

OFICINA ESPAÑOLA DE PATENTES Y MARCAS

ESPAÑA



① Número de publicación: 2 533 798

(51) Int. CI.:

A01N 43/78 (2006.01) AO1N 43/56 (2006.01) A01N 43/82 (2006.01) A01N 43/647 (2006.01) A01N 43/88 (2006.01) A01N 43/653 (2006.01) A01N 55/08 (2006.01) A01N 43/707 (2006.01) C07D 213/84 (2006.01) **A01N 43/76** (2006.01) C07D 401/04 (2006.01) **CO7D 405/14** C07D 403/04 (2006.01) **CO7D 413/14** (2006.01) C07D 403/14 (2006.01) **CO7D 417/14** (2006.01) A01P 7/00 (2006.01)

A01P 5/00 (2006.01)

(12)

TRADUCCIÓN DE PATENTE EUROPEA

T3

- (96) Fecha de presentación y número de la solicitud europea: 07.10.2010 E 10766020 (1) (97) Fecha y número de publicación de la concesión europea: EP 2488030
- (54) Título: 1-(pirid-3-il)-pirazol y 1-(pirimid-5-il)- pirazol como agentes para combatir parásitos
- (30) Prioridad:

12.10.2009 EP 09172737 13.10.2009 US 251058 P

(45) Fecha de publicación y mención en BOPI de la traducción de la patente: 14.04.2015

(73) Titular/es:

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

(72) Inventor/es:

BRETSCHNEIDER, THOMAS; FÜSSLEIN, MARTIN; KÖHLER, ADELINE; MÜHLTHAU, FRIEDRICH, AUGUST; FRANKEN, EVA-MARIA y **VOERST, ARND**

(74) Agente/Representante:

CARPINTERO LÓPEZ, Mario

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

1-(pirid-3-il)-pirazol y 1-(pirimid-5-il)- pirazol como agentes para combatir parásitos

La presente solicitud se refiere al uso de compuestos heterocíclicos en parte conocidos para combatir parásitos animales, entre los que se cuentan los artrópodos y en especial insectos, además a nuevos compuestos heterocíclicos y a procedimientos para su preparación.

Ya se han dado a conocer determinados compuestos de pirazolilo, pero no se ha descrito un uso para combatir parásitos animales (comp. documento WO 2003/051833 A2, documento WO 2006/044502 A2).

También en los documentos WO 1998/056785 A1 y WO 1996/032938 A1 se divulgan derivados de pirazol, para los que se indican usos farmacéuticos.

Los modernos agentes fitosanitarios deben satisfacer muchos requerimientos, por ejemplo, respecto de la intensidad, la duración y la amplitud de su acción y su posible uso. Juegan un papel importante la toxicidad, la capacidad de combinación con otros principios activos o agentes de formulación, así como la cuestión del gasto que se debe hacer para la síntesis de un principio activo. Además, pueden presentarse resistencias. Por todos estos motivos, la búsqueda de nuevos agentes fitosanitarios puede considerarse no concluida, y sigue existiendo una continua necesidad de nuevos compuestos con propiedades mejoradas respecto de los compuestos conocidos, al menos en lo que respecta a aspectos individuales.

Era objetivo de la presente invención proporcionar compuestos que ampliaran el espectro de los agentes para combatir parásitos en distintos aspectos.

El objetivo se consigue, así como otros objetivos no mencionados explícitamente, que se pueden derivar o concluir 20 de las relaciones aquí tratadas, por medio de compuestos en parte nuevos de la fórmula (I),

$$G^{1}$$
 N
 R^{1}
 G^{2}
 G^{2}
 G^{1}
 G^{2}

en la que

30

5

- G¹ representa N, CH o C-halógeno,
- R¹ representa hidrógeno o alquilo y
- 25 G² representa heterociclilo dado al caso sustituido, representa heteroarilo dado al caso sustituido o representa arilo dado al caso sustituido,

así como sales, complejos metálicos y N-óxidos de los compuestos de la fórmula (I), que se pueden usar para combatir parásitos animales.

Se halló que los compuestos de la fórmula (I) poseen propiedades biológicas muy marcadas y, sobre todo, son apropiados para combatir parásitos animales, en especial insectos, arácnidos y nematodos, que se presentan en la agricultura, en silvicultura, en la protección de existencias y materiales, así como en el sector de higiene.

Los compuestos conocidos de la fórmula (I) se pueden obtener de acuerdo con los procedimientos de preparación que se describen en las publicaciones antes mencionadas.

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

Los sustituyentes o series preferentes de los restos enumerados en los compuestos de la fórmula (I) mencionados con anterioridad se enumeran a continuación.

Se usan preferentemente los compuestos de la fórmula (I), en la que

- G¹ representa N, CH o C-halógeno,
- R¹ representa hidrógeno o alquilo,
- 40 G² representa A- R²_a, D- R³_b o E- R⁴_c, en la que

- representa heterociclilo de la serie de 2-tetrahidrofuranilo, 3-tetrahidrofuranilo, 2-tetrahidrotienilo, 3-Α 2-pirrolidinilo, 3-pirrolidinilo, 3-isoxazolidinilo, 4-isoxazolidinilo, 5-isoxazolidinilo, isotiazolidinilo, 4-isotiazolidinilo, 5-isotiazolidinilo, 3-pirazolidinilo, 4-pirazolidinilo, 5-pirazolidinilo, oxazolin-2-ilo, 2-oxazolidinilo, 4-oxazolidinilo, 5-oxazolidinilo, 2-tiazolidinilo, 4-tiazolidinilo, 5-tiazolidinilo, 2-imidazolidinilo, 4imidazolidinilo, 5,6-dihidro-[1,3,4]-oxadiazin-2-ilo, 5,6-dihidro-[1,3,4]-tiadiazin-2-ilo, 5,6-dihidro-[1,4,2]-dioxazin-1,2,4-oxadiazolidin-3-ilo, 1,2,4-oxadiazolidin-5-ilo, 1,2,4-tiadiazolidin-3-ilo, 3-ilo, hidroxipiridilo, tiadiazolidin-5-ilo, 1,2,4-triazolidin-3-ilo, 1,3,4-oxadiazolidin-2-ilo, 1,3,4-tiadiazolidin-2-ilo, 1,3,4-triazolidin-2-ilo, 2,3-dihidrofur-2-ilo, 2,3-dihidrofur-3-ilo, 2,4-dihidrofur-2-ilo, 2,3-dihidrotien-2-ilo, 2,3-dihidrotien-3-ilo, 2,4dihidrotien-2-ilo, 2-pirrolin-2-ilo, 2-pirrolin-3-ilo, 3-pirrolin-2-ilo, 3-pirrolin-3-ilo, 2-isoxazolin-3-ilo, 3-isoxazolin-3-ilo, 3-isoxazolin-3-ilo ilo, 4-isoxazolin-3-ilo, 2-isoxazolin-4-ilo, 3-isoxazolin-4-ilo, 4-isoxazolin-4-ilo, 2-isoxazolin-5-ilo, 3-isoxazolin-5ilo, 4-isoxazolin-5-ilo, 2-isotiazolin-3-ilo, 3-isotiazolin-3-ilo, 4-isotiazolin-3-ilo, 2-isotiazolin-4-ilo, 3-isotiazolin-4ilo, 4-isotiazolin-4-ilo, 2-isotiazolin-5-ilo, 3-isotiazolin-5-ilo, 4-isotiazolin-5-ilo, 2,3-dihidropirazol-1-ilo, 2,3dihidropirazol-2-ilo, 2,3-dihidropirazol-3-ilo, 2,3-dihidropirazol-4-ilo, 2,3-dihidropirazol-5-ilo, 3,4-dihidropirazol-1-ilo. 3.4-dihidropirazol-3-ilo. 3.4-dihidropirazol-4-ilo. 3.4-dihidropirazol-5-ilo. 4.5-dihidropirazol-1-ilo. 4.5dihidropirazol-3-ilo, 4,5-dihidropirazol-4-ilo, 4,5-dihidropirazol-5-ilo, 2,3-dihidrooxazol-2-ilo, 2,3-dihidrooxazol-3-ilo, 2,3-dihidrooxazol-4-ilo, 2,3-dihidrooxazol-5-ilo, 3,4-dihidrooxazol-2-ilo, 3,4-dihidrooxazol-3-ilo, 3,4dihidrooxazol-4-ilo, 3,4-dihidrooxazol-5-ilo, 2-piperidinilo, 3-piperidinilo, 4-piperidinilo, 1,3-dioxan-5-ilo, 2-tetrahidropiranilo, 4-tetrahidropiranilo, 2-tetrahidrotienilo, 3-hexahidropiridazinilo, 4-hexahidropiridazinilo, 2hexahidropirimidinilo, 4-hexahidropirimidinilo, 5-hexahidropirimidinilo, 2-piperazinilo, 1,3,5-hexahidro-triazin-2ilo y 1,2,4-hexahidrotriazin-3-ilo,
 - R² representa un resto de la serie de halógeno, ciano, nitro, alquilo, haloalquilo, cicloalquilo, alcoxi, haloalcoxi, alquiltio, haloalquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfinilo, haloalquilsulfinilo, haloalquilsulfinilo, amino, alquilamino, dialquilamino, alquilcarbonilamino, alcoxicarbonilamino, alcoxialquilo, haloalcoxialquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilalquilo, alquilcarbonilo, alcoxicarbonilo, aminocarbonilo, piridilo y pirimidilo (en la que piridilo y pirimidilo, a su vez, también pueden estar sustituidos con halógeno, alquilo, haloalquilo, alcoxi y haloalcoxi),
 - a representa un número de la serie de 0, 1, 2 y 3,

5

10

15

20

25

30

35

40

45

50

55

- D representa un resto heteroarilo de la serie de pirrolilo, pirazolilo, imidazolilo, 1,2,3-triazolilo, 1,2,4-triazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, 1,2,3-oxadiazolilo, 1,2,4-oxadiazolilo, 1,3,4-oxadiazolilo, 1,2,5oxadiazolilo, 1,2,3-tiadiazolilo, 1,2,4-tiadiazolilo, 1,3,4-tiadiazolilo, 1,2,5-tiadiazolilo, piridilo, pirimidinilo, piridazinilo, pirazinilo, 1,2,3-triazinilo, 1,2,4-triazinilo, 1,3,5-triazinilo, benzofurilo, benzoisofurilo, benzotienilo, isoindolilo, benzoisotienilo. indolilo, indazolilo, benzotiazolilo, benzoisotiazolilo, benzoxazolilo. benzoisoxazolilo, bencimidazolilo, 2,1,3-benzoxadiazolilo, quinolinilo, isoquinolinilo, cinolinilo, ftalazinilo, quinazolinilo, quinoxalinilo, naftiridinilo, benzotriazinilo, purinilo, pteridinilo e indolizinilo (en especial pirid-2-ilo, pirid-3-ilo, pirimid-2-ilo, pirimid-4-ilo, imidazolilo, pirazol-1-ilo, pirazol-3-il pirazinilo, 1,2,3-triazinilo, 1,2,4triazinilo, 1,3,5-triazinilo, tiazol-2-ilo, tiazol-4-ilo, 1,2,4-tiadiazolilo, 1,3,4-tiadiazolilo, 1,2,5-tiadiazolilo, 1,2,3oxadiazolilo, 1,2,4-oxadiazolilo, 1,3,4-oxadiazolilo, 1,2,5-oxadiazolilo y oxazolilo),
- R^3 representa un resto de la serie de halógeno, nitro, amino, ciano, alguilamino, haloalguilamino, dialguilamino, haloalquilo, cicloalquilalquilo, alcoxi, haloalcoxi, alcoxialquilo, alcoxialquilo halogenado, alguilo. alcoxicarbonilalquilo, alfa-hidroxiimino-alcoxicarbonilalquilo, bis(alcoxi)alquilo, alcoxicarbonilo. alcoxiimino-alcoxicarbonilalquilo, C(X)NR⁵R⁶ (en la que X representa oxígeno, azufre o NOH, R⁵ representa hidrógeno o alquilo y R⁶ representa un resto de la serie de hidrógeno, alquilo, haloalquilo, cianoalquilo, alquinilo, cicloalquilo, cicloalquilalquilo, alcoxialquilo, alcoxicarbonilo, alcoxicarbonilalquilo, alquiltioalquilo, arilo, arilalquilo y hetarilalquilo o R^5 y R^6 junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos forman un anillo, que puede contener uno o varios otros heteroátomos de la serie de nitrógeno, oxígeno y azufre), NR⁷R⁸ (en la que R⁷ representa hidrógeno o alquilo y R⁸ representa un resto de la serie de hidrógeno, alquilo, haloalquilo, cianoalquilo, alquinilo, cicloalquilo, cicloalquilalquilo, alcoxi, haloalcoxi, alcoxialquilo, alcoxicarbonilo, alcoxicarbonilalquilo, alquiltioalquilo, arilo, arilalquilo o hetarilalquilo o R⁷ y R⁸ junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos forman un anillo, que puede contener uno o varios otros heteroátomos de la serie de nitrógeno, oxígeno y azufre), alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, los restos de heterociclilo dioxanilo, dioxolanilo, morfolinilo, triazolinonilo, oxazolinilo, dihidrooxadiazinilo, dihidrodioxazinil y pirazolinonilo (que, a su vez, también pueden estar sustituidos con alquilo, haloalquilo, alcoxi y alcoxialquilo), fenilo (que, a su vez, puede estar sustituido con halógeno, ciano, nitro, alquilo y haloalquilo), los restos heteroarilo piridilo, N-óxido de piridilo, pirimidilo, imidazolilo, pirazolilo, oxazolilo, tiazolilo, furanilo, tienilo, triazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, pirazinilo, triazinilo, tetrazinilo e isoquinolinilo (que, a su vez, pueden estar sustituidos con halógeno, nitro, alquilo, haloalquilo, alcoxi, haloalcoxi, alcoxialquilo, alquiltio, alquiltioalquilo y cicloalquilo) y los restos de heteroarilalquilo triazolilalquilo, piridilalquilo, pirimidilalquilo y oxadiazolilalquilo (que, a su vez, pueden estar sustituidos con halógeno y alguilo).
- b representa un número de la serie de 0, 1, 2 y 3,
- E representa arilo, en especial fenilo,

- R⁴ representa un resto de la serie de halógeno, ciano, alquilo, haloalquilo, alcoxi, haloalcoxi, dioxolanilo o dihidrodioxazinilo y
- c representa un número de la serie de 0, 1, 2 y 3.

