Ph
13 - 39	Me	Me	Me	Me	CH	C-CN	H	H	Me
13 - 40	Me	Me	Me	Me	CH	C-CN	H	H	Et
13 - 41	Me	Me	Me	Me	CH	C-CN	H	H	n-Pr
13 - 42	Me	Me	Me	Me	CH	C-CN	H	H	i-Pr
13 - 43	Me	Me	Me	Me	CH	C-CN	H	H	n-Bu
13 - 44	Me	Me	Me	Me	CH	C-CN	H	H	Ph
13 - 45	Me	Me	Me	Me	CH	C-NO2	H	H	Me
13 - 46	Me	Me	Me	Me	CH	C-NO2	H	H	Et
13 - 47	Me	Me	Me	Me	CH	C-NO2	H	H	n-Pr
13 - 48	Me	Me	Me	Me	CH	C-NO2	H	H	i-Pr
13 - 49	Me	Me	Me	Me	CH	C-NO2	H	H	n-Bu
13 - 50	Me	Me	Me	Me	CH	C-NO2	H	H	Ph
13 - 51	Me	Me	Me	Me	CH	C-SMe	H	H	Me
13 - 52	Me	Me	Me	Me	CH	C-S(O)Me	H	H	Me
13 - 53	Me	Me	Me	Me	CH	C-S(O)2Me	H	H	Me
13 - 54	Me	Me	Me	Me	CH	C-SCF3	H	H	Me
13 - 55	Me	Me	Me	Me	CH	C-S(O)CF3	H	H	Me
13 - 56	Me	Me	Me	Me	CH	C-S(O)2CF3	H	H	Me

(continuación)

Nº	R1'	R2'	R3'	R4'	A2	A3	R1	R2	R5'
13 - 57	Me	Me	Me	Me	CH	C-OCH3	H	H	Me
13 - 58	Me	Me	Me	Me	CH	C-OCF3	H	H	Me
13 - 59	Me	Me	Me	Me	CH	C-OH	H	H	Me
13 - 60	Me	Me	Me	Me	CH	C-SH	H	H	Me
13 - 61	Me	Me	Me	Me	CH	C-NH2	H	H	Me
13 - 62	Me	Me	Me	Me	CH	C-NHCOCH3	H	H	Me
13 - 63	Me	Me	Me	Me	CH	C-NHCO2CH3	H	H	Me
13 - 64	Me	Me	Me	Me	CH	C-NHCO2CH2CCl3	H	H	Me
13 - 65	Me	Me	Me	Et	CH	C-Br	H	H	Me
13 - 66	Me	Me	Me	PhCH2	CH	C-Br	H	H	Me
13 - 67	Et	Et	Et	Me	CH	C-Br	H	H	Me
13 - 68	Me	Me	terc-Bu	Me	CH	C-Br	H	H	Me
13 - 69	Me	Me	Me	H	CH	C-H	H	H	Me
13 - 70	Me	Me	Me	H	CH	C-Cl	H	H	Me
13 - 71	Me	Me	Me	H	CH	C-Br	H	H	Me
13 - 72	Me	Me	Me	H	CH	C-F	H	H	Me
13 - 73	Me	Me	Me	H	CH	C-I	H	H	Me
13 - 74	Me	Me	Me	H	CH	C-Me	H	H	Me
13 - 75	Me	Me	Me	H	CH	C-CF3	H	H	Me
13 - 76	Me	Me	Me	H	CH	C-NO2	H	H	Me
13 - 77	Me	Me	Me	H	CH	C-SMe	H	H	Me

Tabla 14



Nº	R1'	R2'	R3'	R4'	R1	R2	R4	R3	I
14 - 1	Me	Me	Me	Me	H	H	HCO	H	1
14 - 2	Me	Me	Me	Me	H	H	MeCO	H	1
14 - 3	Me	Me	Me	Me	H	H	EtCO	H	1
14 - 4	Me	Me	Me	Me	H	H	cyc-PrCO	H	1
14 - 5	Me	Me	Me	Me	H	H	CF3CH2CO	H	1
14 - 6	Me	Me	Me	Me	H	H	MeCO	2-piridilCH2	1
14 - 7	Me	Me	Me	Me	H	H	n-PrCO	H	1
14 - 8	Me	Me	Me	Me	H	H	iso-PrCO	H	1
14 - 9	Me	Me	Me	Me	H	H	terc-BuCO	H	1
14 - 10	Me	Me	Me	Me	H	H	CF3CO	H	1
14 - 11	Me	Me	Me	Me	H	H	PhCO	H	1

(continuación)

Nº	R1'	R2'	R3'	R4'	R1	R2	R4	R3	I
14 - 12	Me	Me	Me	Me	H	H	2-piridilCO	H	1
14 - 13	Me	Me	Me	Me	H	H	3-piridilCO	H	1
14 - 14	Me	Me	Me	Me	H	H	4-piridilCO	H	1
14 - 15	Me	Me	Me	Me	H	H	2-F-PhCO	H	1
14 - 16	Me	Me	Me	Me	H	H	3-F-PhCO	H	1
14 - 17	Me	Me	Me	Me	H	H	4-F-PhCO	H	1
14 - 18	Me	Me	Me	Me	H	H	2-Cl-PhCO	H	1
14 - 19	Me	Me	Me	Me	H	H	3-Cl-PhCO	H	1
14 - 20	Me	Me	Me	Me	H	H	4-Cl-PhCO	H	1
14 - 21	Me	Me	Me	Me	H	H	2-Br-PhCO	H	1
14 - 22	Me	Me	Me	Me	H	H	2-Me-PhCO	H	1
14 - 23	Me	Me	Me	Me	H	H	vinilCO	H	1
14 - 24	Me	Me	Me	Me	H	H	HCCCO	H	1
14 - 25	Me	Me	Me	Me	H	H	MeSO ₂	H	1
14 - 26	Me	Me	Me	Me	H	H	CF ₃ SO ₂	H	1
14 - 27	Me	Me	Me	Me	H	H	MeHNCO	H	1
14 - 28	Me	Me	Me	Me	H	H	Me ₂ NCO	H	1
14 - 29	Me	Me	Me	Me	H	H	MeOC(=O)	H	1
14 - 30	Me	Me	Me	Me	H	H	MeSC(=O)	H	1
14 - 31	Me	Me	Me	Me	H	H	MeCS	H	1
14 - 32	Me	Me	Me	Me	H	H	MeON(Me)CO	H	1
14 - 33	Me	Me	Me	Et	H	H	MeCO	H	1
14 - 34	Me	Me	Me	PhCH ₂	H	H	MeCO	H	1
14 - 35	Et	Et	Et	Me	H	H	MeCO	H	1
14 - 36	Me	Me	terc-Bu	Me	H	H	MeCO	H	1
14 - 37	Me	Me	Me	H	H	H	terc-BuO(C=O)	H	1

Tabla 15

Nº	R1'	R2'	R3'	R4'	R1	R2	R5'
15 - 1	Me	Me	Me	Me	H	H	H
15 - 2	Me	Me	Me	Me	H	H	Me
15 - 3	Me	Me	Me	Me	H	H	Et
15 - 4	Me	Me	Me	Me	H	H	n-Pr
15 - 5	Me	Me	Me	Me	H	H	i-Pr
15 - 6	Me	Me	Me	Me	H	H	n-Bu
15 - 7	Me	Me	Me	Me	H	H	Ph
15 - 8	Me	Me	Me	Et	H	H	Me
15 - 9	Me	Me	Me	PhCH ₂	H	H	Me
15 - 10	Et	Et	Et	Me	H	H	Me
15 - 11	Me	Me	terc-Bu	Me	H	H	Me
15 - 12	Me	Me	Me	H	H	H	Me

Tabla 16 (los compuestos de la Tabla 16 no son de acuerdo con la invención)

Nº	X ₁	X ₂	X ₃	Y	R ¹	R ²	R ⁴	R ⁵
16 - 1	Cl	H	Cl	H	H	H	MeCO	H
16 - 2	Cl	H	Cl	H	H	H	MeCO	MeCO
16 - 3	Cl	H	Cl	H	H	H	MeCO	2-py-CO
16 - 4	Cl	H	Cl	CF ₃	H	H	MeCO	H
16 - 5	Cl	H	Cl	CF ₃	H	H	EtCO	H
16 - 6	Cl	H	Cl	CF ₃	H	H	CF ₃ CH ₂ CO	H
16 - 7	Cl	H	Cl	CF ₃	H	H	ciclo-PrCO	H
16 - 8	Cl	H	Cl	CF ₃	H	H	EtNHCO	H
16 - 9	Cl	H	Cl	CF ₃	H	H	CH ₃ SCH ₂ CO	H
16 - 10	Cl	H	Cl	CF ₃	H	H	CH ₃ SOCH ₂ CO	H
16 - 11	Cl	H	Cl	CF ₃	H	H	CH ₃ SO ₂ CH ₂ CO	H
16 - 12	Cl	Cl	Cl	CF ₃	H	H	MeCO	H
16 - 13	Cl	Cl	Cl	CF ₃	H	H	EtCO	H
16 - 14	Cl	Cl	Cl	CF ₃	H	H	CF ₃ CH ₂ CO	H
16 - 15	Cl	Cl	Cl	CF ₃	H	H	ciclo-PrCO	H
16 - 16	Cl	Cl	Cl	CF ₃	H	H	EtNHCO	H
16 - 17	Cl	Cl	Cl	CF ₃	H	H	CH ₃ SCH ₂ CO	H
16 - 18	Cl	Cl	Cl	CF ₃	H	H	CH ₃ SOCH ₂ CO	H
16 - 19	Cl	Cl	Cl	CF ₃	H	H	CH ₃ SO ₂ CH ₂ CO	H
16 - 20	CF ₃	H	CF ₃	CF ₃	H	H	MeCO	H
16 - 21	CF ₃	H	CF ₃	CF ₃	H	H	EtCO	H
16 - 22	CF ₃	H	CF ₃	CF ₃	H	H	CF ₃ CH ₂ CO	H
16 - 23	CF ₃	H	CF ₃	CF ₃	H	H	ciclo-PrCO	H
16 - 24	CF ₃	H	CF ₃	CF ₃	H	H	EtNHCO	H
16 - 25	CF ₃	H	CF ₃	CF ₃	H	H	CH ₃ SCH ₂ CO	H
16 - 26	CF ₃	H	CF ₃	CF ₃	H	H	CH ₃ SOCH ₂ CO	H
16 - 27	CF ₃	H	CF ₃	CF ₃	H	H	CH ₃ SO ₂ CH ₂ CO	H
16 - 28	Cl	H	Cl	CF ₃	H	H	ciclo-PrCH ₂ CO	H
16 - 29	Cl	H	Cl	CF ₃	H	H	MeCOCH ₂ CO	H
16 - 30	Cl	H	Cl	CF ₃	H	H	ciclo-PrNHCO	H
16 - 31	Cl	H	Cl	CF ₃	H	H	CHCCH ₂ NHCO	H
16 - 32	Cl	H	Cl	CF ₃	H	H	CH ₂ =CHCH ₂ NHCO	H
16 - 33	Cl	H	Cl	Cl	H	H	CF ₃ CH ₂ CO	H
16 - 34	Cl	H	Cl	Me	H	H	CF ₃ CH ₂ CO	H
16 - 35	Cl	H	Cl	Br	H	H	CF ₃ CH ₂ CO	H
16 - 36	Cl	H	Cl	CF ₃	Me	H	ciclo-PrCO	H
16 - 37	Cl	H	Cl	CF ₃	H	Me	EtNHCO	H
16 - 38	Cl	H	Cl	CF ₃	Me	Me	ciclo-PrCH ₂ CO	H
16 - 39	Cl	H	Cl	CF ₃	Me	Me	CH ₂ =CHCH ₂ NHCO	H
16 - 40	Cl	H	Cl	CF ₃	H	H	terc-BuOCO	H
16 - 41	Cl	Cl	Cl	CF ₃	H	H	terc-BuOCO	H
16 - 42	CF ₃	H	CF ₃	CF ₃	CN	H	terc-BuOCO	H

Tabla 17 (los compuestos de la Tabla 17 no son de acuerdo con la invención)

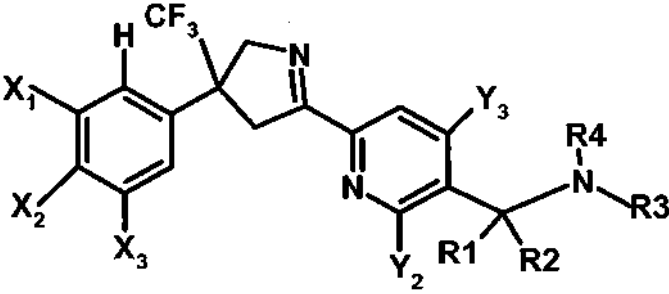
									
Nº	X ₁	X ₂	X ₃	Y ₂	Y ₃	R ¹	R ²	R ⁴	R ³
17 - 1	Cl	H	Cl	H	H	H	H	MeCO	H
17 - 2	Cl	H	Cl	H	H	H	H	MeCO	MeCO
17 - 3	Cl	H	Cl	H	H	H	H	MeCO	2-py-CO
17 - 4	Cl	H	Cl	H	CF ₃	H	H	MeCO	H
17 - 5	Cl	H	Cl	H	CF ₃	H	H	EtCO	H
17 - 6	Cl	H	Cl	H	CF ₃	H	H	CF ₃ CH ₂ CO	H
17 - 7	Cl	H	Cl	H	CF ₃	H	H	ciclo-PrCO	H
17 - 8	Cl	H	Cl	H	CF ₃	H	H	EtNHCO	H
17 - 9	Cl	H	Cl	H	CF ₃	H	H	CH ₃ SCH ₂ CO	H
17 - 10	Cl	H	Cl	H	CF ₃	H	H	CH ₃ SOCH ₂ CO	H
17 - 11	Cl	H	Cl	H	CF ₃	H	H	CH ₃ SO ₂ CH ₂ CO	H
17 - 12	Cl	Cl	Cl	H	CF ₃	H	H	MeCO	H
17 - 13	Cl	Cl	Cl	H	CF ₃	H	H	EtCO	H
17 - 14	Cl	Cl	Cl	H	CF ₃	H	H	CF ₃ CH ₂ CO	H
17 - 15	Cl	Cl	Cl	H	CF ₃	H	H	ciclo-PrCO	H
17 - 16	Cl	Cl	Cl	H	CF ₃	H	H	EtNHCO	H
17 - 17	Cl	Cl	Cl	H	CF ₃	H	H	CH ₃ SCH ₂ CO	H
17 - 18	Cl	Cl	Cl	H	CF ₃	H	H	CH ₃ SOCH ₂ CO	H
17 - 19	Cl	Cl	Cl	H	CF ₃	H	H	CH ₃ SO ₂ CH ₂ CO	H
17 - 20	CF ₃	H	CF ₃	H	CF ₃	H	H	MeCO	H
17 - 21	CF ₃	H	CF ₃	H	CF ₃	H	H	EtCO	H
17 - 22	CF ₃	H	CF ₃	H	CF ₃	H	H	CF ₃ CH ₂ CO	H
17 - 23	CF ₃	H	CF ₃	H	CF ₃	H	H	ciclo-PrCO	H
17 - 24	CF ₃	H	CF ₃	H	CF ₃	H	H	EtNHCO	H
17 - 25	CF ₃	H	CF ₃	H	CF ₃	H	H	CH ₃ SCH ₂ CO	H
17 - 26	CF ₃	H	CF ₃	H	CF ₃	H	H	CH ₃ SOCH ₂ CO	H
17 - 27	CF ₃	H	CF ₃	H	CF ₃	H	H	CH ₃ SO ₂ CH ₂ CO	H
17 - 28	Cl	H	Cl	H	CF ₃	H	H	ciclo-PrCH ₂ CO	H
17 - 29	Cl	H	Cl	H	CF ₃	H	H	MeCOCH ₂ CO	H
17 - 30	Cl	H	Cl	H	CF ₃	H	H	ciclo-PrNHCO	H
17 - 31	Cl	H	Cl	H	CF ₃	H	H	CHCCH ₂ NHCO	H
17 - 32	Cl	H	Cl	H	CF ₃	H	H	CH ₂ =CHCH ₂ NHCO	H
17 - 33	Cl	H	Cl	H	Cl	H	H	CF ₃ CH ₂ CO	H
17 - 34	Cl	H	Cl	H	Me	H	H	CF ₃ CH ₂ CO	H
17 - 35	Cl	H	Cl	H	Br	H	H	CF ₃ CH ₂ CO	H
17 - 36	Cl	H	Cl	H	CF ₃	Me	H	ciclo-PrCO	H
17 - 37	Cl	H	Cl	H	CF ₃	H	Me	EtNHCO	H
17 - 38	Cl	H	Cl	H	CF ₃	Me	Me	ciclo-PrCH ₂ CO	H
17 - 39	Cl	H	Cl	H	CF ₃	CN	H	CH ₂ =CHCH ₂ NHCO	H

Tabla 18

Nº	R ₁ '	R ₂ '	R ₃ '	R ₄ '	Y ₂	Y ₃	R ⁴
18 - 1	Me	Me	Me	Me	H	H	MeCO
18 - 2	Me	Me	Me	Me	H	H	EtCO
18 - 3	Me	Me	Me	Me	H	H	ciclo-PrCO
18 - 4	Me	Me	Me	Me	H	H	CF ₃ CH ₂ CO
18 - 5	Me	Me	Me	Me	H	H	EtNCO
18 - 6	Me	Me	Me	Me	H	H	terc-BuO(C=O)
18 - 7	Me	Me	Me	Me	H	H	MeO(C=O)
18 - 8	Me	Me	Me	Me	H	H	PhCH ₂ O(C=O)
18 - 9	Me	Me	Me	Me	H	Br	MeCO
18 - 10	Me	Me	Me	Me	H	Br	EtCO
18 - 11	Me	Me	Me	Me	H	Br	ciclo-PrCO
18 - 12	Me	Me	Me	Me	H	Br	CF ₃ CH ₂ CO
18 - 13	Me	Me	Me	Me	H	Br	EtNCO
18 - 14	Me	Me	Me	Me	H	Br	terc-BuO(C=O)
18 - 15	Me	Me	Me	Me	H	Br	MeO(C=O)
18 - 16	Me	Me	Me	Me	H	Br	PhCH ₂ O(C=O)
18 - 17	Me	Me	Me	Me	H	Cl	MeCO
18 - 18	Me	Me	Me	Me	H	Cl	EtCO
18 - 19	Me	Me	Me	Me	H	Cl	ciclo-PrCO
18 - 20	Me	Me	Me	Me	H	Cl	CF ₃ CH ₂ CO
18 - 21	Me	Me	Me	Me	H	Cl	EtNCO
18 - 22	Me	Me	Me	Me	H	Cl	terc-BuO(C=O)
18 - 23	Me	Me	Me	Me	H	Cl	MeO(C=O)
18 - 24	Me	Me	Me	Me	H	Cl	PhCH ₂ O(C=O)
18 - 25	Me	Me	Me	Me	H	CF ₃	MeCO
18 - 26	Me	Me	Me	Me	H	CF ₃	EtCO
18 - 27	Me	Me	Me	Me	H	CF ₃	ciclo-PrCO
18 - 28	Me	Me	Me	Me	H	CF ₃	CF ₃ CH ₂ CO
18 - 29	Me	Me	Me	Me	H	CF ₃	EtNCO
18 - 30	Me	Me	Me	Me	H	CF ₃	terc-BuO(C=O)
18 - 31	Me	Me	Me	Me	H	CF ₃	MeO(C=O)
18 - 32	Me	Me	Me	Me	H	CF ₃	PhCH ₂ O(C=O)
18 - 33	Me	Me	Me	Me	H	Me	terc-BuO(C=O)
18 - 34	Me	Me	Me	Me	H	F	terc-BuO(C=O)
18 - 35	Me	Me	Me	Me	H	I	terc-BuO(C=O)
18 - 36	Me	Me	Me	Me	H	NO ₂	terc-BuO(C=O)
18 - 37	Me	Me	Me	Me	H	SMe	terc-BuO(C=O)
18 - 38	Me	Me	Me	H	H	H	MeCO
18 - 39	Me	Me	Me	H	H	H	EtCO
18 - 40	Me	Me	Me	H	H	H	ciclo-PrCO
18 - 41	Me	Me	Me	H	H	H	CF ₃ CH ₂ CO
18 - 42	Me	Me	Me	H	H	H	EtNCO
18 - 43	Me	Me	Me	H	H	H	terc-BuO(C=O)
18 - 44	Me	Me	Me	H	H	H	MeO(C=O)
18 - 45	Me	Me	Me	H	H	H	PhCH ₂ O(C=O)
18 - 46	Me	Me	Me	H	H	Br	MeCO
18 - 47	Me	Me	Me	H	H	Br	EtCO
18 - 48	Me	Me	Me	H	H	Br	ciclo-PrCO
18 - 49	Me	Me	Me	H	H	Br	CF ₃ CH ₂ CO
18 - 50	Me	Me	Me	H	H	Br	EtNCO

(continuación)

Nº	R ₁ '	R ₂ '	R ₃ '	R ₄ '	Y ₂	Y ₃	R ⁴
18 - 51	Me	Me	Me	H	H	Br	terc-BuO(C=O)
18 - 52	Me	Me	Me	H	H	Br	MeO(C=O)
18 - 53	Me	Me	Me	H	H	Br	PhCH ₂ O(C=O)
18 - 54	Me	Me	Me	H	H	Cl	MeCO
18 - 55	Me	Me	Me	H	H	Cl	EtCO
18 - 56	Me	Me	Me	H	H	Cl	ciclo-PrCO
18 - 57	Me	Me	Me	H	H	Cl	CF ₃ CH ₂ CO
18 - 58	Me	Me	Me	H	H	Cl	EtNCO
18 - 59	Me	Me	Me	H	H	Cl	terc-BuO(C=O)
18 - 60	Me	Me	Me	H	H	Cl	MeO(C=O)
18 - 61	Me	Me	Me	H	H	Cl	PhCH ₂ O(C=O)
18 - 62	Me	Me	Me	H	H	CF ₃	MeCO
18 - 63	Me	Me	Me	H	H	CF ₃	EtCO
18 - 64	Me	Me	Me	H	H	CF ₃	ciclo-PrCO
18 - 65	Me	Me	Me	H	H	CF ₃	CF ₃ CH ₂ CO
18 - 66	Me	Me	Me	H	H	CF ₃	EtNCO
18 - 67	Me	Me	Me	H	H	CF ₃	terc-BuO(C=O)
18 - 68	Me	Me	Me	H	H	CF ₃	MeO(C=O)
18 - 69	Me	Me	Me	H	H	CF ₃	PhCH ₂ O(C=O)
18 - 70	Me	Me	Me	H	H	Me	terc-BuO(C=O)
18 - 71	Me	Me	Me	H	H	F	terc-BuO(C=O)
18 - 72	Me	Me	Me	H	H	I	terc-BuO(C=O)
18 - 73	Me	Me	Me	H	H	NO ₂	terc-BuO(C=O)
18 - 74	Me	Me	Me	H	H	SMe	terc-BuO(C=O)