Se usan con preferencia especial compuestos de la fórmula (I), en la que

- 5 G¹ representa N, CH o C-halógeno,
 - R¹ representa hidrógeno o alquilo C₁-C₆ y
 - G^2 representa A- R_a^2 , D- R_b^3 o E- R_c^4 , en la que
 - A representa heterociclilo de la serie de oxazolin-2-ilo, 5,6-dihidro-[1,3,4]-oxadiazin-2-ilo, 5,6-dihidro-[1,3,4]-tiadiazin-2-ilo, 5,6-dihidro-[1,4,2]-dioxazin-3-ilo e hidroxipiridilo,
- representa un resto de la serie de halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alquil C₁-C₆-tio, haloalquil C₁-C₆-tio, alquil C₁-C₆-sulfinilo, haloalquil C₁-C₆-sulfonilo, haloalquil C₁-C₆-sulfonilo, amino, alquil C₁-C₆-amino, di-(alquil C₁-C₆)amino, alquil C₁-C₆-carbonilamino, alcoxi C₁-C₆-carbonilamino, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, alquenilo C₂-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₆, alquil C₁-C₆-carbonilo, aminocarbonilo, piridilo y pirimidilo (en la que piridilo y pirimidilo, a su vez, también pueden estar sustituidos con halógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆ y haloalcoxi C₁-C₆),
 - a representa un número de la serie de 0, 1, 2 y 3,
- D representa un resto heteroarilo de la serie de pirrolilo, pirazolilo, imidazolilo, 1,2,3-triazolilo, 1,2,4-triazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, 1,2,3-oxadiazolilo, 1,2,4-oxadiazolilo, 1,3,4-oxadiazolilo, 1,2,5oxadiazolilo, 1,2,3-tiadiazolilo, 1,2,4-tiadiazolilo, 1,3,4-tiadiazolilo, 1,2,5-tiadiazolilo, piridilo, pirimidinilo, 20 piridazinilo, pirazinilo, 1,2,3-triazinilo, 1,2,4-triazinilo, 1,3,5-triazinilo, benzofurilo, benzoisofurilo, benzotienilo, indolilo. isoindolilo, indazolilo, benzotiazolilo, benzoisotiazolilo, benzoisotienilo. benzoisoxazolilo, bencimidazolilo, 2,1,3-benzoxadiazolilo, quinolinilo, isoquinolinilo, cinolinilo, ftalazinilo, quinazolinilo, quinoxalinilo, naftiridinilo, benzotriazinilo, purinilo, pteridinilo e indolizinilo (en especial pirid-2-ilo, pirid-3-ilo, pirimid-2-ilo, pirimid-4-ilo, imidazolilo, pirazol-1-ilo, pirazol-3-il pirazinilo, 1,2,3-triazinilo, 1,2,4-25 triazinilo, 1,3,5-triazinilo, tiazol-2-ilo, tiazol-4-il 1,2,4-tiadiazolilo, 1,3,4-tiadiazolilo, 1,2,5-tiadiazolilo, 1,2,3oxadiazolilo, 1,2,4-oxadiazolilo, 1,3,4-oxadiazolilo, 1,2,5-oxadiazolilo y oxazolilo),
- R^3 representa un resto de la serie de halógeno, nitro, amino, ciano, alquil C₁-C₆-amino, haloalquil C₁-C₆-amino, di-(alquil C_1 - C_6)amino, alquilo C_1 - C_6 , haloalquilo C_1 - C_6 , cicloalquilo C_3 - C_6 -alquilo C_1 - C_6 , alcoxi C_1 - C_6 , haloalcoxi C_1 - C_6 , alcoxi C_1 - C_6 -alquilo C_1 - C_6 halogenado, bis(alcoxi C_1 - C_6)-alquilo 30 C_1 - C_6 , alcoxi C_1 - C_6 -carbonilo, alfa-hidroxiimino-alcoxi C_1 - C_6 -carbonilmetilo, alfa-alcoxi C_1 - C_6 -imino-alcoxi C_1 - C_6 -carbonilmetilo, $C(X)NR^5R^6$, (en la que X representa oxígeno, azufre o NOH, R^5 representa hidrógeno o alquilo C_1 - C_6 y R^6 representa un resto de la serie de hidrógeno, alquilo C_1 - C_6 , haloalquilo C_1 - C_6 , ciano-alquilo C₁-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆ C_6 -carbonilo, alcoxi C_1 - C_6 -carbonil-alquilo C_1 - C_6 , alquil C_1 - C_6 -tio-alquilo C_1 - C_6 , fenilo, fenil-alquilo C_1 - C_6 o 35 hetaril-alquilo C₁-C₆, en la que hetarilo representa pirimidilo o R⁵ y R⁶ forman junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos un anillo de 5 a 7 miembros, que puede contener otro heteroátomo de la serie de nitrógeno, oxígeno y azufre), NR^7R^8 (en la que R^7 representa hidrógeno o alquilo C_1 - C_6 y R^8 representa un resto de la serie de hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, ciano-alquilo C₁-C₆, alquinilo C₂-C₆, 40 cicloalguilo C₃-C₆, cicloalguil C₃-C₆-alguilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-alguilo C₁-C₆, alcoxi C_1 - C_6 -carbonilo, alcoxi C_1 - C_6 -carbonil-alquilo C_1 - C_6 , alquil C_1 - C_6 -tio-alquilo C_1 - C_6 , fenilo, fenil-alquilo C₁-C₆ y hetaril-alquilo C₁-C₆, en la que hetarilo representa pirimidilo o R⁷ y R⁸ forman junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos un anillo de 5 a 7 miembros, que puede contener otro heteroátomo de la serie de nitrógeno, oxígeno y azufre), alquil C₁-C₆-tio, alquil C₁-C₆-sulfinilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, los restos de 45 heterociclilo dioxanilo, dioxolanilo, morfolinilo, triazolinonilo, oxazolinilo, dihidrooxadiazinilo, dihidrodioxazinilo y pirazolinonilo (en especial 3-dioxolan-2-ilo, 1,3-dioxan-2-ilo y 1,2,4-triazolin-3-on-2-ilo) (que, a su vez, también pueden estar sustituidos con alquilo C_1 - C_6 , haloalquilo C_1 - C_6 , alcoxi C_1 - C_6 y alcoxi C_1 - C_6 -alquilo C_1 -C₆), fenilo (que, a su vez, puede estar sustituido con halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₆ y haloalquilo C₁-C₆), los restos heteroarilo piridilo, N-óxido de piridilo, pirimidilo, imidazolilo, pirazolilo, oxazolilo, tiazolilo, furanilo, tienilo, triazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, pirazinilo, triazinilo, tetrazinilo e isoquinolinilo (en especial pirid-2-ilo, 50 pirimid-2-ilo, pirimid-4-ilo, pirazol-1-ilo, pirazol-2-ilo, 1,2,4-oxadiazol-3-ilo, 1,2,4-triazol-3-ilo y 1,2,4-triazin-3-ilo) (que, a su vez, pueden estar sustituidos con halógeno, nitro, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C_1 - C_6 , alcoxi C_1 - C_6 -alquilo C_1 - C_6 , alquil C_1 - C_6 -tio, alquil C_1 - C_6 -tio-alquilo C_1 - C_6 y cicloalquilo C_3 - C_6) y los restos de heteroarilalquilo triazolil-alquilo C₁-C₆, piridil-alquilo C₁-C₆, pirimidil-alquilo C₁-C₆ y oxadiazolil-55 alquilo C₁-C₆ (que, a su vez, pueden estar sustituidos con halógeno y alquilo C₁-C₆),

- b representa un número de la serie de 0, 1, 2 y 3,
- E representa fenilo,

15

- R^4 representa un resto de la serie de halógeno, ciano, alquil C_1 - C_6 , haloalquil C_1 - C_6 , alcoxi C_1 - C_6 , haloalquilo C_1 - C_6 , dioxolanilo y dihidrooxadiazinilo y
- 5 c representa un número de la serie de 0, 1, 2 y 3.

Se usan, con preferencia muy especial, los compuestos de la fórmula (I), en la que

- G¹ representa N, CH o C-halógeno,
- R¹ representa hidrógeno o metilo (en especial hidrógeno) y
- G^2 representa A- R_a^2 , D- R_b^3 o E- R_c^4 , en la que
- A representa heterociclilo de la serie de oxazolin-2-ilo, 5,6-dihidro-[1,3,4]-oxadiazin-2-ilo, 5,6-dihidro-[1,3,4]-tiadiazin-2-ilo y 5,6-dihidro-[1,4,2]-dioxazin-3-ilo,
 - R² representa un resto de la serie de halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄-tio, haloalquil C₁-C₄-tio, alquil C₁-C₄-sulfinilo, alquil C₁-C₄-sulfinilo, haloalquil C₁-C₄-sulfonilo, maino, alquil C₁-C₄-amino, di-(alquil C₁-C₄)amino, alquil C₁-C₄-carbonilamino, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, alquinilo C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, alquilo C₁-C₄, alquil C₁-C₄-carbonilo, accoxi C₁-C₄-carbonilo, aminocarbonilo, piridilo y pirimidilo (en la que piridilo y pirimidilo, a su vez, también pueden estar sustituidos con halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄),
 - a representa un número de la serie de 0, 1, 2 y 3,
- D representa un resto heteroarilo de la serie de pirid-2-ilo, pirid-3-ilo, pirimid-2-ilo, pirimid-4-ilo, imidazolilo, pirazol-1-ilo, pirazol-3-il pirazinilo, 1,2,3-triazinilo, 1,2,4-triazinilo, 1,3,5-triazinilo, tiazol-2-ilo, tiazol-4-ilo, 1,2,4-tiadiazolilo, 1,3,4-tiadiazolilo, 1,2,5-tiadiazolilo, 1,2,3-oxadiazolilo, 1,2,4-oxadiazolilo, 1,3,4-oxadiazolilo, 1,2,5-oxadiazolilo y oxazolilo (en especial pirazol-1-ilo, pirazol-3-ilo, pirid-2-ilo, pirid-3-ilo, pirimid-2-ilo, pirimid-4-ilo, tiazol-2-ilo y tiazol-4-ilo),
- R^3 25 representa un resto de la serie de halógeno, nitro, amino, ciano, alquil C₁-C₄-amino, haloalquil C₁-C₄-amino, di-(alquil C₁-C₄)amino, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄ halogenado, bis(alcoxi C₁-C₄)-alquilo C₁-C₄, alcoxi C_1 - C_4 -carbonilo, alfa-hidroxiimino-alcoxi C_1 - C_4 -carbonilmetilo, alfa-alcoxi C_1 - C_4 -imino-alcoxi C_1 - C_4 -carbonilmetilo, $C(X)NR^5R^6$, (en la que X representa oxígeno o azufre, R^5 representa hidrógeno o alquilo C_1 - C_4 -carbonilmetilo, $C(X)NR^5R^6$, (en la que X representa oxígeno o azufre, R^5 representa hidrógeno o alquilo R^5 - R^6) y R⁶ representa un resto de la serie de hidrógeno, alquilo C₁-C₅, haloalquilo C₁-C₄, ciano-alquilo C₁-C₄, 30 alquinilo C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, alquil C₁-C₄-tioalquilo C₁-C₄ y fenil-alquilo C₁-C₄ o R⁵ y R⁶ junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos forman un anillo de 5 o 6 miembros, que puede contener otro heteroátomo de la serie de oxígeno, azufre y nitrógeno), NR⁷R⁸ (en la que R⁷ representa hidrógeno o alquilo C₁-C₄ y R⁸ representa un resto de la serie de hidrógeno, alquilo C₁-C₅, haloalquilo C₁-C₄, ciano-alquilo C₁-C₄, alquinilo C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalquil C₃-C₆-35 alquilo C_1 - C_4 , alcoxi C_1 - C_4 , haloalcoxi C_1 - C_4 , alcoxi C_1 - C_4 -carbonilo, alcoxi C_1 - C_4 -carbonil-alquilo C_1 - C_4 , alquilo $C_$ la serie de oxígeno, azufre y nitrógeno), alquil C₁-C₄-tio, alquil C₁-C₄-sulfinilo, alquil C₁-C₄-sulfonilo, los restos 40 dioxanilo, dioxolanilo, morfolinilo, triazolinonilo, oxazolinilo, dihidrodioxazinilo y pirazolinonilo (en especial, 1,3-dioxolan-2-ilo, 1,3-dioxan-2-ilo y 1,2,4-triazolin-3-on-2-ilo) (que, a su vez, pueden estar sustituidos con alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄ y alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄), fenilo (que, a su vez, puede estar sustituido con halógeno, ciano, nitro, alquilo C_1 - C_4 y haloalquilo C_1 - C_4), los restos heteroarilo piridilo, N-óxido de piridilo, pirimidilo, imidazolilo, pirazolilo, oxazolilo, tiazolilo, furanilo, 45 tienilo, triazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, pirazinilo, triazinilo, tetrazinilo e isoquinolinilo (en especial pirid-2-ilo, pirimid-2-ilo, pirimid-4-ilo, pirazol-1-ilo, pirazol-2-ilo, 1,2,4-oxadiazol-3-ilo, 1,2,4-triazol-3-ilo y 1,2,4-triazin-3-ilo) (que, a su vez, pueden estar sustituidos con halógeno, nitro, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, alquil C