Tabla 19

Nº	RMN- ¹ H
1 - 21	RMN- ¹ H (CDCl ₃) δ: 3,48 (1H, d), 3,81 (1H, d), 4,49 (1H, d), 4,94 (1H, d), 7,27 (2H, s), 7,40 (1H, t), 7,64 (1H, d), 7,94 (1H, dd), 8,16 (1H, s), 8,26 (1H, d), 8,60 (1H, s)
1 - 35	RMN- ¹ H (CDCl ₃) δ: 3,49 (1H, d), 3,81 (1H, dd), 4,49 (1H, d), 4,94 (1H, dd), 6,59 (1H, dd), 7,28 (2H, d), 7,40 (1H, dd), 7,85 (1H, d), 7,95 (1H, d), 8,19 (1H, dd), 8,25 (1H, d), 8,28 (1H, d)
1 - 36	RMN- ¹ H (CDCl ₃) δ: 3,49 (1H, d), 3,82 (1H, dd), 4,50 (1H, d), 4,96 (1H, dd), 7,27 (2H, d), 7,31 (1H, dd), 7,40 (1H, d), 7,42 (1H, d), 7,56 (1H, d), 7,93 (1H, s), 8,23 (1H, dd), 8,30 (1H, d)
1 - 37	RMN- ¹ H (CDCl ₃) δ: 3,52 (1H, d), 3,84 (1H, dd), 4,52 (1H, d), 4,97 (1H, dd), 7,28 (2H, t), 7,41 (1H, dd), 7,95 (1H, d), 8,06 (1H, d), 8,28 (1H, dd), 8,37 (1H, d), 8,38 (1H, d)
1 - 38	RMN- ¹ H (CDCl ₃) δ: 3,50 (1H, d), 3,83 (1H, dd), 4,50 (1H, d), 4,95 (1H, dd), 7,28 (2H, d), 7,40 (1H, dd), 7,40 (2H, s), 8,24 - 8,23 (2H, m), 8,30 (1H, d)
1 - 39	RMN- ¹ H (CDCl ₃) δ: 3,50 (1H, d), 3,82 (1H, d), 4,51 (1H, d), 4,96 (1H, d), 7,27 (2H, s), 7,41 (1H, d), 7,93 (1H, d), 8,22 - 8,27 (2H, m), 8,32 (1H, d), 8,90 (1H, d)
1 - 41	RMN- ¹ H (CDCl ₃) δ: 3,53 (1H, d), 3,85 (1H, dd), 4,53 (1H, d), 4,98 (1H, dd), 7,28 (2H, d), 7,41 (1H, dd), 8,27 (1H, d), 8,32 (1H, dd), 8,41 (1H, d), 8,82 (1H, s)
1 - 42	RMN- ¹ H (CDCl ₃) δ: 3,55 (1H, d), 3,86 (1H, dd), 4,53 (1H, d), 4,99 (1H, dd), 7,29 (2H, d), 7,41 (1H, dd), 8,01 (1H, d), 8,34 (1H, dd), 8,44 (1H, d), 9,36 (1H, s)
1 - 72	RMN- ¹ H (CDCl ₃) δ: 3,56 (1H, d), 3,95 (1H, d), 4,58 (1H, d), 5,09 (1H, d), 7,83 (2H, s), 7,93 - 7,98 (2H, m), 8,29 (3H, m), 8,91 (1H, d)
1 - 74	RMN- ¹ H (CDCl ₃) δ: 3,59 (1H, d), 3,93 (1H, d), 4,59 (1H, d), 5,06 (1H, d), 7,66 (1H, t), 7,75 (1H, d), 7,94 (1H, d), 8,22 (1H, s), 8,26 - 8,36 (4H, m), 8,90 (1H, s)
1 - 78	RMN- ¹ H (CDCl ₃) δ: 3,48 (1H, d), 3,82 (1H, d), 4,50 (1H, d), 4,96 (1H, d), 7,41 (2H, s), 7,94 (1H, d), 8,22 - 8,32 (3H, m), 8,90 (1H, s)
1 - 82	RMN- ¹ H (CDCl ₃) δ: 3,53 (1H, d), 3,88 (1H, d), 4,55 (1H, d), 5,02 (1H, d), 7,55 - 7,72 (4H, m), 7,94 (1H, d), 8,21 - 8,30 (3H, m), 8,90 (1H, s)
1 - 83	RMN- ¹ H (CDCl ₃) δ: 3,53 (1H, d), 3,85 (1H, d), 4,55 (1H, d), 4,99 (1H, d), 7,25 - 7,35 (2H, m), 7,48 (1H, t), 7,93 (1H, d), 8,22 - 8,29 (3H, m), 8,32 (1H, s), 8,89 (1H, s)
1 - 94	RMN- ¹ H (CDCl ₃) δ: 3,50 (1H, d), 3,79 (1H, d), 4,50 (1H, d), 4,96 (1H, d), 7,47 (2H, s), 7,71 (1H, s), 7,92 - 7,95 (1H, m), 8,21 - 8,34 (3H, m), 8,90 (1H, s)
1 - 95	RMN- ¹ H (CDCl ₃) δ: 3,51 (1H, d), 3,88 (1H, d), 4,52 (1H, d), 5,01 (1H, d), 7,65 (2H, d), 7,95 (1H, dd), 8,22 - 8,35 (3H, m), 8,91 (1H, s)
1 - 96	RMN- ¹ H (CDCl ₃) δ: 3,50 (1H, d), 3,81 (1H, dd), 4,51 (1H, d), 4,96 (1H, dd), 7,27 (2H, d), 7,41 (1H, dd), 7,92 (1H, d), 8,11 (1H, s), 8,25 (1H, dd), 8,32 (1H, d), 8,62 (1H, s)

(continuación)

Nº	RMN- ¹ H
1 - 97	RMN- ¹ H (CDCl ₃) δ: 3,50 (1H, d), 3,83 (1H, dd), 4,51 (1H, d), 4,97 (1H, dd), 7,27 (2H, d), 7,41 (1H, dd), 7,92 (1H, d), 8,27 (1H, dd), 8,34 (1H, d), 8,39 (1H, s), 8,88 (1H, s)
1 - 98	RMN- ¹ H (CDCl ₃) δ: 3,48 (1H, d), 3,81 (1H, dd), 4,49 (1H, d), 4,94 (1H, dd), 7,27 (2H, d), 7,40 (1H, dd), 7,77 (1H, d), 7,89 (1H, d), 8,19 (1H, dd), 8,26 - 8,25 (2H, m)
1 - 99	RMN- ¹ H (CDCl ₃) δ: 2,64 (3H, s), 3,56 (1H, d), 3,87 (1H, dd), 4,54 (1H, d), 4,99 (1H, dd), 7,29 (2H, d), 7,41 (1H, dd), 7,68 (1H, d), 8,34 (1H, dd), 8,44 (1H, d)
1 - 100	RMN- ¹ H (CDCl ₃) δ: 2,72 (3H, s), 3,51 (1H, d), 3,84 (1H, dd), 4,52 (1H, d), 4,97 (1H, dd), 7,28 (2H, d), 7,41 (1H, dd), 8,22 (1H, d), 8,28 (1H, dd), 8,37 (1H, d)
1 - 101	RMN- ¹ H (CDCl ₃) δ: 2,27 (3H, s), 3,48 (1H, d), 3,77 - 3,84 (2H, m), 4,49 (1H, d), 4,94 (1H, dd), 5,72 (1H, s), 7,27 (2H, d), 7,40 (1H, dd), 7,53 (1H, d), 8,14 (1H, dd), 8,21 (1H, d)
1 - 102	RMN- ¹ H (CDCl ₃) δ: 2,14 (3H, s), 2,33 (3H, s), 3,49 (1H, d), 3,82 (1H, dd), 4,50 (1H, d), 4,95 (1H, dd), 6,82 (1H, s), 7,27 (2H, s), 7,40 (1H, dd), 7,52 (1H, d), 8,17 (1H, dd), 8,23 (1H, s), 8,26 (1H, d)
1 - 103	RMN- ¹ H (CDCl ₃) δ: 2,37 (6H, s), 3,53 (1H, d), 3,84 (1H, d), 4,54 (1H, d), 4,98 (1H, d), 7,15 (2H, s), 7,93 (1H, d), 8,22 - 8,36 (3H, m), 8,89 (1H, s)
2 - 13	RMN- ¹ H (CDCl ₃) δ: 2,04 (3H, s), 3,41 (1H, d), 3,73 - 3,77 (1H, m), 4,43 - 4,53 (3H, m), 4,89 (1H, d), 5,98 (1H, s), 7,24 - 7,28 (2H, m), 7,38 - 7,38 (1H, m), 7,47 - 7,49 (1H, m), 7,71 - 7,78 (1H, m), 8,07 - 8,07 (1H, m)
2 - 19	RMN- ¹ H (CDCl ₃) δ: 1,18 (3H, t), 2,27 (2H, c), 3,41 (1H, d), 3,72 - 3,78 (1H, m), 4,43 - 4,54 (3H, m), 4,87 - 4,90 (1H, m), 5,93 (1H, s), 7,26 - 7,28 (2H, m), 7,38 - 7,38 (1H, m), 7,47 - 7,49 (1H, m), 7,71 - 7,74 (1H, m), 8,07 - 8,08 (1H, m)
2 - 117	RMN- ¹ H (CDCl ₃) δ: 2,04 (3H, s), 3,47 (1H, d), 3,87 (1H, d), 4,50 - 4,54 (3H, m), 5,01 (1H, d), 5,96 (1H, s), 7,50 (1H, d), 7,76 (1H, dd), 7,81 (2H, s), 7,91 (1H, s), 8,09 (1H, d)
2 - 153	RMN- ¹ H (CDCl ₃) δ: 0,75 - 0,79 (2H, m), 0,99 - 1,01 (2H, m), 1,36 - 1,44 (1H, m), 2,04 (3H, s), 3,41 (1H, d), 3,72 - 3,78 (1H, m), 4,44 (1H, d), 4,56 (2H, d), 4,88 (1H, d), 6,16 - 6,19 (1H, m), 7,26 - 7,26 (2H, m), 7,38 - 7,38 (1H, m), 7,47 - 7,49 (1H, m), 7,71 - 7,74 (1H, m), 8,07 - 8,07 (1H, m)
2 - 154	RMN- ¹ H (CDCl ₃) δ: 3,12 (2H, c), 3,42 (1H, d), 3,75 (1H, d), 4,44 (1H, d), 4,60 (2H, d), 4,89 (1H, d), 6,22 - 6,25 (1H, m), 7,24 - 7,27 (2H, m), 7,38 - 7,39 (1H, m), 7,45 - 7,48 (1H, m), 7,73 - 7,75 (1H, m), 8,09 (1H, d)
2 - 156	RMN- ¹ H (CDCl ₃) δ: 2,04 (3H, s), 3,40 (1H, d), 3,72 - 3,78 (1H, m), 4,42 (1H, d), 4,55 (2H, d), 4,86 - 4,89 (1H, m), 6,01 - 6,04 (1H, m), 7,39 (2H, s), 7,48 (1H, d), 7,66 - 7,69 (1H, m), 7,88 (1H, d)
2 - 157	RMN- ¹ H (CDCl ₃) δ: 2,26 (2H, c), 3,40 (1H, d), 3,73 - 3,76 (1H, m), 4,43 (1H, d), 4,56 (2H, d), 4,88 (1H, d), 5,89 - 5,93 (1H, m), 7,39 (2H, s), 7,49 (1H), 7,66 - 7,69 (1H, m), 7,89 (1H, d)
2 - 158	RMN- ¹ H (CDCl ₃) δ: 0,75 - 0,79 (2H, m), 0,99 - 1,01 (2H, m), 1,38 - 1,41 (1H, m), 3,40 (1H, d), 3,72 - 3,78 (1H, m), 4,43 (1H, d), 4,58 (2H, d), 4,85 - 4,91 (1H, m), 6,13 - 6,16 (1H, m), 7,39 (2H, s), 7,47 - 7,49 (1H, m), 7,66 - 7,69 (1H, m), 7,88 - 7,89 (1H, m)
2 - 161	RMN- ¹ H (CDCl ₃) δ: 2,04 (3H, s), 3,44 (1H, d), 3,79 (1H, d), 4,44 (1H, d), 4,64 (2H, d), 4,88 - 4,91 (1H, m), 6,03 - 6,05 (1H, m), 7,41 (2H, s), 7,65 - 7,68 (1H, m), 7,94 - 7,97 (1H, m), 8,12 - 8,15 (1H, m)
2 - 162	RMN- ¹ H (CDCl ₃) δ: 1,18 (3H, t), 2,27 (2H, c), 3,45 (1H, d), 3,77 - 3,82 (1H, m), 4,45 (1H, d), 4,66 (2H, d), 4,87 - 4,93 (1H, m), 5,99 - 6,01 (1H, m), 7,42 (2H, s), 7,66 - 7,69 (1H, m), 7,95 - 7,98 (1H, m), 8,13 - 8,16 (1H, m)
2 - 163	RMN- ¹ H (CDCl ₃) δ: 0,74 - 0,81 (2H, m), 0,98 - 1,05 (2H, m), 1,36 - 1,44 (1H, m), 3,44 (1H, d), 3,76 - 3,82 (1H, m), 4,45 (1H, d), 4,67 (2H, d), 4,87 - 4,93 (1H, m), 6,16 - 6,18 (1H, m), 7,41 (2H, s), 7,65 - 7,69 (1H, m), 7,94 - 7,97 (1H, m), 8,14 - 8,14 (1H, m)
2 - 164	RMN- ¹ H (CDCl ₃) δ: 3,11 - 3,15 (2H, m), 3,45 (1H, d), 3,77 - 3,82 (1H, m), 4,45 (1H, d), 4,70 (2H, dz), 4,88 - 4,94 (1H, m), 6,23 - 6,26 (1H, m), 7,40 (2H, s), 7,64 - 7,66 (1H, m), 7,96 - 7,99 (1H, m), 8,17 (1H, s)
2 - 165	RMN- ¹ H (CDCl ₃) δ: 2,04 (3H, s), 3,52 (1H, d), 3,88 - 3,94 (1H, m), 4,53 (1H, d), 4,65 (2H, d), 5,00 - 5,06 (1H, m), 6,05 - 6,07 (1H, m), 7,68 (1H, d), 7,83 (2H, s), 7,92 (1H, s), 7,99 (1H, d), 8,16 (1H, s)
2 - 166	RMN- ¹ H (CDCl ₃) δ: 1,18 (3H, t), 2,27 (2H, c), 3,52 (1H, d), 3,88 - 3,94 (1H, m), 4,53 (1H, d), 4,66 (2H, d), 5,00 - 5,06 (1H, m), 5,98 (1H, t), 7,68 (1H, d), 7,83 (2H, s), 7,92 (1H, s), 7,97 - 8,00 (1H, m), 8,16 (1H, d)
2 - 167	RMN- ¹ H (CDCl ₃) δ: 0,76 - 0,80 (2H, m), 0,96 - 1,07 (2H, m), 1,39 - 1,41 (1H, m), 3,50 - 3,53 (1H, m), 3,88 - 3,94 (1H, m), 4,52 (1H, d), 4,68 (2H, d), 5,00 - 5,06 (1H, m), 6,13 - 6,15 (1H, m), 7,68 (1H, d), 7,83 (2H, s), 7,92 (1H, s), 7,97 - 8,00 (1H, m), 8,16 (1H, s)
2 - 168	RMN- ¹ H (CDCl ₃) δ: 3,12 - 3,15 (2H, m), 3,53 (1H, d), 3,89 - 3,95 (1H, m), 4,53 (1H, d), 4,69 (2H, d), 5,03 (1H, d), 6,54 (1H, s), 7,64 (1H, d), 7,83 (2H, s), 7,92 (1H, s), 7,99 (1H, d), 8,17 (1H, s)
2 - 170	RMN- ¹ H (CDCl ₃) δ: 1,09 - 0,77 (4H, m), 1,40 (1H, m), 3,40 (1H, d), 3,75 (1H, d), 4,40 (1H, d), 4,56 (2H, d), 4,88 (1H, d), 6,17 (1H, s), 7,37 (2H, d), 7,48 (1H, d), 7,72 (1H, d), 8,06 (1H, s)
2 - 134	RMN- ¹ H (CDCl ₃) δ: 2,07 (3H, s), 3,40 (1H, d), 3,75 (1H, d), 4,43 (1H, d), 4,55 (2H, d), 4,88 (1H, d), 5,97 (1H, s), 7,40 (2H, s), 7,49 (1H, d), 7,73 (1H, dd), 8,07 (1H, s)
2 - 139	RMN- ¹ H (CDCl ₃) δ: 2,05 (3H, s), 3,41 (1H, d), 3,80 (1H, d), 4,45 (1H, d), 4,54 (2H, dz), 4,93 (1H, d), 5,96 (1H, s), 7,49 (1H, d), 7,59 (1H, s), 7,68 (1H, s), 7,74 (1H, dd), 8,07 (1H, d)

(continuación)

Nº	RMN- ¹ H
2 - 172	RMN- ¹ H (CDCl ₃) δ: 0,74 - 1,08 (7H, m), 1,39 - 1,42 (1H, m), 3,44 (1H, d), 3,80 (1H, d), 4,45 (1H, d), 4,57 (2H, d), 4,93 (1H, d), 6,21 (1H, s), 7,49 (1H, m), 7,59 (1H, s), 7,70 - 7,77 (2H, m), 8,06 (1H, d)
2 - 159	RMN- ¹ H (CDCl ₃) δ: 3,14 - 3,20 (2H, m), 3,42 (1H, d), 3,77 (1H, d), 4,44 (1H, d), 4,60 (2H, d), 4,89 (1H, dd), 6,35 - 6,39 (1H, m), 7,39 (2H, s), 7,46 (1H, d), 7,67 - 7,70 (1H, m), 7,89 (1H, s)
2 - 160	RMN- ¹ H (CDCl ₃) δ: 2,04 (3H, s), 3,46 (1H, d), 3,79 (1H, dd), 4,45 (1H, d), 4,64 (3H, d), 4,91 (1H, dd), 6,02 - 6,04 (1H, m), 7,27 (2H, s), 7,38 - 7,39 (1H, m), 7,67 (1H, d), 7,96 (1H, d), 8,14 (1H, s)
2 - 171	RMN- ¹ H (CDCl ₃) δ: 3,10 - 3,14 (2H, m), 3,40 (1H, d), 3,75 (1H, dd), 4,42 - 4,45 (1H, m), 4,59 (2H, d), 4,88 (1H, dd), 6,29 - 6,30 (1H, m), 7,39 - 7,48 (3H, m), 7,72 - 7,75 (1H, m), 8,08 - 8,09 (1H, m)
2 - 173	RMN- ¹ H (CDCl ₃) δ: 3,14 (2H, c), 3,43 (1H, d), 3,80 (1H, d), 4,45 (1H, d), 4,58 (2H, d), 4,93 (1H, d), 6,43 (1H, s), 7,45 (1H, d), 7,59 (1H, s), 7,84 - 7,68 (2H, m), 8,06 (1H, s)
2 - 174	RMN- ¹ H (CDCl ₃) δ: 2,04 (3H, s), 3,40 (1H, d), 3,74 (1H, d), 4,43 (1H, d), 4,54 (2H, d), 4,88 (1H, d), 5,97 (1H, s), 7,46 - 7,48 (3H, m), 7,68 - 7,75 (2H, m), 8,07 (1H, d)
2 - 176	RMN- ¹ H (CDCl ₃) δ: 0,74 - 1,08 (4H, m), 1,32 - 1,44 (1H, m), 3,41 (1H, d), 3,74 (1H, d), 4,42 (1H, d), 4,57 (2H, d), 4,88 (1H, d), 6,19 (1H, d), 7,45 - 7,48 (3H, m), 7,70 - 7,75 (2H, m), 8,07 (1H, d)
2 - 177	RMN- ¹ H (CDCl ₃) δ: 3,12 (2H, c), 3,41 (1H, d), 3,75 (1H, d), 4,43 (1H, d), 4,60 (2H, d), 4,89 (1H, d), 6,25 (1H, s), 7,45 (3H, m), 7,76 - 7,68 (2H, m), 8,09 (1H, s)
2 - 179	RMN- ¹ H (CDCl ₃) δ: 0,76 - 0,79 (2H, m), 0,99 - 1,02 (2H, m), 1,35 - 1,44 (1H, m), 3,47 (1H, d), 3,88 (1H, d), 4,50 - 4,56 (3H, m), 5,01 (1H, d), 6,13 (1H, s), 7,50 (1H, d), 7,74 - 7,81 (3H, m), 7,91 (1H, s), 8,09 (1H, d)
2 - 194	RMN- ¹ H (CDCl ₃) δ: 3,40 - 3,43 (1H, m), 3,76 (1H, dd), 3,97 (2H, s), 4,43 (1H, d), 4,88 (1H, d), 7,40 (2H, s), 7,50 (1H, d), 7,76 - 7,78 (1H, m), 8,04 - 8,05 (1H, m)
2 - 195	RMN- ¹ H (CDCl ₃) δ: 1,14 (3H, t), 3,20 - 3,25 (2H, m), 3,37 - 3,42 (1H, m), 3,72 - 3,77 (1H, m), 4,25 - 4,26 (1H, m), 4,43 - 4,46 (4H, m), 4,78 - 4,90 (2H, m), 7,39 (2H, s), 7,52 (1H, d), 7,71 - 7,74 (1H, m), 8,05 - 8,06 (1H, m)
2 - 196	RMN- ¹ H (CDCl ₃) δ: 0,91 (3H, t), 1,48 - 1,55 (2H, m), 3,12 - 3,16 (2H, m), 3,39 (1H, d), 3,74 (1H, dd), 4,36 - 4,46 (3H, m), 4,84 - 4,88 (2H, m), 7,39 (2H, s), 7,52 (1H, d), 7,71 - 7,73 (1H, m), 8,05 - 8,05 (1H, m)
2 - 197	RMN- ¹ H (CDCl ₃) δ: 1,46 (9H, s), 3,44 (1H, d), 3,79 (1H, d), 4,44 - 4,53 (3H, m), 4,90 - 4,95 (2H, m), 7,41 (2H, s), 7,68 (1H, d), 7,97 - 8,00 (1H, m), 8,13 (1H, s)
2 - 199	RMN- ¹ H (CDCl ₃) δ: 1,13 (3H, t), 3,19 - 3,24 (2H, m), 3,40 (1H, d), 3,75 (1H, dd), 4,37 - 4,48 (4H, m), 4,84 - 4,89 (2H, m), 7,39 (2H, s), 7,51 (1H, d), 7,67 (1H, dd), 7,86 (1H, d)
2 - 200	RMN- ¹ H (CDCl ₃) δ: 1,09 - 1,15 (3H, m), 3,16 - 3,25 (2H, m), 3,50 (1H, d), 3,90 (1H, d), 4,48 - 4,62 (4H, m), 5,00 - 5,02 (2H, m), 7,72 (1H, d), 7,83 (2H, s), 7,93 - 7,96 (2H, m), 8,13 (1H, s)
2 - 201	RMN- ¹ H (CDCl ₃) δ: 1,13 (3H, t), 3,19 - 3,24 (2H, m), 3,43 (1H, d), 3,78 (1H, dd), 4,43 - 4,45 (2H, m), 4,60 (2H, d), 4,84 - 4,90 (2H, m), 7,40 (2H, s), 7,73 (1H, d), 7,95 (1H, d), 8,12 (1H, s)
2 - 202	RMN- ¹ H (CDCl ₃) δ: 1,45 (9H, s), 3,40 (1H, d), 3,76 (1H, d), 4,41 - 4,44 (3H, m), 4,88 (1H, d), 5,07 - 5,10 (1H, m), 7,42 - 7,45 (3H, m), 7,73 - 7,76 (1H, m), 8,05 - 8,05 (1H, m)
2 - 203	RMN- ¹ H (CDCl ₃) δ: 3,41 (1H, d), 3,75 (1H, dd), 4,44 (1H, d), 4,65 (2H, d), 4,88 (1H, d), 6,92 - 6,95 (1H, m), 7,41 - 7,45 (3H, m), 7,74 - 7,77 (1H, m), 8,10 - 8,10 (1H, m)
2 - 204	RMN- ¹ H (CDCl ₃) δ: 2,04 (3H, s), 3,47 (1H, d), 3,84 (1H, dd), 4,47 (1H, d), 4,66 (2H, d), 4,95 (1H, dd), 6,08 - 6,10 (1H, m), 7,61 - 7,70 (3H, m), 7,97 (1H, d), 8,15 (1H, s)
2 - 205	RMN- ¹ H (CDCl ₃) δ: 1,14 - 1,19 (3H, m), 2,23 - 2,31 (2H, m), 3,47 (1H, d), 3,84 (1H, dd), 4,47 (1H, d), 4,65 (2H, d), 4,95 (1H, dd), 6,04 (1H, m), 7,61 - 7,70 (3H, m), 7,95 - 7,98 (1H, m), 8,15 (1H, s)
2 - 206	RMN- ¹ H (CDCl ₃) δ: 3,08 - 3,19 (2H, m), 3,46 (1H, d), 3,85 (1H, dd), 4,48 (1H, d), 4,71 (2H, d), 4,93 - 4,99 (1H, m), 6,20 - 6,23 (1H, m), 7,60 - 7,69 (3H, m), 7,97 - 8,00 (1H, m), 8,18 (1H, s)
2 - 207	RMN- ¹ H (CDCl ₃) δ: 0,76 - 0,80 (2H, m), 0,99 - 1,02 (2H, m), 1,38 - 1,41 (1H, m), 3,46 (1H, d), 3,84 (1H, dd), 4,47 (1H, d), 4,67 (2H, d), 4,95 (1H, dd), 6,13 - 6,15 (1H, m), 7,63 - 7,67 (3H, m), 7,97 (1H, d), 8,15 (1H, s)
2 - 208	RMN- ¹ H (CDCl ₃) δ: 1,08 (3H, t), 3,13 - 3,16 (2H, m), 3,44 (1H, d), 3,82 (1H, dd), 4,44 - 4,52 (3H, m), 4,90 - 4,97 (2H, m), 5,35 - 5,37 (1H, m), 7,60 - 7,70 (3H, m), 7,92 (1H, d), 8,07 - 8,07 (1H, m)
2 - 209	RMN- ¹ H (CDCl ₃) δ: 2,11 (3H, s), 3,23 - 3,27 (3H, m), 3,48 (1H, d), 3,82 (1H, dd), 4,47 (1H, d), 4,71 (2H, d), 4,92 (1H, d), 7,43 (2H, s), 7,66 (1H, d), 7,97 (1H, d), 8,15 (1H, s)
2 - 210	RMN- ¹ H (CDCl ₃) δ: 1,17 (3H, t), 2,26 (2H, c), 3,45 (1H, d), 3,79 (1H, dd), 4,45 (1H, d), 4,66 (2H, d), 4,91 (1H, dd), 5,90 - 5,92 (1H, m), 7,27 (2H, s), 7,38 - 7,39 (1H, m), 7,67 (1H, d), 7,96 (1H, d), 8,14 (1H, s)
2 - 211	RMN- ¹ H (CDCl ₃) δ: 3,11 - 3,21 (2H, m), 3,48 (1H, d), 3,81 (1H, dd), 4,47 (1H, d), 4,69 (2H, d), 4,92 (1H, dd), 6,39 - 6,41 (1H, m), 7,27 (2H, s), 7,38 - 7,39 (1H, m), 7,62 (1H, d), 7,97 (1H, d), 8,15 (1H, s)
2 - 212	RMN- ¹ H (CDCl ₃) δ: 0,75 - 0,79 (2H, m), 0,98 - 1,07 (2H, m), 1,35 - 1,44 (1H, m), 3,45 (1H, d), 3,79 (1H, dd), 4,46 (1H, d), 4,67 (2H, d), 4,91 (1H, dd), 6,13 - 6,16 (1H, m), 7,29 (2H, s), 7,38 - 7,39 (1H, m), 7,67 (1H, d), 7,96 (1H, d), 8,14 (1H, s)
2 - 213	RMN- ¹ H (CDCl ₃) δ: 1,11 (3H, t), 3,18 - 3,23 (2H, m), 3,44 (1H, d), 3,78 (1H, dd), 4,43 - 4,57 (4H, m), 4,86 - 5,00 (2H, m), 7,27 (2H, s), 7,38 - 7,39 (1H, m), 7,71 (1H, d), 7,94 (1H, d), 8,11 (1H, s)