 1-C₄-tio, alquil C

 1-C₄-tio-alquilo C

 1-C₄ y cicloalquilo C

 1-C₆) y los restos de heteroarilalquilo triazolil-alquilo C₁-C₄, piridil-alquilo C₁-C₄, pirimidil-alquilo C₁-C₄ u oxadiazolil-50 alquilo C₁-C₄ (que, a su vez, pueden estar sustituidos con halógeno y alquilo C₁-C₄),
 - b representa un número de la serie de 1 y 2,
 - E representa fenilo y

- R^4 representa un resto de la serie de halógeno, ciano, alquilo C_1 - C_4 , haloalquilo C_1 - C_4 , alcoxi C_1 - C_4 y haloalcoxi C_1 - C_4 y
- c representa un número de la serie de 0, 1, y 2.

Se usan, con preferencia especialmente destacada los compuestos de la fórmula (I), en la que

- 5 G¹ representa N, CH o C-halógeno (en el caso de C-halógeno en especial representa C-F),
 - R¹ representa hidrógeno o metilo (en especial representa hidrógeno),
 - G² representa A- R²_a O- R³_b, en la que
 - A representa heterociclilo de la serie de oxazolin-2-ilo, 5,6-dihidro-[1,3,4]-oxadiazin-2-ilo y 5,6-dihidro-[1,3,4]-tiadiazin-2-ilo,
- 10 R² representa un resto de la serie de piridilo y pirimidin-2-ilo, que pueden estar sustituidos con halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄,
 - a representa 0, 1 o 2 y en especial representa 1,
 - D representa un resto heteroarilo de la serie de pirazol-1-ilo, pirazol-3-ilo, pirid-2-ilo, pirid-3-ilo, pirimid-2-ilo, pirimid-4-ilo, tiazol-2-ilo y tiazol-4-ilo,
- R^3 15 representa un resto de la serie de halógeno (en especial cloro, bromo), nitro, amino, ciano, haloalquilo C1-C4 $(en\ especial\ CF_3,\ CF_3CH_2,\ CH_3CF_2,\ CF_3CF_2,\ CF_3CF_2CF_2,\ CH_3CHF),\ cicloalquil\ C_3-C_6-alquilo\ C_1-C_4\ (en\ especial\ CF_3,\ CF_3CF_2,\ CF_3CF_2,\$ especial ciclopropilmetilo), alcoxi C₁-C₄ (en especial metoxi), haloalcoxi C₁-C₄ (en especial CF₃CH₂O), alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄ (en especial metoximetilo), alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄ halogenado (en especial CF₂CH₂OCH₃), bis(alcoxi C₁-C₄)-alquilo C₁-C₄ (en especial (CH₃O)₂CH), alcoxi C₁-C₄-carbonilo (en especial metoxicarbonilo), alfa-hidroxiimino-alcoxi C_1 - C_4 -carbonilmetilo, $C(X)NR^5R^6$, (en la que X representa oxígeno o azufre, R^5 representa hidrógeno o alquilo C_1 - C_4 (en especial metilo) y R^6 representa un resto de la serie de 20 alquilo C₁-C₅ (en especial metilo, etilo, n-propilo, i-propilo, iso-butilo, terc.-butilo), haloalquilo C₁-C₄ (en especial CF_3CH_2), ciano-alquilo C_1 - C_4 (en especial $NCCH_2CH(C_2H_5)$), cicloalquilo C_3 - C_6 (en especial ciclopropilo, ciclopentilo, ciclohexilo), cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₄ (en especial ciclopropilmetilo), alcoxi C₁-C₁-C₄ (en especial CH₃OCH₂CH(CH₃), CH₃CH₂CH₂OCH₂CH(CH₃), 25 CH₃CH₂OCH₂CH₂, CH₃OCH₂CH₂CH₂, CH₃OCH₂CHC₂H₅, CH₃CH₂OCH₂CH(CH₃), CH₃CH₂OCH₂CH₂CH₂CH₂, CH₃OC(CH₃)₂), alquil C₁-C₄-tio-alquilo C₁-C₄ (en especial CH₃SCH₂CH₂) y fenil-alquilo C₁-C₄ (en especial C₆H₅CH(CH₃) o R⁵ y R⁶ junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos forman un anillo de 5 o 6 miembros, que puede contener otro heteroátomo de la serie de oxígeno, azufre y nitrógeno (en especial R⁵ y R⁶ representan juntos (CH₂)₄, CH₂)₅ o (CH₂)₂O(CH₂)₂), NR⁷R⁸ (en la que R⁷ representa hidrógeno o metilo y R⁸ representa un resto de la serie de hidrógeno, alquilo C₁-C₄ (en especial metilo y etilo), haloalquilo C₁-C₄ (en especial CH₂CF₃ y CH₂CF₂H), alcoxi C₁-C₄ (en especial OCH₃), alquil C₁-C₄-carbonilo (en especial COCH₃), alcoxi C₁-C₄-carbonilo (en espec 30 carbonilo (en especial CO₂CH₃, CO₂CH₂CH₃ y CO₂C(CH₃)₃,) y alcoxi C₁-C₄-carbonil-alquilo C₁-C₄ (en especial CH₂CO₂CH₃) o R⁷ y R⁸ junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos forman un anillo de 5 o 6 35 miembros, que puede contener un átomo de oxígeno, en especial R7 y R8 representan juntos (CH₂)₄, (CH₂)₅ o (CH₂)₂O(CH₂)₂), alquil C₁-C₄-tio (en especial metiltio), alquil C₁-C₄-sulfonilo (en especial CH₃SO₂), los restos de heterociclilo dioxanilo, dioxolanilo, morfolinilo, triazolinonilo, oxazolinilo, 5,6-dihidro-[1,3,4]-oxadiazin-2-ilo, 5,6-dihidro-[1,4,2]-dioxazin-3-ilo y pirazolinonilo (en especial, 1,3-dioxolan-2-ilo, 1,3-dioxan-2-ilo y 1,2,4triazolin-3-on-2-ilo) (que, a su vez, pueden estar sustituidos con alquilo C₁-C₄ (en especial metilo), haloalquilo 40 C₁-C₄ (en especial CF₃) y alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄ (en especial metoximetilo)), fenilo (que, a su vez, puede estar sustituido con halógeno (en especial flúor, cloro), los restos heteroarilo piridilo, N-óxido de piridilo, pirimidinilo, pirazolilo, tiazolilo, furanilo, tienilo, triazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, pirazinilo, triazinilo, e isoquinolinilo (en especial pirid-2-ilo, pirimid-2-ilo, pirimid-4-ilo, pirazol-1-ilo, pirazol-2-ilo, 1,2,4-oxadiazol-3-ilo, 1,2,4-triazol-3-ilo y 1,2,4-triazin-3-ilo) (que, a su vez, pueden estar sustituidos con halógeno (en especial flúor 45 y cloro), nitro, alquilo C₁-C₄ (en especial metilo, etilo, n-propilo, i-propilo y terc.-butilo), haloalquilo C₁-C₄ (en especial CF₃, CHF₂ y CFCIH), alcoxi C₁-C₄ (en especial metoxi, etoxi) y cicloalquilo C₃-C₆ (en especial ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo)), los restos de heteroarilalquilo triazolil-alquilo C₁-C₄ (en especial triazolilmetilo), piridil-alquilo C_1 - C_4 (en especial piridilmetilo), pirimidinil-alquilo C_1 - C_4 (en especial pirimidinilmetilo) u oxadiazolil-alquilo C_1 - C_4 (en especial oxadiazolilmetilo (que, a su vez, pueden estar 50 sustituidos con alquilo C₁-C₄ (en especial metilo)) y
 - b representa 1 o 2 y en especial representa 1.

55

Los restos sustituidos con halógeno (también abreviado "halo"), por ejemplo, haloalquilo (haloalquilo), están mono- o polihalogenados hasta el número máximo posible de sustituyentes. En términos como "haloalcoxialquilo", los átomos de halógeno se pueden hallar en la parte alcoxi y alquilo del resto, siempre que no se advierta expresamente otra cosa. En el caso de una polihaloación, los átomos de halógeno pueden ser iguales o diferentes. El halógeno

representa, en este caso, flúor, cloro, bromo y yodo, en especial flúor, cloro y bromo, destacadamente flúor y cloro.

El resto "pirimidilo" también se denomina "pirimidinilo".

Se usan preferentemente, con preferencia especial, con preferencia muy especial y con preferencia especialmente destacada los compuestos que llevan sustituyentes mencionados como preferentes, con preferencia especial, con preferencia muy especial y con preferencia especialmente destacada.

Los restos de hidrocarburos saturados o insaturados como alquilo o alquenilo también en el compuesto con heteroátomos como, por ejemplo, en alcoxi, siempre que sea posible, pueden ser de cadena lineal o ramificada.

Los restos dado al caso sustituidos pueden estar mono- o polisustituidos, en donde en el caso de sustituciones múltiples, los sustituyentes pueden ser iguales o diferentes.

Las definiciones de los restos o explicaciones enumeradas como generales o en márgenes de preferencia rigen para los productos finales y para los productos de partida y productos intermedios. Estas definiciones de restos se pueden combinar de cualquier manera entre sí, incluso entre cada uno de los márgenes preferentes.

Se usan preferentemente según la invención los compuestos de la fórmula (I), en los que hay una combinación de los significados enumerados con anterioridad como preferentes.

15 Se usan con preferencia especial según la invención los compuestos de la fórmula (I) en los que hay una combinación de los significados enumerados con anterioridad como con preferencia especial.

Se usan con preferencia muy especial según la invención los compuestos de la fórmula (I) en los que hay una combinación de los significados enumerados con anterioridad como con preferencia muy especial.

Se usan con preferencia especialmente destacada los compuestos de la fórmula (I) en los que hay una combinación de los significados enumerados con anterioridad como con preferencia especialmente destacada.

En un grupo de compuestos de la fórmula (I) destacado para usar según la invención, G¹ representa CH.

En otro grupo de compuestos de la fórmula (I) destacado para usar según la invención, G¹ representa N.

En otro grupo de compuestos de la fórmula (I) destacado para usar según la invención, G¹ representa C-halógeno.

En otro grupo de compuestos de la fórmula (I) destacado para usar según la invención, G¹ representa CH y R¹ representa hidrógeno.

En otro grupo de compuestos de la fórmula (I) destacado para usar según la invención, G¹ representa N y R¹ representa hidrógeno.

En otro grupo de compuestos de la fórmula (I) destacado para usar según la invención, G¹ representa C-halógeno y R¹ representa hidrógeno.