(continuación)

Nº	RMN- ¹ H
2 - 214	RMN- ¹ H (CDCl ₃) δ: 2,09 (3H, s), 3,23 - 3,26 (3H, m), 3,47 (1H, d), 3,80 (1H, dd), 4,47 (1H, d), 4,71 (2H, d), 4,92 (1H, dd), 7,27 (2H, s), 7,38 - 7,39 (1H, m), 7,66 (1H, d), 7,98 (1H, d), 8,16 (1H, s)
2 - 392	RMN- ¹ H (CDCl ₃) δ: 1,46 (9H, s), 3,51 (1H, d), 3,90 - 3,93 (1H, m), 4,49 - 4,55 (3H, m), 5,00 - 5,05 (2H, m), 7,69 (1H, d), 7,82 (2H, s), 7,92 (1H, s), 8,01 (1H, d), 8,15 (1H, s)
11 - 5	RMN- ¹ H (CDCl ₃) δ: 2,04 (3H, s), 3,62 (1H, d), 3,87 (1H, d), 4,59 (1H, d), 4,93 (2H, d), 5,07 (1H, d), 5,70 (1H, s a), 7,53 - 7,41 (3H, m), 7,70 - 7,57 (3H, m), 8,15 - 8,01 (1H, m), 8,99 - 8,88 (1H, m),
11 - 6	RMN- ¹ H (CDCl ₃) δ: 1,18 (3H, t), 2,25 (2H, c), 3,62 (1H, d), 3,87 (1H, d), 4,58 (1H, d), 4,92 (2H, d), 5,06 (1H, d), 5,76 (1H, s a), 7,40 - 7,51 (3H, m), 7,55 - 7,69 (3H, m), 8,01 - 8,13 (1H, m), 8,96 - 8,86 (1H, m),
11 - 7	RMN- ¹ H (CDCl ₃) δ: 0,82 - 0,70 (2H, m), 0,99 - 1,10 (2H, m), 1,30 - 1,41 (1H, m), 3,62 (1H, d), 3,87 (1H, d), 4,58 (1H, d), 4,94 (2H, d), 5,06 (1H, d), 5,95 (1H, s a), 7,66 - 7,41 (6H, m), 8,12 - 8,02 (1H, m), 8,98 - 8,90 (1H, m),
11 - 8	RMN- ¹ H (CDCl ₃) δ: 3,11 (2H, c), 3,62 (1H, d), 3,87 (1H, d), 4,58 (1H, d), 4,89 - 5,14 (3H, m), 6,02 (1H, s a), 7,40 - 7,52 (3H, m), 7,56 - 7,69 (3H, m), 8,07 - 7,92 (1H, m), 8,99 - 8,87 (1H, m),
12 - 39	RMN- ¹ H (CDCl ₃) δ: 0,13 (9H, s), 2,14 (3H, s), 3,74 (2H, s), 7,81 - 7,87 (1H, m), 7,97 - 8,01 (2H, m), 8,08 (1H, s), 8,22 (1H, s), 8,83 (1H, s)
12 - 55	RMN- ¹ H (CDCl ₃) δ: 0,21 (9H, s), 3,56 (2H, d), 7,63 (1H, s a), 7,84 (1H, d), 8,06 (1H, dd), 8,14 (1H, d), 8,21 (1H, s), 8,85 (1H, s)
13 - 9	RMN- ¹ H (CDCl ₃) δ: 0,11 (9H, s), 2,09 (3H, s), 2,14 (3H, s), 3,64 (2H, s), 5,20 (2H, s), 7,42 - 7,47 (2H, m), 7,71 - 7,74 (1H, m)
13 - 15	RMN- ¹ H (CDCl ₃) δ: 0,11 (9H, s), 2,10 (3H, s), 2,14 (3H, s), 3,64 (2H, s), 5,22 (2H, s), 7,41 - 7,45 (2H, m), 7,53 - 7,56 (1H, m)
13 - 27	RMN- ¹ H (CDCl ₃) δ: 0,12 (9H, s), 2,09 (3H, s), 2,15 (3H, s), 3,68 (2H, s), 5,32 (2H, s), 7,57 - 7,60 (1H, m), 7,72 - 7,75 (1H, m), 7,84 - 7,87 (1H, m)
13 - 70	RMN- ¹ H (CDCl ₃) δ: 0,13 (9H, s), 2,16 (3H, s), 2,94 - 2,96 (3H, m), 5,24 (2H, s), 5,91 - 5,94 (1H, m), 7,46 - 7,76 (4H, m)
13 - 71	RMN- ¹ H (CDCl ₃) δ: 0,18 (9H, s), 2,15 (3H, s), 3,51 (2H, d), 5,18 (2H, s), 7,40 (1H, d), 7,58 - 7,60 (2H, m), 7,90 (1H, d)
13 - 75	RMN- ¹ H (CDCl ₃) δ: 0,19 (9H, s), 2,14 (3H, s), 3,53 - 3,55 (2H, m), 5,30 (2H, s), 7,56 - 7,59 (2H, m), 7,83 (1H, d, J = 8,1 Hz), 7,99 (1H, s)
15 - 2	RMN- ¹ H (CDCl ₃) δ: 0,22 (9H, s), 2,14 - 2,15 (6H, m), 3,67 (2H, s), 5,59 (2H, s), 7,56 - 7,61 (4H, m), 7,82 - 7,83 (1H, m), 8,06 - 8,15 (1H, m)
18 - 14	RMN- ¹ H (CDCl ₃) δ: 0,12 (9H, s), 1,45 (9H, s), 2,09 (3H, s), 3,17 - 3,20 (2H, m), 4,38 - 4,40 (2H, m), 5,03 - 5,06 (1H, m), 7,39 - 7,46 (2H, m), 7,69 (1H, d)
18 - 30	RMN- ¹ H (CDCl ₃) δ: 0,12 (9H, s), 1,46 (9H, s), 2,08 (3H, s), 3,21 (1H, s), 3,67 (1H, s), 4,51 - 4,54 (2H, m), 4,94 - 5,00 (1H, m), 7,60 - 7,70 (2H, m), 7,79 (1H, s)
18 - 51	RMN- ¹ H (CDCl ₃) δ: 0,18 (9H, s), 1,45 (9H, s), 3,51 (2H, d), 4,36 (2H, d), 5,06 - 5,10 (1H, m), 7,36 - 7,39 (1H, m), 7,53 - 7,56 (2H, m), 7,90 (1H, d)
18 - 67	RMN- ¹ H (CDCl ₃) δ: 0,17 (9H, s), 1,44 (9H, s), 3,52 (2H, d), 4,41 (2H, d), 5,15 - 5,16 (1H, m), 7,45 (1H, dz), 7,70 - 7,72 (1H, m), 7,94 (1H, s), 8,14 - 8,17 (1H, m)

Ejemplos biológicos

Salvo que no se indique de otro modo, las soluciones de ensayo se prepararon como sigue:

- 5 Contienen como disolvente: dimetilformamida, 3 partes en peso; y, emulsionante: polioxietilentalquil fenil éter, 1 parte en peso

Para preparar la solución de ensayo se mezcla 1 parte en peso de un compuesto activo con la cantidad anteriormente mencionada de disolvente que contiene la cantidad anteriormente mencionada de emulsionante, y la mezcla se diluye con agua hasta la concentración deseada.

10 Ejemplo de ensayo biológico 1: ensayo frente a larvas del gusano gris del tabaco (*Spodoptera litura*)

Se sumergieron hojas de boniato en la solución de ensayo a la concentración apropiada, y las hojas se secaron al aire. Las hojas se colocaron después en una placa de Petri con un diámetro de 9 cm y en la misma se colocaron diez larvas en estadio tres del gusano gris del tabaco. La placa de Petri se puso en una cámara de temperatura a 25 °C. Después de 2 días y 4 días se añadieron adicionalmente hojas de boniato. Después de 7 días se contó el número de larvas para calcular la actividad insecticida. Una actividad insecticida del 100 % significa que se habían exterminado todas las larvas, mientras que una actividad insecticida del 0 % significa que no se había exterminado ninguna larva. En el ensayo actual, se promediaron los resultados de las placas de Petri para cada partición.

15

En el ejemplo de ensayo biológico 1, los compuestos N^{os} 1 - 21, 1 - 39, 1 - 72, 1 - 78, 1 - 94, 1 - 95, 2 - 13, 2 - 19, 2 - 153, 2 - 154, 2 - 156, 2 - 157, 2 - 158, 2 - 159, 2 - 160, 2 - 161, 2 - 162, 2 - 163, 2 - 164, 2 - 165, 2 - 166, 2 - 167, 2 - 168, 2 - 170, 2 - 171, 2 - 172, 2 - 173, 2 - 179, 2 - 180, 2 - 195, 2 - 205, 2 - 209, 2 - 211, 2 - 212, 11 - 5, 11 - 6, 11 - 7, 11 - 8, mostraron una actividad insecticida del 100 % a una concentración del compuesto activo de 100 ppm.