30 En otro grupo de compuestos de la fórmula (I) destacado para usar según la invención, G¹ representa CH y R¹ representa metilo.

En otro grupo de compuestos de la fórmula (I) destacado para usar según la invención, G¹ representa N y R¹ representa metilo.

En otro grupo de compuestos de la fórmula (I) destacado para usar según la invención, G¹ representa C-halógeno y R¹ representa metilo.

En otro grupo de compuestos de la fórmula (I) destacado para usar según la invención, G² representa D- R³_b.

En otro grupo de compuestos de la fórmula (I) destacado para usar según la invención, G^2 representa D- R^3_b y b representa 1.

La presente invención también se refiere a nuevos compuestos de la fórmula (I)

$$G_{N}^{1}$$
 G^{2}

5

20

25

en la que

10

15

20

25

30

45

50

55

- G¹ representa N, CH, C-halógeno C-nitro, C-ciano, C-alquilo, C-haloalquilo, C-cicloalquilo, C-alcoxi, C-haloalcoxi,
- R¹ representa hidrógeno, alquil haloalquilo, cicloalquilo, halógeno, ciano, alcoxi, haloalcoxi, amino, alquilamino, dialquilamino o alquiltio,
- 5 G^2 representa A- R_a^2 , D- R_b^3 o E- R_c^4 , en la que
 - representa heterociclilo de la serie de 2-tetrahidrofuranilo, 3-tetrahidrofuranilo, 2-tetrahidrotienilo, 3-Α tetrahidrotienilo, 2-pirrolidinilo, 3-pirrolidinilo, 3-isoxazolidinilo, 4-isoxazolidinilo, 5-isoxazolidinilo, isotiazolidinilo, 4-isotiazolidinilo, 5-isotiazolidinilo, 3-pirazolidinilo, 4-pirazolidinilo, 5-pirazolidinilo, oxazolin-2-ilo, 2-oxazolidinilo, 4-oxazolidinilo, 5-oxazolidinilo, 2-tiazolidinilo, 4-tiazolidinilo, 5-tiazolidinilo, 2-imidazolidinilo, 4imidazolidinilo, 5,6-dihidro-[1,3,4]-oxadiazin-2-ilo, 5,6-dihidro-[1,3,4]-tiadiazin-2-ilo, 5,6-dihidro-[1,4,2]-dioxazin-3-ilo, hidroxipiridilo, 1,2,4-oxadiazolidin-3-ilo, 1,2,4-oxadiazolidin-5-ilo, 1,2,4-tiadiazolidin-3-ilo, 1,2,4-tiadiazolidin-3-ilo, 1,3,4-triazolidin-3-ilo, 1,3,4-triazolidin-2-ilo, 1,3,4-triazolidin-3-ilo, 1,3,4-triazoli 2,3-dihidrofur-2-ilo, 2,3-dihidrofur-3-ilo, 2,4-dihidrofur-2-ilo, 2,3-dihidrotien-2-ilo, 2,3-dihidrotien-3-ilo, 2,4-dihidrofur-2-ilo, 2,3-dihidrotien-3-ilo, 2,4-dihidrofur-2-ilo, 2,3-dihidrotien-3-ilo, 2,4-dihidrofur-2-ilo, 2,3-dihidrotien-3-ilo, 2,4-dihidrofur-2-ilo, 2,3-dihidrotien-3-ilo, 2,4-dihidrofur-3-ilo, 3,4-dihidrofur-3-ilo, 3,4-dihidrofur-3 dihidrotien-2-ilo, 2-pirrolin-2-ilo, 2-pirrolin-3-ilo, 3-pirrolin-2-ilo, 3-pirrolin-3-ilo, 2-isoxazolin-3-ilo, 3-isoxazolin-3-ilo, 3-isoxazolin-3-ilo, 3-pirrolin-3-ilo, 3-pir ilo, 4-isoxazolin-3-ilo, 2-isoxazolin-4-ilo, 3-isoxazolin-4-ilo, 4-isoxazolin-4-ilo, 2-isoxazolin-5-ilo, 3-isoxazolin-5ilo, 4-isoxazolin-5-ilo, 2-isotiazolin-3-ilo, 3-isotiazolin-3-ilo, 4-isotiazolin-3-ilo, 2-isotiazolin-4-ilo, 3-isotiazolin-4ilo, 4-isotiazolin-4-ilo, 2-isotiazolin-5-ilo, 3-isotiazolin-5-ilo, 4-isotiazolin-5-ilo, 2,3-dihidropirazol-1-ilo, 2,3-dihidropirazol-3-ilo, 2,3-dihidropirazol-4-ilo, 2,3-dihidropirazol-5-ilo, 3,4-dihidropirazol-4-ilo, 2,3-dihidropirazol-5-ilo, 3,4-dihidropirazol-4-ilo, 2,3-dihidropirazol-5-ilo, 3,4-dihidropirazol-5-ilo, 3,4-dih 1-ilo, 3,4-dihidropirazol-3-ilo, 3,4-dihidropirazol-4-ilo, 3,4-dihidropirazol-5-ilo, 4,5-dihidropirazol-1-ilo, 4,5dihidropirazol-3-ilo, 4,5-dihidropirazol-4-ilo, 4,5-dihidropirazol-5-ilo, 2,3-dihidrooxazol-2-ilo, 2,3-dihidrooxazol-3-ilo, 2,3-dihidrooxazol-4-ilo, 2,3-dihidrooxazol-5-ilo, 3,4-dihidrooxazol-2-ilo, 3,4-dihidrooxazol-3-ilo, 3,4dihidrooxazol-4-ilo, 3,4-dihidrooxazol-5-ilo, 2-piperidinilo, 3-piperidinilo, 4-piperidinilo, 1,3-dioxan-5-ilo, 2-tetrahidropiranilo, 4-tetrahidropiranilo, 2-tetrahidrotienilo, 3-hexahidropiridazinilo, 4-hexahidropiridazinilo, 2hexahidropirimidinilo, 4-hexahidropirimidinilo, 5-hexahidropirimidinilo, 2-piperazinilo, 1,3,5-hexahidro-triazin-2ilo y 1,2,4-hexahidrotriazin-3-ilo,
 - R² representa un resto de la serie de halógeno, ciano, nitro, alquilo, haloalquilo, cicloalquilo dado al caso sustituido, alcoxi, haloalcoxi, alquiltio, haloalquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, haloalquilsulfonilo, amino, alquilamino, dialquilamino, alquilcarbonilamino, alcoxicarbonilamino, alcoxicarbonilo, haloalcoxialquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilalquilo dado al caso sustituido, alquilcarbonilo, alcoxicarbonilo, aminocarbonilo, piridilo y pirimidilo (en la que piridilo y pirimidilo, a su vez, también pueden estar sustituidos con halógeno, alquilo, haloalquilo, alcoxi y haloalcoxi),
 - a representa un número de la serie de 0, 1, 2 y 3,
- D representa un resto heteroarilo de la serie de pirrolilo, pirazolilo, imidazolilo, 1,2,3-triazolilo, 1,2,4-triazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, 1,2,3-oxadiazolilo, 1,2,4-oxadiazolilo, 1,3,4-oxadiazolilo, 1,2,5oxadiazolilo, 1,2,3-tiadiazolilo, 1,2,4-tiadiazolilo, 1,3,4-tiadiazolilo, 1,2,5-tiadiazolilo, piridilo, pirimidinilo, 35 piridazinilo, pirazinilo, 1,2,3-triazinilo, 1,2,4-triazinilo, 1,3,5-triazinilo, benzofurilo, ben benzoisotienilo. indolilo, isoindolilo, indazolilo, benzotiazolilo, benzoisotiazolilo, benzoisoxazolilo, bencimidazolilo, 2,1,3-benzoxadiazolilo, quinolinilo, isoquinolinilo, cinolinilo, ftalazinilo, quinazolinilo, quinoxalinilo, naftiridinilo, benzotriazinilo, purinilo, pteridinilo e indolizinilo (en especial pirid-2-ilo, pirid-3-ilo, pirimid-2-ilo, pirimid-4-ilo, imidazolilo, pirazol-1-ilo, pirazol-3-ilo, pirazinilo, 1,2,3-triazinilo, 1,2,4-triazinilo, 1,3,5-triazinilo, tiazol-2-ilo, tiazol-4-ilo, 1,2,4-tiadiazolilo, 1,3,4-tiadiazolilo, 1,2,5-tiadiazolilo, 1,2,5-40 oxadiazolilo, 1,2,4-oxadiazolilo, 1,3,4-oxadiazolilo, 1,2,5-oxadiazolilo y oxazolilo),
 - R^3 representa un resto de la serie de cicloalquilo dado al caso sustituido, cicloalquenilo dado al caso sustituido, cicloalquilalquilo dado al caso sustituido, en la que en la parte cicloalquilo del resto cicloalquilalquilo uno o dos grupos CH2 pueden estar reemplazados por oxígeno o azufre, pero dos átomos de oxígeno no deben ser bis(alcoxi)alquilo. bis(haloalcoxi)alquilo, alcoxi(alquilsulfanil)alquilo, inmediatamente advacentes. alcoxi(alquilsulfinil)alquilo, alcoxi(alquilsulfonil)alquilo, bis(alquilsulfanil)alquilo, bis(haloalquilsulfanil)alquilo, bis(hidroxialquilsulfanil)alquilo, alcoxicarbonilalquilo, alfa-hidroxiimino-alcoxicarbonilalquilo, alfa-alcoxiimino-alcoxicarbonilalquilo, C(X)NR⁵R⁶, (en la que X representa azufre o NOH, R⁵ representa hidrógeno o alquilo y R⁶ representa un resto de la serie de hidrógeno, alquilo, haloalquilo, cianoalquilo, alquinilo, cicloalquilo, cicloalquilalquilo, alquilcarbonilo, alcoxialquilo, alcoxicarbonilo, alcoxicarbonilalquilo, alquiltioalquilo, arilo (en especial fenilo), arilalquilo (en especial bencilo) y hetarilalquilo (en especial 2-pirimidilmetilo) o X representa azufre, NOH, NR¹⁵ u oxígeno y R⁵ y R⁶ junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos forman un anillo, que dado al caso contiene uno o varios otros heteroátomos de la serie de NH, NCH₃, NC₂H₅, oxígeno y azufre, en la que dos átomos de oxígeno no deben ser inmediatamente adyacentes o R⁵ y R¹⁵ junto con los átomos de nitrógeno a los que están unidos forman un anillo, que puede contener uno o varios otros heteroátomos de la serie de NH, NCH₃, NC₂H₅, oxígeno y azufre, en la que dos átomos de oxígeno no deben ser inmediatamente advacentes), NR⁷R⁸ (en la que R⁷ representa hidrógeno o alquilo y R⁸ representa alquinilo,

cicloalquilalquilo, alcoxi, haloalcoxi, alcoxicarbonilalquilo, alquiltioalquilo, arilalquilo o hetarilalquilo o R⁷ y R⁸ junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos forman un anillo, que dado al caso contiene uno o varios otros heteroátomos de la serie de NH, NCH₃, NC₂H₅, oxígeno y azufre, en la que dos átomos de oxígeno no deben ser inmediatamente adyacentes), los restos de heterociclilo cicloalquilo y cicloalquenilo en los que uno o dos grupos CH₂ están reemplazados por oxígeno o azufre, en la que dos átomos de oxígeno no deben ser inmediatamente adyacentes, en especial dioxanilo, dioxolanilo, dioxepanilo, dioxocanilo, oxatianilo, oxatiolanilo, oxatiepanilo, oxatiocanilo, ditianilo, ditiolanilo, ditiepanilo, ditiocanilo, óxido de oxatianilo, óxido de oxatiolanilo, óxido de oxatiepanilo, óxido de oxatiocanilo, dióxido de oxatianilo, dióxido de oxatiolanilo, dióxido de oxatiepanilo, dióxido de oxatiocanilo (en la que en estos restos de heterociclilo dos átomos de H unidos al mismo átomo de C pueden estar reemplazados por =CH₂, -CH₂-CH₂-, -CH₂-CH₂-CH₂- o -CH₂-CH₂-CH₂-CH₂-), morfolinilo, triazolinonilo, oxazolinilo, dihidrooxadiazinilo, dihidrodioxazinilo, dihidrooxazolilo, dihidrooxazinilo y pirazolinonilo (en la que todos los restos heterociclilo, a su vez, también pueden estar sustituidos con alquilo, haloalquilo, alcoxi y alcoxialquilo), fenilo (que, a su vez, puede estar sustituido con halógeno, ciano, nitro, alquilo y haloalquilo), los restos heteroarilo piridilo. N-óxido de piridilo, pirimidilo, imidazolilo, pirazolilo. oxazolilo, tiazolilo, furanilo, tienilo, triazolilo, tetrazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, pirazinilo, triazinilo, tetrazinilo e isoquinolinilo (que, a su vez, pueden estar sustituidos con halógeno, nitro, alquilo, haloalquilo, alcoxi, haloalcoxi, alcoxialquilo, alquiltio, alquiltioalquilo y cicloalquilo) y los restos de heteroarilalquilo triazolilalquilo, piridilalquilo, pirimidilalquilo y oxadiazolilalquilo (que, a su vez, pueden estar sustituidos con alquilo),

- b representa un número de la serie de 1, 2 y 3,
- 20 E representa arilo, en especial fenilo,

5

10

15

25

30

35

40

45

50

55

 R^4

representa un resto de la serie de halógeno, nitro, amino, formilo, ciano, alguilamino, haloalguilamino, dialquilamino, alquilo, haloalquilo, cicloalquilo dado al caso sustituido, cicloalquenilo dado al caso sustituido, cicloalquilalquilo dado al caso sustituido, en la que en la parte cicloalquilo del resto cicloalquilalquilo uno o dos grupos CH₂ pueden estar reemplazados por oxígeno o azufre, pero dos átomos de oxígeno no deben ser inmediatamente adyacentes, alcoxi, haloalcoxi, alcoxialquilo, alcoxialquilo halogenado, bis(alcoxi)alquilo, bis(haloalcoxi)alquilo, alcoxi(alquilsulfanil)alquilo, alcoxi(alquilsulfinil)alquilo, alcoxi(alquilsulfonil)alquilo, pis(aiquiisultanii)aiquilo, bis(haloalquilsulfanii)alquilo, bis(hidroxialquilsulfanii)alquilo, alcoxicarbonilo, alcoxicarbonilalquilo, alfa-hidroxiimino-alcoxicarbonilalquilo, alfa-alcoxiimino-alcoxicarbonilalquilo, C(X)NR⁵R⁶ (en la que X representa oxígeno, azufre, NR15 o NOH, R5 representa hidrógeno o alquilo y R6 representan, de modo independiente entre sí, un resto de la serie de hidrógeno, alquilo, haloalquilo, cicloalquilo, cicloalquilalquilo, alquilcarbonilo, alquinilo, alcoxialquilo, alcoxicarbonilalquilo, alquiltioalquilo, arilo, arilalquilo y hetarilalquilo y R6 también puede representar OH o R⁵ y R⁶ junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos forman un anillo, que puede contener uno o varios otros heteroátomos de la serie de NH, NCH₃, NC₂H₅, oxígeno y azufre, en la que dos átomos de oxígeno no deben ser inmediatamente adyacentes o R⁵ y R¹⁵ junto con los átomos de nitrógeno a los que están unidos forman un anillo, que puede contener uno o varios otros heteroátomos de la serie de NH, NCH₃, NC₂H₅, oxígeno y azufre, en la que dos átomos de oxígeno no deben ser inmediatamente adyacentes), NR⁷R⁸ (en la que R⁷ representa hidrógeno o alquilo y R⁸ representa un resto de la serie de hidrógeno, alquilo, haloalquilo, cianoalquilo, alquinilo, cicloalquilo, cicloalquilalquilo, alcoxi, haloalcoxi, alcoxialquilo, alcoxicarbonilo, alcoxicarbonilalquilo, alquiltioalquilo, arilo, arilalquilo o hetarilalquilo o R⁷ y R⁸ junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos forman un anillo, que puede contener uno o varios otros heteroátomos de la serie de NH, NCH₃, NC₂H₅, oxígeno y azufre), alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, los restos de heterociclilo cicloalquilo y cicloalquenilo en los que uno o dos grupos CH2 están reemplazados por oxígeno o azufre, en la que dos átomos de oxígeno no deben ser inmediatamente adyacentes, en especial dioxanilo, dioxolanilo, dioxepanilo, dioxocanilo, oxatianilo, oxatiolanilo, oxatiepanilo, oxatiocanilo, ditianilo, ditiolanilo, ditiepanilo, ditiocanilo, óxido de oxatianilo, óxido de oxatiolanilo, óxido de oxatiepanilo, óxido de oxatiocanilo, dióxido de oxatianilo, dióxido de oxatiolanilo, dióxido de oxatiepanilo, dióxido de oxatiocanilo (en la que en estos restos de heterociclilo dos átomos de H unidos al mismo átomo de C pueden estar reemplazados por =CH2, -CH2-CH2-, -CH2-CH2-CH2--CH₂-CH₂-CH₂-CH₂-), morfolinilo, triazolinonilo, oxazolinilo, dihidrooxadiazinilo, dihidrodioxazinilo, dihidrooxazolilo, dihidrooxazinilo y pirazolinonilo (en la que todos los restos heterociclilo, a su vez, también pueden estar sustituidos con alquilo, haloalquilo, alcoxi y alcoxialquilo), fenilo (que, a su vez, puede estar sustituido con halógeno, ciano, nitro, alquilo y haloalquilo), los restos heteroarilo piridilo, N-óxido de piridilo, pirimidilo, imidazolilo, pirazolilo, oxazolilo, tiazolilo, furanilo, tienilo, triazolilo, tetrazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, pirazinilo, triazinilo, tetrazinilo e isoquinolinilo (que, a su vez, pueden estar sustituidos con halógeno, nitro, alquilo, haloalquilo, alcoxi, haloalcoxi, alcoxialquilo, alquiltio, alquiltioalquilo y cicloalquilo) y los restos de heteroarilalquilo triazolilalquilo, piridilalquilo, pirimidilalquilo y oxadiazolilalquilo (que, a su vez, pueden estar sustituidos con halógeno y alquilo),

У

c representa un número de la serie de 0, 1, 2 y 3,

así como sus sales, complejos metálicos y N-óxidos.

Se prefieren nuevos compuestos de la fórmula (I), en la que

- G¹ representa N, CH, C-halógeno, C-nitro, C-ciano, C-alquilo (C₁-C₆), C-haloalquilo (C₁-C₆), C-cicloalquilo (C₃-C₆), C-alcoxi (C₁-C₆), C-haloalcoxi (C₁-C₆), en especial representa N, CH, C-halógeno, C-ciano o C-trifluorometilo,
- R¹ representa hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, halógeno, ciano, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, amino, alquil C₁-C₆-amino, dialquil (C₁-C₆)-amino o alquil C₁-C₆-tio, en especial representa hidrógeno y metilo y
- G^2 representa A- R^2_a , D- R^3_b o E- R^4_c , en la que

5

15

20

- 10 A representa heterociclilo de la serie de oxazolin-2-ilo, 5,6-dihidro-[1,3,4]-oxadiazin-2-ilo, 5,6-dihidro-[1,3,4]-tiadiazin-2-ilo, 5,6-dihidro-[1,4,2]-dioxazin-3-ilo e hidroxipiridilo,
 - R² representa un resto de la serie de halógeno, ciano, nitro, alquilo C_1 - C_6 , haloalquilo C_1 - C_6 , dado al caso sustituido con halógeno, ciano, alquilo C_1 - C_6 , haloalquilo C_1 - C_6 y cicloalquilo C_3 - C_6 sustituido con alcoxi C_1 - C_6 , alcoxi C_1 - C_6 , haloalcoxi C_1 - C_6 , alquil C_1 - C_6 -tio, haloalquil C_1 - C_6 -sulfinilo, alquil C_1 - C_6 -sulfinilo, haloalquil C_1 - C_6 -sulfonilo, amino, alquil C_1 - C_6 -amino, di-(alquil C_1 - C_6 -gamino, alquil C_1 - C_6 -carbonilamino, alcoxi C_1 - C_6 -carbonilamino, alcoxi C_1 - C_6 -alquilo C_1 - C_6 , haloalcoxi C_1 - C_6 -alquilo C_1 - C_6 , alquinilo C_2 - C_6 , cicloalquil C_3 - C_6 -alquilo C_1 - C_6 dado al caso sustituido con halógeno, ciano, alquilo C_1 - C_6 , haloalquilo C_1 - C_6 y alcoxi C_1 - C_6 , alquil C_1 - C_6 -carbonilo, alcoxi C_1 - C_6 -carbonilo, piridilo y pirimidilo (en donde piridilo y pirimidilo, a su vez, también pueden estar sustituidos con halógeno, alquilo C_1 - C_6 , haloalquilo C_1 - C_6 , alcoxi C_1 - C_6 y haloalcoxi C_1 - C_6),
 - a representa un número de la serie de 0, 1, 2 y 3,
- D representa un resto heteroarilo de la serie de pirrolilo, pirazolilo, imidazolilo, 1,2,3-triazolilo, 1,2,4-triazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, 1,2,3-oxadiazolilo, 1,2,4-oxadiazolilo, 1,3,4-oxadiazolilo, 1,2,5oxadiazolilo, 1,2,3-tiadiazolilo, 1,2,4-tiadiazolilo, 1,3,4-tiadiazolilo, 1,2,5-tiadiazolilo, piridilo, pirimidinilo, piridazinilo, pirazinilo, 1,2,3-triazinilo, 1,2,4-triazinilo, 1,3,5-triazinilo, benzofurilo, benzoisofurilo, benzotienilo, 25 isoindolilo. benzoisotienilo indolilo. indazolilo, benzotiazolilo. benzoisotiazolilo. benzoxazolilo. benzoisoxazolilo, bencimidazolilo, 2,1,3-benzoxadiazolilo, quinolinilo, isoquinolinilo, cinolinilo, ftalazinilo, quinazolinilo, quinoxalinilo, naftiridinilo, benzotriazinilo, purinilo, pteridinilo e indolizinilo (en especial pirid-2-ilo, pirid-3-ilo, pirimid-2-ilo, pirimid-4-ilo, imidazolilo, pirazol-1-ilo, pirazol-3-il pirazinilo, 1,2,3-triazinilo, 1,2,4-30 triazinilo, 1,3,5-triazinilo, tiazol-2-ilo, tiazol-4-il 1,2,4-tiadiazolilo, 1,3,4-tiadiazolilo, 1,2,5-tiadiazolilo, 1,2,3oxadiazolilo, 1,2,4-oxadiazolilo, 1,3,4-oxadiazolilo, 1,2,5-oxadiazolilo y oxazolilo),
- R^3 representa un resto de la serie de cicloalquilo C3-C6 dado al caso sustituido con halógeno, ciano, alquilo C1-C₆, haloalquilo C₁-C₆ y alcoxi C₁-C₆, cicloalquenilo C₃-C₆ dado al caso sustituido con halógeno, ciano, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆ y alcoxi C₁-C₆, cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₆ dado al caso sustituido con halógeno, 35 ciano, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆ y alcoxi C₁-C₆, en la que en la parte de cicloalquilo, siempre que sea de 5 o 6 miembros, del resto cicloalquilalquilo uno o dos grupos CH₂ pueden estar reemplazados por oxígeno o azufre, pero dos átomos de oxígeno no deben ser inmediatamente adyacentes, bis(haloalcoxi C₁-C₆)-alquilo $C_1-C_6, \ alcoxi \ C_1-C_6-(alquil \ C_1-C_6-sulfanil)-alquilo \ C_1-C_6, \ alcoxi \ C_1-C_6-(alquil \ C_1-C_6-sulfinil)-alquilo \ C_1-C_6, \ alcoxi \ C_1-C_6-(alquil \ C_1-C_6-sulfinil)-alquilo \ C_1-C_6, \ alcoxi \ C_1-C_6-(alquil \ C_1-C_6-sulfinil)-alquilo \ C_1-C_6-(alquil \ C_1-C_6-sulfin$ $C_1-C_6-(alquil\ C_1-C_6-sulfanil)-alquilo\ C_1-C_6,\ bis(alquil\ C_1-C_6-sulfanil)-alquilo\ C_1-C_6,\ bis(haloalquil\ C_1-C_6-sulfanil)-alquilo\ C_1-C_6-sulfanil)-alquilo\ C_1-C_6-sulfanil)-alquilo\ C_1-C_6-sulfanil)-alquilo\ C_1-C_6-sulfanilo-alquilo\ C_1-C_6-sulfa$ $alquilo \quad C_1-C_6, \ bis(hidroxialquilsulfanil)-alquilo \quad C_1-C_6, \ alcoxi \quad C_1-C_6-carbonil-alquilo \quad C_1-$ 40 alcoxi C₁-C₆-carbonilmetilo, alfa-alcoxi C₁-C₆-imino-alcoxi C₁-C₆-carbonilmetilo, C(X)NR⁵R⁶, (en la que X representa azufre o NOH, R⁵ representa hidrógeno o alquilo C₁-C₆ y R⁶ representa un resto de la serie de hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, ciano-alquilo C₁-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalquil C_3 - C_6 -alquilo C_1 - C_6 , alcoxi C_1 - C_6 -carbonilo, alcoxi C_1 - C_6 -alquilo C_1 - C_6 , alcoxi C_1 - C_6 -carbonil-alquilo C_1 - C_6 alquil C_1 - C_6 -tio-alquilo C_1 - C_6 , fenil-alquilo C_1 - C_6 y hetaril-alquilo C_1 - C_6 , en la que hetarilo representa pirimidilo o X representa azufre, NR¹⁵, NOH o oxígeno y R⁵ y R⁶ junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos 45 forman un anillo de 5 a 7 miembros, que puede contener uno o varios otros heteroátomos de la serie de NH, NCH₃, NC₂H₅, oxígeno y azufre, en la que dos átomos de oxígeno no deben ser inmediatamente adyacentes o R⁵ y R¹⁵ junto con los átomos de nitrógeno a los que están unidos forman un anillo, que puede contener uno o varios otros heteroátomos de la serie de NH, NCH₃, NC₂H₅, oxígeno y azufre, en la que dos átomos de 50 oxígeno no deben ser inmediatamente adyacentes), NR⁷R⁸ (en la que R⁷ representa hidrógeno o alquilo C₁- C_6 y R^8 representa un resto de la serie de alquinilo C_2 - C_6 , cicloalquil C_3 - C_6 -alquilo C_1 - C_6 , alcoxi C_1 - C_6 , haloalcoxi C_1 - C_6 , alcoxi C_1 - C_6 -carbonil-alquilo C_1 - C_6 , en la que hetarilo representa pirimidilo o R^7 y R^8 junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos forman un anillo de 5 a 7 miembros, que puede contener otro heteroátomo de la serie de NH, NCH₃, 55 NC₂H₅, oxígeno y azufre), los restos de heterociclilo cicloalquilo C₃-C₈ y cicloalquenilo C₄-C₈ en los que uno o dos grupos CH2 están reemplazados por oxígeno o azufre, en la que dos átomos de oxígeno no deben ser