- 5 Los compuestos N^{os} 1 - 35, 1 - 37, 1 - 36, 1 - 41, 1 - 42, 1 - 96, 1 - 97, 1 - 98, 1 - 99, 2 - 117, 2 - 134, 2 - 139, 2 - 147, 2 - 174, 2 - 176, 2 - 177, 2 - 194, 2 - 196, 2 - 197, 2 - 199, 2 - 200, 2 - 201, 2 - 202, 2 - 203, 2 - 204, 2 - 206, 2 - 207, 2 - 208, 2 - 210, 2 - 211, 2 - 212, 2 - 213, 2 - 214, 2 - 392, mostraron una actividad insecticida de ≥ 80 % a una concentración del compuesto activo de 100 ppm.

Ejemplo de ensayo biológico 2: ensayo frente a la araña roja de dos puntos (*Tetranychus urticae*)

- 10 Se inocularon entre 50 y 100 arañas rojas de dos puntos adultas en hojas de habas en el estadio de segundo hoja verdadera, planta que había sido cultivada en una maceta con un diámetro de 6 cm. Después de un día, se pulverizó la solución de ensayo a la concentración apropiada sobre la misma en una cantidad suficiente mediante el uso de una pistola pulverizadora. Después de la pulverización, la maceta de la planta se puso dentro de un invernadero y después de 7 días se calculó la actividad acaricida. Una actividad acaricida del 100 % significa que todas las arañas se habían exterminado, mientras que una actividad acaricida del 0 % significa que ningún araña se había exterminado.

- 15 Los compuestos N^{os} 1 - 21, 1 - 72, 1 - 78, 1 - 94, 1 - 95, 2 - 154, 2 - 156, 2 - 157, 2 - 158, 11 - 5, 11 - 6, 11 - 7, 11 - 8, 2 - 159, 2 - 160, 2 - 161, 2 - 162, 2 - 163, 2 - 164, 2 - 165, 2 - 166, 2 - 167, 2 - 168, 2 - 170, 2 - 171, 2 - 172, 2 - 173, 2 - 179, 2 - 180, 2 - 195, 2 - 205, 2 - 209, 2 - 211, 2 - 212 mostraron una actividad acaricida del 100 % a una concentración del compuesto activo de 100 ppm. El compuesto N^o 1 - 39 mostró una actividad acaricida del 98 % a una concentración de 100 ppm.

Ejemplo de ensayo biológico 3: ensayo frente al escarabajo de las hojas de las cucurbitáceas (*Aulacophora femoralis*)

- 25 Se sumergieron hojas de pepino en la solución de ensayo a la concentración apropiada, y las hojas se secaron al aire. Después las hojas se colocaron en una copa de plástico que contenía tierra negra esterilizada asépticamente y en la misma se liberaron cinco larvas en el segundo estadio del escarabajo de las hojas de las cucurbitáceas. Después de 7 días se contó el número de larvas muertas, y por lo tanto se calculó la actividad insecticida. Una actividad insecticida del 100 % significa que todos los escarabajos se habían exterminado, mientras que una actividad insecticida del 0 % significa que no se había exterminado ningún escarabajo.

- 30 Los compuestos N^{os} 1 - 21, 1 - 39, 1 - 72, 1 - 78, 1 - 94, 1 - 95, 2 - 19, 2 - 153, 2 - 154, 2 - 156, 2 - 157, 2 - 158, 11 - 5, 11 - 6, 11 - 7, 11 - 8, 2 - 159, 2 - 160, 2 - 161, 2 - 162, 2 - 163, 2 - 164, 2 - 165, 2 - 166, 2 - 167, 2 - 168, 2 - 170, 2 - 171, 2 - 172, 2 - 173, 2 - 179, 2 - 180, 2 - 195, 2 - 205, 2 - 209, 2 - 211, 2 - 212 mostraron una actividad insecticida del 100 % a una concentración del compuesto activo de 100 ppm.

Ejemplo de ensayo biológico 4: ensayo frente a una variedad del pulgón verde del melocotonero (*Myzus persicae*) que es resistente a los agentes organofosforados y de carbamato

- 35 Se inocularon entre aproximadamente 30 y 50 de los pulgones verdes del melocotonero resistentes por plántula, en las hojas de una berenjena en el estadio de segunda hoja verdadera, planta que había sido cultivada en una maceta con un diámetro de 6 cm. Un día después de la inoculación se pulverizó la solución de ensayo a la concentración apropiada en una cantidad suficiente mediante el uso de una pistola pulverizadora. Después de la pulverización, la maceta de la planta se puso dentro de un invernadero a 28 °C y después de 7 días se calculó la actividad insecticida. Una actividad insecticida del 100 % significa que se habían exterminado todos los pulgones, mientras que una actividad insecticida del 0 % significa que no se había exterminado ningún pulgón. El ensayo se repitió dos veces.

- 45 Los compuestos N^{os} 1 - 21, 1 - 72, 1 - 78, 1 - 94, 1 - 95, 2 - 156, 2 - 157, 2 - 158, 11 - 5, 11 - 6, 11 - 7, 11 - 8, 2 - 159, 2 - 160, 2 - 161, 2 - 162, 2 - 163, 2 - 164, 2 - 165, 2 - 166, 2 - 167, 2 - 168, 2 - 170, 2 - 171, 2 - 172, 2 - 173, 2 - 179, 2 - 180, 2 - 195, 2 - 205, 2 - 209, 2 - 211, 2 - 212 mostraron una actividad insecticida del 100 % a una concentración del compuesto activo de 500 ppm, y el compuesto n^o 1 - 39 mostró unos efectos de control de una actividad insecticida del 98 % a una concentración de 500 ppm.

- 50 Los compuestos N^{os} 1 - 39, 1 - 42, 1 - 72, 1 - 78, 1 - 94, 1 - 95, 2 - 71, 2 - 134, 2 - 139, 2 - 157, 2 - 158, 2 - 159, 2 - 160, 2 - 161, 2 - 162, 2 - 163, 2 - 164, 2 - 165, 2 - 166, 2 - 167, 2 - 168, 2 - 172, 2 - 176, 2 - 174, 2 - 179, 2 - 197, 2 - 199, 2 - 201, 2 - 202, 2 - 173, 2 - 147, 2 - 209, 2 - 210, 2 - 211, 2 - 212, 2 - 214, 2 - 392, 11 - 5, 11 - 6, 11 - 7 y 11 - 8 mostraron una actividad insecticida de ≥ 80 % a una concentración del compuesto activo de 100 ppm.

Ejemplo de ensayo biológico 5: ensayo frente a las pulgas de gato (*Ctenocephalides felis*)

Disolvente: dimetilsulfóxido

Con objeto de elaborar una solución de ensayo adecuada se disuelven 10 mg de un compuesto activo en 0,5 ml del disolvente mencionado anteriormente, y la mezcla se diluye con la sangre de un animal doméstico hasta una concentración determinada.

5 Se proporcionan entre aproximadamente 10 y 15 pulgas de gato adultas en un recipiente exclusivo para pulgas. Un recipiente exclusivo que contiene la solución de ensayo se recubre con parafilm, se invierte boca abajo y después se pone en la parte superior del recipiente de las pulgas, de forma que las pulgas de gato puedan succionar la sangre del recipiente. La solución de ensayo se mantiene a 37 °C y el recipiente de las pulgas se mantiene a la temperatura ambiente. Después de 2 días se mide la tasa de mortalidad de las pulgas de gato. Un 100 % significa que todas las pulgas de gato se han exterminado, mientras que un 0 % significa que todas siguen vivas.

10 Los compuestos N^{os} 1 - 21 mostraron una tasa de mortalidad de al menos el 90 % a una concentración del compuesto activo de 100 ppm, y el compuesto N^o 1 - 39 mostró una tasa de mortalidad del 100 % a 100 ppm.

15 Adicionalmente, los compuestos N^{os} 1 - 35, 1 - 72, 1 - 78, 1 - 94, 1 - 95, 1 - 100, 2 - 13, 2 - 19, 2 - 117, 2 - 134, 2 - 139, 2 - 147, 2 - 153, 2 - 154, 2 - 156, 2 - 157, 2 - 158, 2 - 159, 2 - 160, 2 - 161, 2 - 162, 2 - 163, 2 - 164, 2 - 165, 2 - 166, 2 - 167, 2 - 168, 2 - 170, 2 - 171, 2 - 172, 2 - 173, 2 - 174, 2 - 176, 2 - 177, 2 - 179, 2 - 180, 2 - 194, 2 - 195, 2 - 196, 2 - 197, 2 - 199, 2 - 200, 2 - 201, 2 - 202, 2 - 203, 2 - 205, 2 - 209, 2 - 211, 2 - 212, 11 - 5, 11 - 6, 11 - 7, 11 - 8, 15 - 2 mostraron una tasa de mortalidad de ≥ 80 % a una concentración del compuesto activo de 100 ppm.

Ejemplo de ensayo biológico 6: ensayo frente a la garrapata bovina (*Boophilus microplus*)

Disolvente: dimetilsulfóxido

20 Con objeto de elaborar una solución de ensayo adecuada se disuelven 10 mg de un compuesto activo en 0,5 ml del disolvente mencionado anteriormente, y la mezcla se diluye con la sangre de un animal doméstico hasta una concentración determinada.

La solución de ensayo se inyectó en el abdomen de cinco garrapatas bovinas adultas hembras completamente alimentadas. Las garrapatas bovinas se transfieren a una placa de replicación y se dejan crecer en un recipiente de crecimiento durante un cierto periodo de tiempo. Se controla la deposición de huevos fértiles.

25 Después de 7 días se mide la tasa de mortalidad de las garrapatas bovinas. Un 100 % significa que todos los huevos eran estériles; y un 0 % significa que todos los huevos eran fértiles.

Los compuestos N^{os} 1 - 21 y 1 - 39 mostraron una tasa de mortalidad del 100 % a una concentración del compuesto activo de 20 µg/animal.

30 Adicionalmente, los compuestos N^{os} 1 - 35, 1 - 72, 1 - 78, 1 - 94, 1 - 95, 1 - 99, 1 - 100, 2 - 13, 2 - 19, 2 - 117, 2 - 134, 2 - 139, 2 - 147, 2 - 153, 2 - 154, 2 - 156, 2 - 157, 2 - 158, 2 - 159, 2 - 160, 2 - 161, 2 - 162, 2 - 163, 2 - 164, 2 - 165, 2 - 166, 2 - 167, 2 - 168, 2 - 170, 2 - 171, 2 - 172, 2 - 173, 2 - 174, 2 - 176, 2 - 177, 2 - 179, 2 - 180, 2 - 194, 2 - 195, 2 - 196, 2 - 197, 2 - 199, 2 - 200, 2 - 201, 2 - 202, 2 - 203, 2 - 205, 2 - 209, 2 - 211, 2 - 212, 2 - 392, 11 - 5, 11 - 6, 11 - 7, 11 - 8, 15 - 2 mostraron una tasa de mortalidad de ≥ 80 % a una concentración del compuesto activo de 20 µg/animal.

35 Ejemplo de ensayo biológico 7: ensayo frente a la mosca de la oveja (*Lucillia cuprina*)

Disolvente: dimetilsulfóxido

Con objeto de elaborar una solución de ensayo adecuada se disuelven 10 mg de un compuesto activo en 0,5 ml del disolvente, y la mezcla se diluye con agua hasta una concentración determinada.

40 En un tubo de ensayo se colocan carne de caballo troceada con un tamaño de 1 centímetro cuadrado y 0,5 ml de la solución de ensayo, y en el mismo se introducen aproximadamente entre 20 y 30 moscas de la oveja adultas.

Después de 2 días se mide la tasa de mortalidad de las moscas de la oveja. Un 100 % significa que todas las moscas de la oveja se han exterminado, y un 0 % significa que todas siguen vivas.

Los compuestos N^{os} 1 - 21 y 1 - 39 mostraron una tasa de mortalidad del 100 % a una concentración del compuesto activo de 100 ppm

45 Adicionalmente, los compuestos N^{os} 1 - 35, 1 - 72, 1 - 78, 1 - 94, 1 - 95, 1 - 99, 1 - 100, 2 - 13, 2 - 19, 2 - 117, 2 - 134, 2 - 139, 2 - 147, 2 - 153, 2 - 154, 2 - 156, 2 - 157, 2 - 158, 2 - 159, 2 - 160, 2 - 161, 2 - 162, 2 - 163, 2 - 164, 2 - 165, 2 - 166, 2 - 167, 2 - 168, 2 - 170, 2 - 171, 2 - 172, 2 - 173, 2 - 174, 2 - 176, 2 - 177, 2 - 179, 2 - 180, 2 - 194, 2 - 195, 2 - 196, 2 - 197, 2 - 199, 2 - 200, 2 - 201, 2 - 202, 2 - 203, 2 - 205, 2 - 209, 2 - 211, 2 - 212, 2 - 392, 11 - 5, 11 - 6, 11 - 7, 11 - 8, 15 - 2 mostraron una tasa de mortalidad de ≥ 80 % a una concentración del compuesto activo de 100 ppm.

50 Ejemplo de ensayo biológico 8: ensayo frente a la mosca común (*Musca domestica*)

Disolvente: dimetilsulfóxido

Con objeto de elaborar una solución de ensayo adecuada se disuelven 10 mg de un compuesto activo en 0,5 ml del disolvente, y la mezcla se diluye con agua hasta una concentración predeterminada.

- 5 En una fase preliminar del ensayo se empapa un trozo de esponja de un cierto tamaño con una mezcla de azúcar y la solución de ensayo se coloca en un recipiente de ensayo. Se introducen diez moscas comunes adultas en el recipiente y el recipiente se cubre con una tapa perforada.

Después de 2 días se mide la tasa de mortalidad de las moscas comunes. En ese momento, un 100 % significa que todas las moscas comunes se han exterminado, y un 0 % significa que todas siguen vivas.

- 10 Los compuestos N^{os} 1 - 21 y 1 - 39 mostraron una tasa de mortalidad del 100 % a una concentración del compuesto activo de 100 ppm.

- 15 Adicionalmente, los compuestos N^{os} 1 - 35, 1 - 72, 1 - 78, 1 - 94, 1 - 95, 2 - 13, 2 - 19, 2 - 117, 2 - 134, 2 - 139, 2 - 147, 2 - 153, 2 - 154, 2 - 156, 2 - 157, 2 - 158, 2 - 159, 2 - 160, 2 - 161, 2 - 162, 2 - 163, 2 - 164, 2 - 165, 2 - 166, 2 - 167, 2 - 168, 2 - 170, 2 - 171, 2 - 172, 2 - 173, 2 - 174, 2 - 176, 2 - 177, 2 - 179, 2 - 180, 2 - 194, 2 - 195, 2 - 196, 2 - 199, 2 - 200, 2 - 201, 2 - 203, 2 - 205, 2 - 209, 2 - 211, 2 - 212, 11 - 5, 11 - 6, 11 - 7, 11 - 8 y 15 - 2 mostraron una tasa de mortalidad de ≥ 80 % a una concentración del compuesto activo de 100 ppm.

Ejemplo de ensayo biológico 9: ensayo con *Amblyomma hebraeum*

Disolvente: dimetilsulfóxido

- 20 Para producir una preparación adecuada del compuesto activo se mezcla 1 parte en peso del compuesto activo con la cantidad establecida de disolvente, y el concentrado se diluye con el disolvente que contiene hasta la concentración deseada.

Se colocan ninfas de la garrapata *Amblyomma hebraeum* en vasos de precipitados de plástico perforados y se sumergen en una solución acuosa del compuesto durante un minuto. Las garrapatas se transfieren a un papel de filtro en una placa de Petri y se incuban en una cámara climatizada durante 42 días.

- 25 Después de 2 días se determina la mortalidad en %. Un 100 % significa que todas las garrapatas se han exterminado; un 0 % significa que ninguna de las garrapatas se ha exterminado.

En este ensayo, los compuestos N^{os} 1 - 39, 1 - 78, 1 - 95, 1 - 94, 2 - 134, 2 - 139, 2 - 147, 2 - 156, 2 - 157, 2 - 158, 2 - 162, 2 - 163, 2 - 164, 2 - 170, 2 - 173, 2 - 177, 11 - 5, 11 - 6, 11 - 7, 15 - 2, mostraron una actividad de ≥ 80 % a una tasa de aplicación de 100 ppm.

Ejemplo de ensayo biológico 10: *Boophilus microplus*

- 30 Disolvente: dimetilsulfóxido

Para producir una preparación adecuada de compuesto activo se disuelven 10 mg del compuesto activo en 0,5 ml de disolvente, y el concentrado se diluye con agua hasta la concentración deseada.

- 35 Se colocan entre ocho y diez garrapatas adultas hembras engordadas de *Boophilus microplus* en vasos de precipitados de plástico perforados y se sumergen en una solución acuosa del compuesto durante un minuto. Después las garrapatas se transfieren a papel de filtro en una bandeja de plástico. A continuación se controla la deposición de huevos fértiles.

Después de 7 días se determina la mortalidad en %. Un 100 % significa que todas las garrapatas se han exterminado; un 0 % significa que ninguna de las garrapatas se ha exterminado.

Los siguientes compuestos mostraron una actividad de ≥ 80 % a una tasa de aplicación de 100 ppm:

- 40 1 - 39, 1 - 72, 1 - 78, 1 - 94, 1 - 95, 2 - 13, 2 - 19, 2 - 117, 2 - 134, 2 - 139, 2 - 147, 2 - 153, 2 - 154, 2 - 156, 2 - 157, 2 - 158, 2 - 159, 2 - 160, 2 - 161, 2 - 162, 2 - 163, 2 - 164, 2 - 165, 2 - 166, 2 - 167, 2 - 168, 2 - 170, 2 - 171, 2 - 172, 2 - 173, 2 - 174, 2 - 176, 2 - 177, 2 - 179, 2 - 180, 2 - 195, 2 - 197, 2 - 199, 2 - 201, 2 - 202, 2 - 203, 2 - 204, 2 - 205, 2 - 206, 2 - 208, 2 - 209, 2 - 211, 2 - 212, 11 - 5, 11 - 6, 11 - 7, 11 - 8, 15 - 2.

Ejemplos de formulación

- 45 **Ejemplo de formulación 1 (gránulos)**

A una mezcla de 10 partes del compuesto N^o 1 - 39, se añaden 30 partes de bentonita (montmorillonita), 58 partes de talco y 2 partes de sulfonato de lignina, 25 partes de agua. La mezcla se amasa concienzudamente. El producto se fabrica en partículas de entre 10 y 40 de retícula mediante una extrusión a través de una extrusora de tipo máquina de granulación, y se secan a entre 40 y 50 °C para obtener una preparación granular.

Ejemplo de formulación 2 (gránulos)

- 5 Se introducen 95 partes de partículas de arcilla mineral con una distribución del tamaño de partícula en el intervalo de entre 0,2 y 2 mm en una mezcladora rotatoria y mientras están en rotación se pulverizan 5 partes del compuesto N° 1 - 39 junto con un diluyente líquido para humedecer uniformemente las partículas. Después las partículas se secan a entre 40 y 50 °C para obtener una preparación granular.

Ejemplo de formulación 3 (emulsión)

Se mezclan 30 partes del compuesto N° 1 - 39, 55 partes de xileno, 8 partes de polioxietilen alquil fenil éter y 7 partes de alquilbencenosulfonato de calcio, y se agitan para obtener una preparación en emulsión

Ejemplo de formulación 4 (polvo humectable)

- 10 Se pulverizan 15 partes del compuesto N° 1 - 39, 80 partes de una mezcla de carbono blanco (óxido de silicio hidratado amorfo finamente pulverizado) y polvo de arcilla (1:5), 2 partes de alquilbencenosulfonato de sodio y 3 partes de un condensado de alquilnaftalensulfonato-formalina de sodio y se mezclan para obtener una preparación en polvo humectable.

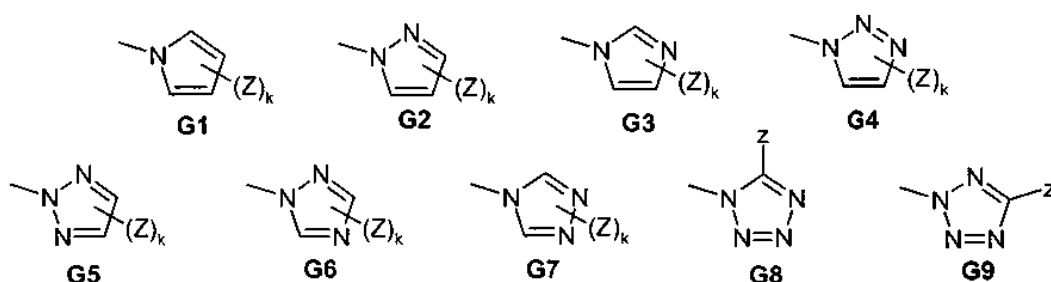
Ejemplo de formulación 5 (gránulos humectables)

- 15 Se mezclan suficientemente 20 partes del compuesto N° 1 - 39, 30 partes de ligninsulfonato de sodio, 15 partes de bentonita y 35 partes de tierra de diatomeas calcinada en polvo, y se añade agua a las mismas. La mezcla se extruye a través de un tamiz de 0,3 mm y se seca para obtener una preparación granular humectable.

Los nuevos derivados de arilpirrolina de la presente invención tienen una excelente acción insecticida y pueden ser usados como un insecticida, según se ha demostrado mediante los Ejemplos.

(I)

5 G es seleccionado de entre el grupo que consiste en los grupos heterocíclicos de 5 miembros G1 a G9 opcionalmente sustituidos:



Y representa cada uno independientemente hidrógeno; halógeno; haloalquilo C₁₋₁₂ opcionalmente sustituido; nitro; alquilo C₁₋₁₂ opcionalmente sustituido, cicloalquilo C₃₋₈, ciclohaloalquilo C₃₋₈, alcoxilo C₁₋₁₂; ciano, haloalcoxilo C₁₋₁₂ opcionalmente sustituido, alquilsulfenilo C₁₋₁₂, alquilsulfinilo C₁₋₁₂, allcilsulfonilo C₁₋₁₂, haloalquilsulfenilo C₁₋₁₂, haloalquilsulfinilo C₁₋₁₂, haloalquilsulfonilo C₁₋₁₂, alquilsulfoniloxi C₁₋₁₂, haloalquilsulfoniloxi C₁₋₁₂, allcilaminosulfonilo C₁₋₁₂, haloalquilaminosulfonilo C₁₋₁₂, dialquilaminosulfonilo C₂₋₂₄ (número total de carbonos), di(haloalquil)aminosulfonilo C₂₋₂₄ (número total de carbonos); hidroxilo; tiol; amino; alquilamino C₁₋₁₂ opcionalmente sustituido, dialquilamino C₂₋₂₄ (número total de carbonos), acilamino C₁₋₁₂, alcocixarbonilamino C₁₋₁₂, haloalcocixarbonilamino C₁₋₁₂, alquilsulfonilamino C₁₋₁₂, haloalquilsulfonilamino C₁₋₁₂, trialquilsililo C₁₋₁₂, alcoxiimino C₁₋₁₂, haloalcoxiimino C₁₋₁₂, alcoxiiminoalquilo C₁₋₁₂, haloalcoxiiminoalquilo C₁₋₁₂, alquilsulfinilimino C₁₋₁₂, alquilsulfiniliminoalquilo C₁₋₁₂, alquilsulfinilimino - C₁₋₁₂, alquilcarbonilo C₁₋₁₂, alquilsulfoxiimino C₁₋₁₂, alquilsulfoxiimino C₁₋₁₂ - alquilo C₁₋₁₂, alcocixarbonilo C₁₋₁₂, alquilcarbonilo C₁₋₁₂, aminocarbonilo, alquilaminocarbonilo C₁₋₁₂, aminotiocarbonilo, C₁₋₁₂, alquilaminotiocarbonilo, dialquilaminocarbonilo C₂₋₁₂ (número total de carbonos) o dialquilaminotiocarbonilo C₂₋₁₂ (número total de carbonos).