inmediatamente advacentes, en especial dioxanilo, dioxolanilo, dioxopanilo, dioxocanilo, oxatianilo, oxatiolanilo, oxatiepanilo, oxatiocanilo, ditianilo, ditiolanilo, ditiepanilo, ditiocanilo, óxido de oxatianilo, óxido de oxatiolanilo, óxido de oxatiepanilo, óxido de oxatiocanilo, dióxido de oxatianilo, dióxido de oxatiolanilo, dióxido de oxatiepanilo, dióxido de oxatiocanilo (en la que en estos restos de heterociclilo dos átomos de H unidos al mismo átomo de C pueden estar reemplazados por =CH₂, -CH₂-CH₂-, -CH₂-CH₂-CH₂- o -CH₂-CH₂-CH₂-CH₂-, morfolinilo, triazolinonilo, oxazolinilo, dihidrooxadiazinilo, dihidrodioxazinilo, dihidrooxazolilo, dihidrooxazinilo y pirazolinonilo (en especial 1,3-dioxolan-2-ilo, 1,3-dioxan-2-ilo, 1,3-dioxepan-2-ilo, 1,3-dioxocan-2-ilo, oxatian-2-ilo, 1,3-oxatiolan-2-ilo, 1,3-oxatiepan-2-ilo, 1,3-oxatiocan-2-ilo, 1,3-ditian-2-ilo, 1,3-ditiolan-2-ilo, 1,3-oxatiocan-2-ilo, 1,3-oxatiocan-2-ilo ditiepan-2-ilo, 1,3-ditiocan-2-ilo, 4,5-dihidro-1,3-oxazol-2-ilo, 5,6-dihidro-4H-1,3-oxazin-2-ilo, 3-óxido de 1,3oxatianilo, 3-óxido de 1,3-oxatiolanilo, 3-óxido de 1,3-oxatiepanilo, 3-óxido de 1,3-oxatiocanilo, 3,3-dióxido de 1,3-oxatianilo, 3,3-dióxido de 1,3-oxatiolanilo, 3,3-dióxido de 1,3-oxatiepanilo, 3,3-dióxido de 1,3-oxatiocanilo (en la que en estos restos de heterociclilo dos átomos de H unidos al mismo átomo de C pueden estar reemplazados por =CH₂, -CH₂-CH₂-, -CH₂-CH₂-CH₂- o -CH₂-CH₂-CH₂-CH₂-) y 1,2,4-triazolin-3-on-2-ilo) (en la que todos los restos heterociclilo, a su vez, también pueden estar sustituidos con alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆ y alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆), fenilo (que, a su vez, puede estar sustituido con halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₆ y haloalquilo C₁-C₆), los restos heteroarilo piridilo, N-óxido de piridilo, pirimidilo, imidazolilo, pirazolilo, oxazolilo, tiazolilo, furanilo, tienilo, triazolilo, tetrazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, pirazinilo, triazinilo, tetrazinilo e isoquinolinilo (en especial pirid-2-ilo, pirimid-2-ilo, pirimid-4-ilo, pirazol-1-ilo, pirazol-3-ilo, pirazol-5-ilo, 1,2,4-oxadiazol-3-ilo, 1,2,4-triazol-3-ilo, 1,2,3-triazol-1-ilo, 1,2,3-triazol-2-ilo, 1,2,4-triazol-3-ilo, tiadiazol-3-ilo y 1,2,4-triazin-3-ilo) (que, a su vez, pueden estar sustituidos con halógeno, nitro, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C_1 - C_6 , alcoxi C_1 - C_6 , haloalcoxi C_1 - C_6 , alcoxi C_1 - C_6 -alquilo C_1 - C_6 , alquil C_1 - C_6 -tio, alquil C_1 - C_6 -tioalquilo C₁-C₆ y cicloalquilo C₃-C₆) y los restos de heteroarilalquilo triazolil-alquilo C₁-C₆, piridil-alquilo C₁-C₆, pirimidil-alquilo C₁-C₆ y oxadiazolil-alquilo C₁-C₆ (que, a su vez, pueden estar sustituidos con alquilo C₁-C₆),

b representa un número de la serie de 1, 2 y 3,

25 E representa fenilo,

 R^4

5

10

15

20

30

35

40

45

50

55

60

representa un resto de la serie de halógeno, nitro, amino, formilo, ciano, alquil C1-C6-amino, haloalquil C1-C6amino di-(alquil C₁-C₆)amino, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, cicloalquilo C₃-C₆ dado al caso sustituido con halógeno, ciano, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆ y alcoxi C₁-C₆, cicloalquenilo C₃-C₆ dado al caso sustituido con halógeno, ciano, alquilo C_1 - C_6 , haloalquilo C_1 - C_6 y alcoxi C_1 - C_6 , cicloalquil C_3 - C_6 -alquilo C_1 - C_6 dado al caso sustituido con halógeno, ciano, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆ y alcoxi C₁-C₆, en la que en la parte de cicloalquilo, siempre que sea de 5 o 6 miembros, del resto cicloalquilalquilo uno o dos grupos CH2 pueden estar reemplazados por oxígeno o azufre, pero dos átomos de oxígeno no deben ser inmediatamente adyacentes, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆ halogenado, bis(alcoxi C₁-C₆)-alquilo C₁-C₆, bis(haloalcoxi C₁-C₆)-alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-(alquil C₁-C₆-sulfanil)-alquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 -(alquil C_1-C_6 -sulfinil)-alquilo C_1-C_6 , alcoxi C_1-C_6 -(alquil C_1-C_6 -sulfonil)-alquilo C_1-C_6 , $bis(alquil \ C_1-C_6-sulfanil)-alquilo \ C_1-C_6, \ bis(haloalquil \ C_1-C_6-sulfanil)-alquilo \ C_1-C_6, \ bis(hidroxialquil \ C_1-C_6-sulfanil)-alquilo \ C_1-C_6-sulfanil)-alquilo \ C_1-C_6-sulfanilo \ C_1$ sulfanil)-alquilo C_1 - C_6 , alcoxi C_1 - C_6 -carbonilo, alcoxi C_1 - C_6 -carbonil-alquilo C_1 - C_6 , alfa-hidroxiimino-alcoxi C_1 - C_6 -carbonilmetilo, alfa-alcoxi C_1 - C_6 -imino-alcoxi C_1 - C_6 -carbonilmetilo, $C(X)NR^5R^6$, (en la que X representa oxígeno, azufre, NR^{15} o NOH, R^5 representa hidrógeno o alquilo C_1 - C_6 y R^6 y R^{15} representan, de modo independiente entre sí, un resto de la serie de hidrógeno, alquilo C_1 - C_6 , haloalquilo C_1 - C_6 , ciano-alquilo C_1 - C_6 , alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₆, alquil C₁-C₆-carbonilo, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-carbonilo, alcoxi C₁-C₆-carbonil-alquilo C₁-C₆, alquil C₁-C₆-tio-alquilo C₁-C₆, fenilo, fenilo alquilo C₁-C₆ o hetaril-alquilo C₁-C₆, en la que hetarilo representa pirimidilo y R6 también puede representar OH o R⁵ y R⁶ junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos forman un anillo de 5 a 7 miembros, que puede contener otro heteroátomo de la serie de NH, NCH₃, NC₂H₅, oxígeno y azufre en la que dos átomos de oxígeno no deben ser inmediatamente adyacentes o R⁵ y R¹⁵ junto con los átomos de nitrógeno a los que están unidos forman un anillo de 5 a 7 miembros, que pueden contener uno o varios, en especial uno o dos otros heteroátomos de la serie de NH, NCH₃, NC₂H₅, oxígeno y azufre, en la que dos átomos de oxígeno no deben ser inmediatamente adyacentes), NR⁷R⁸ (en la que R⁷ representa hidrógeno o alquilo C₁-C₆ y R⁸ representa un resto de la serie de hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, ciano-alquilo C₁-C₆, alquinilo C_2 - C_6 , cicloalquilo C_3 - C_6 , cicloalquil C_3 - C_6 -alquilo C_1 - C_6 , alcoxi C_1 - C_6 , haloalcoxi C_1 - C_6 , alcoxi C_1 - C_6 -alquilo C_1 - C_6 , alcoxi C_1 - C_6 -carbonilo, alcoxi C_1 - C_6 -carbonil-alquilo C_1 - C_6 , alquil C_1 - C_6 -tio-alquilo C_1 - C_6 , fenilo, fenilalquilo C_1 - C_6 y hetaril-alquilo C_1 - C_6 , en la que hetarilo representa pirimidilo o R^7 y R^8 junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos forman un anillo de 5 a 7 miembros, que puede contener otro heteroátomo de la serie de NH, NCH₃, NC₂H₅, oxígeno y azufre), alquil C₁-C₆-tio, alquil C₁-C₆-sulfinilo, alquil C₁-C₆-sulfonilo, los restos de heterociclilo cicloalquilo C₃-C₈ y cicloalquenilo C₄-C₈ en los que uno o dos grupos CH₂ están reemplazados por oxígeno o azufre, en especial dioxanilo, dioxolanilo, dioxepanilo, dioxocanilo, oxatianilo, oxatiolanilo, oxatiepanilo, oxatiocanilo, ditianilo, ditiolanilo, ditiepanilo, ditiocanilo, óxido de oxatianilo, óxido de oxatiolanilo, óxido de oxatiepanilo, óxido de oxatiocanilo, dióxido de oxatianilo, dióxido de oxatiolanilo, dióxido de oxatiepanilo, dióxido de oxatiocanilo (en la que en estos restos de heterociclilo dos átomos de H unidos al mismo átomo de C pueden estar reemplazados por =CH₂, -CH₂-CH₂-, -CH₂-CH₂-CH₂- o -CH₂-CH₂-CH₂-CH₂-), morfolinilo, triazolinonilo, oxazolinilo, dihidrooxadiazinilo, dihidrodioxazinilo, dihidrooxazolilo, dihidrooxazinilo y