88

N°	B ¹	B ²	B ³	A ²	A ³	G	(Z) _k
1 - 1	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-H	G1	H
1 - 2	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-H	G2	H
1 - 3	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-H	G3	H
1 - 4	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-H	G4	H
1 - 5	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-H	G5	H
1 - 6	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-H	G6	H
1 - 7	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-H	G7	H
1 - 8	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-H	G8	H
1 - 9	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-H	G9	H
1 - 10	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-F	G6	H
1 - 11	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-F	G8	H
1 - 12	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-F	G9	H
1 - 13	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-Cl	G6	H
1 - 14	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-Cl	G8	H
1 - 15	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-Cl	G9	H
1 - 16	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-Br	G1	H
1 - 17	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-Br	G2	H
1 - 18	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-Br	G3	H
1 - 19	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-Br	G4	H
1 - 20	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-Br	G5	H
1 - 21	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-Br	G6	H
1 - 22	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-Br	G7	H
1 - 23	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-Br	G8	H
1 - 24	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-Br	G9	H
1 - 25	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-I	G6	H
1 - 26	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-I	G8	H
1 - 27	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-I	G9	H
1 - 28	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-Me	G6	H
1 - 29	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-Me	G8	H
1 - 30	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-CF ₃	G6	H
1 - 31	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-CF ₃	G8	H
1 - 32	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-NO ₂	G6	H
1 - 33	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-NO ₂	G8	H
1 - 34	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-CN	G1	H
1 - 35	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-CN	G2	H
1 - 36	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-CN	G3	H
1 - 37	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-CN	G4	H
1 - 38	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-CN	G5	H

(continuación)

Nº	B ¹	B ²	B ³	A ²	A ³	G	(Z) _k
1 - 39	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-CN	G6	H
1 - 40	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-CN	G7	H
1 - 41	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-CN	G8	H
1 - 42	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-CN	G9	H
1 - 43	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-NO ₂	G6	H
1 - 44	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-NO ₂	G8	H
1 - 45	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-CH ₃	G6	H
1 - 46	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-OMe	G6	H
1 - 47	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-SOMe	G6	H
1 - 48	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-SO ₂ Me	G6	H
1 - 49	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-SCF ₃	G6	H
1 - 50	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-S(O)CF ₃	G6	H
1 - 51	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-S(O) ₂ CF ₃	G6	H
1 - 52	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-OCH ₃	G6	H
1 - 53	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-OCF ₃	G6	H
1 - 54	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-OH	G6	H
1 - 55	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-SH	G6	H
1 - 56	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-NH ₂	G6	H
1 - 57	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-NHCOCH ₃	G6	H
1 - 58	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-NHCO ₂ CH ₃	G6	H
1 - 59	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-NHCO ₂ -CH ₂ CCl ₃	G6	H
1 - 60	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-CN	G2	3-NO ₂
1 - 61	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-CN	G2	3-CN
1 - 62	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-CN	G6	S-NO ₂
1 - 63	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-CN	G6	3-CN
1 - 64	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-CN	G2	3-Cl
1 - 65	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-CN	G2	3-Br
1 - 66	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-CN	G2	3-CH ₃
1 - 67	C-Cl	C-H	C-Cl	C-H	C-CN	G2	3-CF ₃
1 - 68	C-Cl	C-H	C-H	C-H	C-CN	G6	H
1 - 69	C-Cl	C-H	C-H	C-H	C-CN	G8	H
1 - 70	3-CF ₃	C-H	C-H	C-H	C-CN	G6	H
1 - 71	3-CF ₃	C-H	C-H	C-H	C-CN	G8	H
1 - 72	3-CF ₃	C-H	C-CF ₃	C-H	C-CN	G6	H
1 - 73	3-CF ₃	C-H	C-CF ₃	C-H	C-CN	G8	H
1 - 74	C-NO ₂	C-H	C-H	C-H	C-CN	G6	H

(continuación)

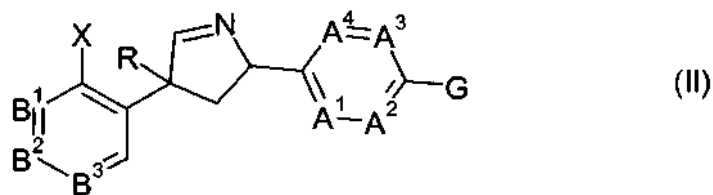
Nº	B ¹	B ²	B ³	A ²	A ³	G	(Z) _k
1 - 75	C-NO ₂	C-H	C-H	C-H	C-CN	G8	H
1 - 76	C-Cl	C-Cl	C-H	C-H	C-CN	G6	H
1 - 77	C-Cl	C-Cl	C-H	C-H	C-CN	G8	H
1 - 78	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H	C-CN	G6	H
1 - 79	C-Cl	C-Cl	C-Cl	C-H	C-CN	G8	H
1 - 80	C-CH ₃	C-H	C-H	C-H	C-CN	G6	H
1 - 81	C-OCH ₃	C-H	C-H	C-H	C-CN	G6	H
1 - 82	C-CN	C-H	C-H	C-H	C-CN	G6	H
1 - 83	C-OCF ₃	C-H	C-H	C-H	C-CN	G6	H
1 - 84	C-SCH ₃	C-H	C-H	C-H	C-CN	G6	H
1 - 85	C-S(O)CH ₃	C-H	C-H	C-H	C-CN	G6	H
1 - 86	C-S(O) ₂ CH ₃	C-H	C-H	C-H	C-CN	G6	H
1 - 87	C-SCF ₃	C-H	C-H	C-H	C-CN	G6	H
1 - 88	C-S(O)CF ₃	C-H	C-H	C-H	C-CN	G6	H
1 - 89	C-S(O) ₂ CF ₃	C-H	C-H	C-H	C-CN	G6	H
1 - 90	C-OH	C-H	C-H	C-H	C-CN	G6	H
1 - 91	C-SH	C-H	C-H	C-H	C-CN	G6	H
1 - 92	C-Cl	C-H	C-Cl	N	C-Br	G6	H
1 - 93	C-Cl	C-H	C-Cl	N	C-CN	G6	H
1 - 94	C-Br	C-H	C-Br	C-H	C-CN	G6	H
1 - 95	C-Cl	C-Cl	C-CF ₃	C-H	C-CN	G6	H
1 - 96	C-Cl	C-H	C-Cl	N	C-CN	G2	4-CN
1 - 97	C-Cl	C-H	C-Cl	N	C-CN	G2	4-NO ₂
1 - 98	C-Cl	C-H	C-Cl	N	C-CN	G2	4-Cl
1 - 99	C-Cl	C-H	C-Cl	N	C-CN	G8	5-CH ₃
1 - 100	C-Cl	C-H	C-Cl	N	C-CN	G9	5-CH ₃
1 - 101	C-Cl	C-H	C-Cl	N	C-CN	G2	3-CH ₃ , 5-NH ₂
1 - 102	C-Cl	C-H	C-Cl	N	C-CN	G2	3-CH ₃ , 5-NHCOCH ₃
1 - 103	C-CH ₃	C-NO ₂	C-CH ₃	C-H	C-CN	G6	H

3. Composición, que comprende al menos un compuesto de acuerdo con la Reivindicación 1 o 2 para el control de las plagas en animales.

5 4. Uso de al menos un compuesto de acuerdo con la Reivindicación 1 o 2 en la preparación de composiciones para el control de artrópodos.

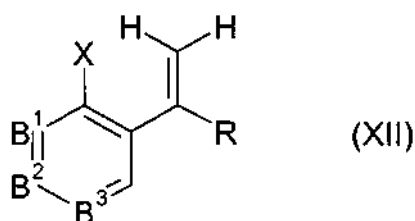
5. Uso de los compuestos de acuerdo con la Reivindicación 1 o 2 en el tratamiento de las semillas de plantas convencionales o transgénicas.

6. Los compuestos de la fórmula (II) útiles para la preparación de los compuestos de acuerdo con la reivindicación 1

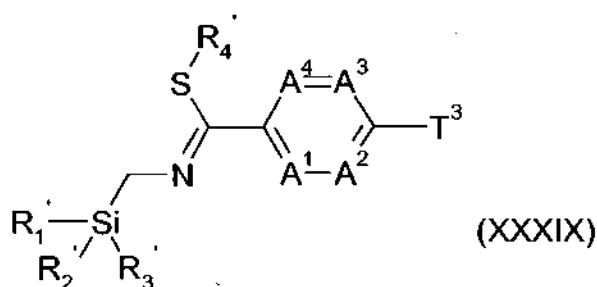


en la que A¹ a A⁴, B¹ a B³, X, R y G tienen los mismos significados definidos en la reivindicación 1.

5 7. Procedimiento de preparación de compuestos de acuerdo con la reivindicación 1, que comprende hacer reaccionar un compuesto (XII)



en la que B¹ a B³, X y R tienen los mismos significados definidos en la reivindicación 1, con un compuesto (XXXIX)

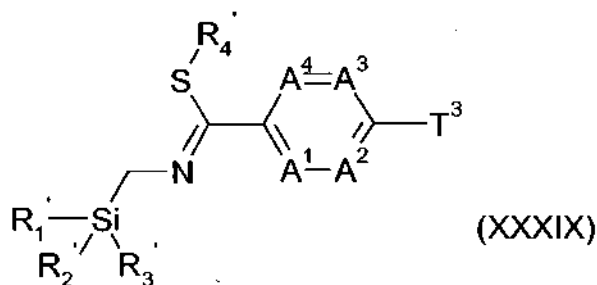


10

en la que T³ representa F, Cl, Br, I, el grupo químico G,
R₁', R₂' y R₃' representan cada uno independientemente alquilo C₁₋₆ opcionalmente sustituido o fenilo; y R₄' es
seleccionado de entre alquilo C₁₋₆ opcionalmente sustituido, alqueno C₂₋₆, alquino C₂₋₆; bencilo
opcionalmente sustituido, y R₅' representa hidrógeno, alquilo C₁₋₆ opcionalmente sustituido o fenilo
15 opcionalmente sustituido, y R₁', R₂', R₃', R₄', A¹ a A⁴ y G tienen los mismos significados definidos en la
reivindicación 1, en presencia de un reactivo de flúor.

15

8. Procedimiento de preparación de compuestos de acuerdo con la reivindicación 1, que comprende hacer reaccionar un compuesto (XII) definido en la reivindicación 7, con un compuesto (XXXIX)



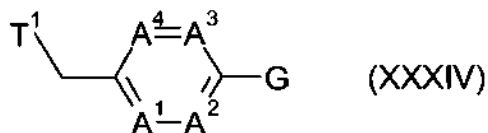
20

en la que T³ representa F, Cl, Br, I, el grupo químico G,
R₁', R₂' y R₃' representan cada uno independientemente alquilo C₁₋₆ opcionalmente sustituido o fenilo; y R₄'
representa hidrógeno, y R₅' representa hidrógeno, alquilo C₁₋₆ opcionalmente sustituido o fenilo
25 opcionalmente sustituido, y R₁', R₂', R₃', R₄', A¹ a A⁴ y G tienen los mismos significados definidos en la
reivindicación 1, en una reacción en un único recipiente mediante la adición en primer lugar de un haluro de

25

alquilo y añadiendo en segundo lugar un reactivo de flúor.

9. Procedimiento de preparación de compuestos de acuerdo con la reivindicación 1, que comprende hacer reaccionar un compuesto (XII) definido en la reivindicación 7 con un compuesto (XXXIV)



- 5 en la que T^1 representa $-NH-CH=O$ o $-N=C$; y A^1 a A^4 y G tienen los mismos significados definidos en la reivindicación 1, para dar un compuesto de fórmula (II) definido en la reivindicación 6, y hacer reaccionar adicionalmente el compuesto de fórmula (II) en presencia de una base metálica alcalina.