pirazolinonilo (en especial 1,3-dioxolan-2-ilo, 1,3-dioxan-2-ilo, 1,3-dioxepan-2-ilo, 1,3-dioxocan-2-ilo, 1,3oxatian-2-ilo, 1,3-oxatiolan-2-ilo, 1,3-oxatiepan-2-ilo, 1,3-oxatiocan-2-ilo, 1,3-ditian-2-ilo, 1,3-ditiolan-2-ilo, 1,3-oxatiocan-2-ilo, 1,3-oxatiocan-2-ilo ditiepan-2-ilo, 1,3-ditiocan-2-ilo, 4,5-dihidro-1,3-oxazol-2-ilo, 5,6-dihidro-4H-1,3-oxazin-2-ilo, 3-óxido de 1,3oxatianilo, 3-óxido de 1,3-oxatiolanilo, 3-óxido de 1,3-oxatiepanilo, 3-óxido de 1,3-oxatiocanilo, 3,3-dióxido de 1,3-oxatianilo, 3,3-dióxido de 1,3-oxatiolanilo, 3,3-dióxido de 1,3-oxatiepanilo, 3,3-dióxido de 1,3-oxatiocanilo (en la que en estos restos de heterociclilo dos átomos de H unidos al mismo átomo de C pueden estar reemplazados por =CH₂, -CH₂-CH₂-, -CH₂-CH₂-CH₂- o -CH₂-CH₂-CH₂-CH₂-) y 1,2,4-triazolin-3-on-2-ilo) (en la que todos los restos heterociclilo, a su vez, también pueden estar sustituidos con alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆ y alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆), fenilo (que, a su vez, puede estar sustituido con halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₆ y haloalquilo C₁-C₆), los restos heteroarilo piridilo, N-óxido de piridilo, pirimidilo, imidazolilo, pirazolilo, oxazolilo, tiazolilo, furanilo, tienilo, triazolilo, tetrazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, pirazinilo, triazinilo, tetrazinilo e isoquinolinilo (en especial pirid-2-ilo, pirimid-2-ilo, pirimid-4-ilo, pirazol-1-ilo, pirazol-3-ilo, 1,2,4-oxadiazol-3-ilo, 1,2,4-triazol-3-ilo, 1,2,3-triazol-1-ilo, 1,2,3-triazol-2-ilo, 1,2,4tiadiazol-3-ilo y 1,2,4-triazin-3-ilo) (que, a su vez, pueden estar sustituidos con halógeno, nitro, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, alquil C₁-C₆-tio, alquil C₁-C₆-tio alquilo C₁-C₆ y cicloalquilo C₃-C₆) y los restos de heteroarilalquilo triazolil-alquilo C₁-C₆, piridil-alquilo C₁-C₆, pirimidil-alquilo C₁-C₆ y oxadiazolil-alquilo C₁-C₆ (que, a su vez, pueden estar sustituidos con halógeno y alquilo C₁-C₆) v

c representa un número de la serie de 0, 1, 2 y 3,

5

10

15

35

45

20 así como sales, complejos metálicos y N-óxidos de los compuestos de la fórmula (I).

Se prefieren en especial los nuevos compuestos de la fórmula (I), en la que

- G¹ representa N, CH, C-halógeno, C-nitro, C-ciano, C-alquilo (C₁-C₄), C-haloalquilo (C₁-C₄), C-cicloalquilo (C₃-C₆), C-alcoxi (C₁-C₄), C-haloalcoxi (C₁-C₄), en especial representa N, CH, C-halógeno, C-ciano o C-trifluorometilo,
- 25 R¹ representa hidrógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, halógeno, ciano, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, amino, alquil C₁-C₄-amino, dialquil (C₁-C₄)-amino o alquil C₁-C₄-tio, en especial representa hidrógeno y metilo,
 - G^2 representa A- R_a^2 , D- R_b^3 o E- R_c^4 , en la que
- A representa heterociclilo de la serie de oxazolin-2-ilo, 5,6-dihidro-[1,3,4]-oxadiazin-2-il 5,6-dihidro-[1,3,4]-30 tiadiazin-2-ilo y 5,6-dihidro-[1,4,2]-dioxazin-3-ilo,
 - R² representa un resto de la serie de halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, cicloalquilo C₃-C₆ dado al caso sustituido con flúor, cloro, ciano, metilo, metoxi y trifluorometilo, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alquil C₁-C₄-tio, haloalquil C₁-C₄-tio, alquil C₁-C₄-sulfinilo, alquil C₁-C₄-sulfonilo, haloalquil C₁-C₄-sulfonilo, amino, alquil C₁-C₄-amino, di-(alquil C₁-C₄)amino, alquil C₁-C₄-carbonilamino, alcoxi C₁-C₄-carbonilamino, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, alquenilo C₂-C₄, alquenilo C₂-C₄, dado al caso sustituido con flúor, cloro, ciano, metilo, metoxi y trifluorometilo substituiertes cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₄, alquil C₁-C₄-carbonilo, alcoxi C₁-C₄-carbonilo, aminocarbonilo, piridilo y pirimidilo (en donde piridilo y pirimidilo, a su vez, también pueden estar sustituidos con halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, y haloalcoxi C₁-C₄),
- 40 a representa un número de la serie de 0, 1, 2 y 3,
 - D representa un resto heteroarilo de la serie de pirid-2-ilo, pirid-3-ilo, pirimid-2-ilo, pirimid-4-ilo, imidazolilo, pirazol-1-ilo, pirazol-3-il pirazinilo, 1,2,3-triazinilo, 1,2,4-triazinilo, 1,3,5-triazinilo, tiazol-2-ilo, tiazol-2-ilo, 1,2,4-tiadiazolilo, 1,3,4-tiadiazolilo, 1,2,5-tiadiazolilo, 1,2,3-oxadiazolilo, 1,2,4-oxadiazolilo, 1,3,4-oxadiazolilo, 1,2,5-oxadiazolilo y oxazolilo (en especial pirazol-1-ilo, pirazol-3-ilo, pirid-2-ilo, pirid-3-ilo, pirimid-2-ilo, pirimid-4-ilo, tiazol-2-ilo y tiazol-4-ilo),
- representa un resto de la serie de cicloalquilo C₃-C₆ dado al caso sustituido con flúor, cloro, ciano, metilo, metoxi y trifluorometilo, cicloalquenilo C₃-C₆ dado al caso sustituido con flúor, cloro, ciano, metilo, metoxi y trifluorometilo, cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₄ dado al caso sustituido con flúor, cloro, ciano, metilo, metoxi y trifluorometilo, en donde en la parte cicloalquilo, siempre que sea de 5 o 6 miembros, del resto cicloalquilalquilo uno o dos grupos CH₂ pueden estar reemplazados por oxígeno o azufre, pero dos átomos de oxígeno no deben ser inmediatamente adyacentes, bis(haloalcoxi C₁-C₄)-alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-(alquil C₁-C₄-sulfanil)-alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-(alquil C₁-C₄-sulfanil)-alquilo C₁-C₄, bis(haloalquil C₁-C₄-sulfanil)-alquilo C₁-C₄, bis(haloalquil C₁-C₄-sulfanil)-alquilo C₁-C₄, bis(haloalquilsulfanil)-alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-carbonil-alquilo C₁-C₄, alfa-hidroxiimino-alcoxi C₁-C₄-carbonilmetilo, C(X)NR⁵R⁶, (en la que X representa azufre,

R⁵ representa hidrógeno o alquilo C₁-C₄ y R⁶ representa un resto de la serie de hidrógeno, alquilo C₁-C₅, haloalquilo C₁-C₄, ciano-alquilo C₁-C₄, alquinilo C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, alquil C₁-C₄-tio-alquilo C₁-C₄ o fenil-alquilo C₁-C₄ o X representa azufre u oxígeno y R⁵ y R⁶ junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos forman un anillo de 5 a 7 miembros, que puede contener otro heteroátomo de la serie de NH, NCH $_3$, NC $_2$ H $_5$, oxígeno y azufre), NR 7 R 8 (en la que R 7 representa hidrógeno o alquilo C $_1$ -C $_4$ y R 8 representa un resto de la serie de alquinilo C $_2$ -C $_4$, cicloalquil C $_3$ -C $_6$ alquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-carbonil-alquilo C₁-C₄, alquil C₁-C₄-tio-alquilo C₁-C₄ o fenil-alquilo C₁-C₄ o R⁷ y R⁸ junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos forman un anillo de 5 o 6 miembros, que puede contener otro heteroátomo de la serie de oxígeno, azufre, NH, NCH₃ y NC₂H₅), los restos de heterociclilo dioxanilo, dioxolanilo, dioxepanilo, oxatianilo, oxatiolanilo, oxatiepanilo, ditianilo, ditiolanilo, ditiepanilo, óxido de oxatianilo, óxido de oxatiolanilo, óxido de oxatiepanilo, dióxido de oxatianilo, dióxido de oxatiolanilo, dióxido de oxatiepanilo (en la que en estos restos de heterociclilo dos átomos de H unidos al mismo átomo de C pueden estar reemplazados por =CH2, -CH2-CH2-, -CH2-CH2- o -CH2-CH2-CH₂-CH₂-), morfolinilo, triazolinonilo, oxazolinilo, dihidrooxadiazinilo, dihidrodioxazinilo, dihidrooxazolilo, dihidrooxazinilo y pirazolinonilo (en especial 1,3-dioxolan-2-ilo, 1,3-dioxan-2-ilo, 1,3-dioxepan-2-ilo, 1,3oxatian-2-ilo, 1,3-oxatiolan-2-ilo, 1,3-oxatiepan-2-ilo, 1,3-ditian-2-ilo, 1,3-ditiolan-2-ilo, 1,3-ditiepan-2-ilo, 4,5dihidro-1,3-oxazol-2-ilo, 5,6-dihidro-4H-1,3-oxazin-2-ilo, 3-óxido de 1,3-oxatianilo, 3-óxido de 1,3-oxatiolanilo, 3-óxido de 1,3-oxatiepanilo, 3,3-dióxido de 1,3-oxatianilo, 3,3-dióxido de 1,3-oxatiolanilo, 3,3-dióxido de 1,3oxatiepanilo (en la que en estos restos de heterociclilo dos átomos de H unidos al mismo átomo de C pueden estar reemplazados por =CH₂, -CH₂-CH₂-, -CH₂-CH₂-, o -CH₂-CH₂-, y 1,2,4-triazolin-3-on-2-ilo) (en la que todos los restos heterociclilo, a su vez, también pueden estar sustituidos con alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄ y alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄), fenilo (que, a su vez, puede estar sustituido con halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄ y haloalquilo C₁-C₄), los restos heteroarilo piridilo, N-óxido de piridilo, pirimidilo, imidazolilo, pirazolilo, oxazolilo, tiazolilo, furanilo, tienilo, triazolilo, tetrazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, pirazinilo, triazinilo, tetrazinilo e isoquinolinilo (en especial pirid-2-ilo, pirimid-2-ilo, pirimid-4-ilo, pirazol-1-ilo, pirazol-3-ilo, pirazol-5-ilo, 1,2,4-oxadiazol-3-ilo, 1,2,4-triazol-3-ilo, 1,2,3-triazol-1-ilo, 1,2,3-triazol-2-ilo, 1,2,4tiadiazol-3-ilo, tetrazolilo y 1,2,4-triazin-3-ilo) (que, a su vez, pueden estar sustituidos con halógeno, nitro, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, alquil C₁-C₄-tio, alquil C₁-C₄-tio-alquilo C₁-C₄ y cicloalquilo C₃-C₆) y los restos de heteroarilalquilo triazolil-alquilo C₁-C₄, piridilalquilo C₁-C₄, pirimidil-alquilo C₁-C₄ u oxadiazolil-alquilo C₁-C₄ (que, a su vez, pueden estar sustituidos con halógeno y alquilo C₁-C₄),

- b representa un número de la serie de 1 y 2,
- E representa fenilo,

5

10

15

20

25

30

- R^4 representa un resto de la serie de halógeno, ciano, alquilo C_1 - C_4 , haloalquilo C_1 - C_4 , alcoxi C_1 - C_4 y haloalcoxi C_1 - C_4 y
 - c representa un número de la serie de 0, 1 y 2.

Se prefieren muy especialmente los nuevos compuestos de la fórmula (I), en la que

- G¹ representa N, CH, C-halógeno, C-ciano, C-CH₃, C-CF₃, C-ciclopropilo, C-OCH₃, C-OCF₃, en especial representa N, CH, C-halógeno,
- 40 R¹ representa hidrógeno, metilo, trifluorometilo, ciclopropilo, halógeno, ciano, metoxi, trifluorometoxi, amino, metilamino, dimetilamino, en especial representa hidrógeno,
 - G² representa A- R²_a o D- R³_b, en la que
 - A representa heterociclilo de la serie de oxazolin-2-ilo, 5,6-dihidro-[1,3,4]-tiadiazin-2-ilo y 5,6-dihidro-[1,3,4]-oxadiazin-2-ilo,
- 45 R² representa un resto de la serie de piridilo y pirimidin-2-ilo, que pueden estar sustituidos con halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄,
 - a representa 0, 1 o 2 y en especial representa 1,
 - D representa un resto heteroarilo de la serie de pirazol-1-ilo, pirazol-3-ilo, pirid-2-ilo, pirid-3-ilo, pirimid-2-ilo, pirimid-4-ilo, tiazol-2-ilo y tiazol-4-ilo,
- Figure 1. Figure 2. Figure 2. Figure 3. Figure

pero dos átomos de oxígeno no deben ser inmediatamente adyacentes, alfa-hidroxiimino-alcoxi C₁-C₄carbonilmetilo, C(X)NR⁵R⁶, (en la que X representa azufre, R⁵ representa hidrógeno y R⁶ representa un resto de la serie de hidrógeno, alquilo C₁-C₅ (en especial metilo, etilo, n-propilo, i-propilo, iso-butilo, terc.-butilo, haloalquilo C_1 - C_4 (en especial CF_3CH_2), ciano-alquilo C_1 - C_4 (en especial $NCCH_2CH(C_2H_5)$, cicloalquilo C_3 - C_6 (en especial ciclopropilo, ciclopentilo, ciclohexilo), cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₄ (en especial ciclopropilmetilo), CH₃OCH₂CH₂CH₂, CH₃OCH₂CHC₂H₅, CH₃CH₂OCH₂CH(CH₃), CH₃CH₂OCH₂CH₂CH₂CH₂, CH₃OC(CH₃)₂, alquil C_1 - C_4 -tio-alguilo C_1 - C_4 (en especial $CH_3SCH_2CH_2$) y fenil-alguilo C_1 - C_4 (en especial $C_6H_5CH(CH_3)$) o X representa azufre u oxígeno y R5 y R6 junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos forman un anillo de 5 a 7 miembros, que dado al caso contiene otro heteroátomo de la serie de NH, NCH₃, NC₂H₅, oxígeno y azufre (en especial R^5 y R^6 representan juntos (CH₂)₄, (CH₂)₅ o (CH₂)₂O(CH₂)₂)), NR⁷R⁸ (en la que R^7 representa hidrógeno o metilo y R^8 representa alcoxi C₁-C₄-carbonil-alquilo C₁-C₄ (en especial CH₂CO₂CH₃) o y R⁸ junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos forman un anillo de 5 o 6 miembros, que puede contener un átomo de oxígeno, por ejemplo, R⁷ y R⁸ representan juntos (CH₂)₄, (CH₂)₅ o (CH₂)₂O(CH₂)₂), los restos de heterociclilo dioxanilo, dioxolanilo, oxatianilo, oxatiolanilo, ditianilo, ditiolanilo, óxido de oxatianilo, óxido de oxatiolanilo, dióxido de oxatianilo, dióxido de oxatiolanilo (en la que en estos restos de heterociclilo dos átomos de H unidos al mismo átomo de C pueden estar reemplazados por =CH2, -CH2-CH2-, -CH2-CH2-CH₂- o -CH₂-CH₂-CH₂-CH₂-), morfolinilo, triazolinonilo, oxazolinilo, dihidrooxadiazinilo, dihidrodioxazinilo, dihidrooxazolilo, dihidrooxazinilo y pirazolinonilo (en especial 1,3-dioxolan-2-ilo, 1,3-dioxan-2-ilo, 1,3-oxatian-2-ilo, 1,3-oxatiolan-2-ilo, 1,3-ditian-2-ilo, 1,3-ditiolan-2-ilo, 4,5-dihidro-1,3-oxazol-2-ilo, 5,6-dihidro-4H-1,3oxazin-2-ilo, 3-óxido de 1,3-oxatianilo, 3-óxido de 1,3-oxatiolanilo, 3,3-dióxido de 1,3-oxatianilo, 3,3-dióxido de 1,3-oxatiolanilo (en la que en estos restos de heterociclilo dos átomos de H unidos al mismo átomo de C pueden estar reemplazados por =CH₂, -CH₂-CH₂-, -CH₂-CH₂- O -CH₂-CH₂-CH₂-CH₂-) y 1,2,4-triazolin-3on-2-ilo) (en la que todos los restos heterociclilo, a su vez, también pueden estar sustituidos con alquilo C₁-C₄ (en especial metilo), haloalquilo C₁-C₄ (en especial CF₃) y alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄ (en especial metoximetilo)), fenilo (que, a su vez, puede estar sustituido con halógeno (en especial flúor, cloro), los restos heteroarilo piridilo, N-óxido de piridilo, pirimidinilo, pirazolilo, tiazolilo, furanilo, tienilo, triazolilo, tetrazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, pirazinilo, triazinilo, e isoquinolinilo (en especial pirid-2-ilo, pirimid-2-ilo, pirimid-4-ilo, pirazol-1-ilo, pirazol-3-ilo, pirazol-5-ilo, 1,2,4-oxadiazol-3-ilo, 1,2,4-triazol-3-ilo, 1,2,3-triazol-1-ilo, 1,2,3-triazol-2-ilo, 1,2,4-tiadiazol-3-ilo, tetrazolilo y 1,2,4-triazin-3-ilo) (que, a su vez, pueden estar sustituidos con halógeno (en especial flúor y cloro), nitro, alquilo C₁-C₄ (en especial metilo, etilo, n-propilo, i-propilo y terc.-butilo), haloalquilo C₁-C₄ (en especial CF₃, CHF₂ y CF₂Cl), alcoxi C₁-C₄ (en especial metoxi, etoxi) y cicloalquilo C₃-C₆ (en especial ciclopropilo, ciclobutilo, ciclopentilo)), los restos de heteroarilalquilo triazolii-alquilo C₁-C₄ (en especial triazolilmetilo), piridil-alquilo C₁-C₄ (en especial piridilmetilo), pirimidinil-alquilo C₁-C₄ (en especial pirimidinilmetilo) u oxadiazolil-alquilo C₁-C₄ (en especial oxadiazolilmetilo (que, a su vez, pueden estar sustituidos con alquilo C₁-C₄ (en especial metilo)) y

b representa 1 o 2 y en especial representa 1.

La invención también se refiere a nuevos compuestos de la fórmula (I), en la que

- G¹ representa N, CH o C-halógeno,
- 40 R¹ representa hidrógeno o alquilo,

5

10

15

20

25

30

35

45

50

55

 G^2 representa A- R^2_a , D- R^3_b o E- R^4_c , en la que

Α representa heterociclilo de la serie de 2-tetrahidrofuranilo, 3-tetrahidrofuranilo, 2-tetrahidrotienilo, 3tetrahidrotienilo, 2-pirrolidinilo, 3-pirrolidinilo, 3-isoxazolidinilo, 4-isoxazolidinilo, 5-isoxazolidinilo, 3-isotiazolidinilo, 4-isotiazolidinilo, 5-isotiazolidinilo, 3-pirazolidinilo, 4-pirazolidinilo, 5-pirazolidinilo, oxazolin-2-ilo, 2-oxazolidinilo, 4-oxazolidinilo, 5-oxazolidinilo, 2-tiazolidinilo, 4-tiazolidinilo, 5-tiazolidinilo, 2-imidazolidinilo, 4imidazolidinilo. 5.6-dihidro-[1.3.4]-oxadiazin-2-ilo. 5.6-dihidro-[1.3.4]-tiadiazin-2-ilo. 5.6-dihidro-[1.4.2]-dioxazin-1,2,4-oxadiazolidin-3-ilo, 1,2,4-oxadiazolidin-5-ilo, 1,2,4-tiadiazolidin-3-ilo, hidroxipiridilo. tiadiazolidin-5-ilo, 1,2,4-triazolidin-3-ilo, 1,3,4-oxadiazolidin-2-ilo, 1,3,4-tiadiazolidin-2-ilo, 1,3,4-triazolidin-2-ilo, 2,3-dihidrofur-2-ilo, 2,3-dihidrofur-3-ilo, 2,4-dihidrofur-2-ilo, 2,3-dihidrotien-2-ilo, 2,3-dihidrotien-3-ilo, 2,4-dihidrotien-2-ilo, 2-pirrolin-3-ilo, 3-pirrolin-2-ilo, 3-pirrolin-3-ilo, 2-isoxazolin-3-ilo, 3-isoxazolin-3-ilo, 3-isoxazolin-3-il ilo, 4-isoxazolin-3-ilo, 2-isoxazolin-4-ilo, 3-isoxazolin-4-ilo, 4-isoxazolin-4-ilo, 2-isoxazolin-5-ilo, 3-isoxazolin-5ilo, 4-isoxazolin-5-ilo, 2-isotiazolin-3-ilo, 3-isotiazolin-3-ilo, 4-isotiazolin-3-ilo, 2-isotiazolin-4-ilo, 3-isotiazolin-4ilo, 4-isotiazolin-4-ilo, 2-isotiazolin-5-ilo, 3-isotiazolin-5-ilo, 4-isotiazolin-5-ilo, 2,3-dihidropirazol-1-ilo, 2,3dihidropirazol-2-ilo, 2,3-dihidropirazol-3-ilo, 2,3-dihidropirazol-4-ilo, 2,3-dihidropirazol-5-ilo, 3,4-dihidropirazol-1-ilo, 3,4-dihidropirazol-3-ilo, 3,4-dihidropirazol-4-ilo, 3,4-dihidropirazol-5-ilo, 4,5-dihidropirazol-1-ilo, 4,5-dihidro dihidropirazol-3-ilo, 4,5-dihidropirazol-4-ilo, 4,5-dihidropirazol-5-ilo, 2,3-dihidrooxazol-2-ilo, 2,3-dihidrooxazol-3-ilo, 2,3-dihidrooxazol-4-ilo, 2,3-dihidrooxazol-5-ilo, 3,4-dihidrooxazol-2-ilo, 3,4-dihidrooxazol-3-ilo, 3,4dihidrooxazol-4-ilo, 3,4-dihidrooxazol-5-ilo, 2-piperidinilo, 3-piperidinilo, 4-piperidinilo, 1,3-dioxan-5-ilo, 2tetrahidropiranilo, 4-tetrahidropiranilo, 2-tetrahidrotienilo, 3-hexahidropiridazinilo, 4-hexahidropiridazinilo, 2hexahidropirimidinilo, 4-hexahidropirimidinilo, 5-hexahidropirimidinilo, 2-piperazinilo, 1,3,5-hexahidro-triazin-2-ilo y 1,2,4-hexahidrotriazin-3-ilo,

- representa un resto de la serie de halógeno, ciano, nitro, alquilo, haloalquilo, cicloalquilo, alcoxi, haloalcoxi, alquiltio, haloalquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, haloalquilsulfinilo, haloalquilsulfonilo, amino, alquilamino, dialquilamino, alquilcarbonilamino, alcoxicarbonilamino, alcoxialquilo, haloalcoxialquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilalquilo, alquilcarbonilo, alcoxicarbonilo, aminocarbonilo, piridilo y pirimidilo, a su vez, también pueden estar sustituidos con halógeno, alquilo, haloalquilo, alcoxi y haloalcoxi),
 - a representa un número de la serie de 0, 1, 2 y 3,
- D representa un resto heteroarilo de la serie de pirrolilo, pirazolilo, imidazolilo, 1,2,3-triazolilo, 1,2,4-triazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, 1,2,3-oxadiazolilo, 1,2,4-oxadiazolilo, 1,3,4-oxadiazolilo, 1,3,4-oxadiazolilo, 1,2,5-oxadiazolilo, 1,2,3-tiadiazolilo, 1,2,4-tiadiazolilo, 1,3,4-tiadiazolilo, 1,2,5-tiadiazolilo, piridilo, benzoisofurilo, benzoisofurilo, benzoisofurilo, benzoisotienilo, indolilo, isoindolilo, indazolilo, benzotiazolilo, benzoisotiazolilo, benzoisoxazolilo, benzoisoxazolilo, benzoisoxazolilo, penzoisoxazolilo, quinazolinilo, quinoxalinilo, naftiridinilo, benzotriazinilo, purinilo, pteridinilo e indolizinilo (en especial pirid-2-ilo, pirid-3-ilo, pirimid-2-ilo, pirimid-4-ilo, imidazolilo, pirazol-1-ilo, pirazol-3-il pirazinilo, 1,2,3-triazinilo, 1,2,4-triazinilo, 1,3,5-triazinilo, tiazol-2-ilo, tiazol-4-il 1,2,4-tiadiazolilo, 1,3,4-tiadiazolilo, 1,2,5-tiadiazolilo, 1,2,3-oxadiazolilo, 1,2,4-oxadiazolilo, 1,3,4-oxadiazolilo, 1,2,5-oxadiazolilo, y oxazolilo),
- R^3 representa un resto de la serie de cicloalquilalquilo, alcoxicarbonilalquilo, alfa-hidroxiimino-alcoxicarbonilalquilo, alfa-alcoxiimino-alcoxicarbonilalquilo, C(X)NR⁵R⁶, (en la que X representa azufre o NOH, 20 R⁵ representa hidrógeno o alquilo y R⁶ representa un resto de la serie de hidrógeno, alquilo, haloalquilo, cianoalquilo, alquinilo, cicloalquilo, cicloalquilalquilo, alcoxialquilo, alcoxicarbonilo, alcoxicarbonilalquilo, alquiltioalquilo, arilo (en especial fenilo), arilalquilo (en especial bencilo) y hetarilalquilo (en especial 2-pirimidilmetilo) o X representa azufre, NOH u oxígeno y R^5 y R^6 junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos forman un anillo, que dado al caso contiene uno o varios otros heteroátomos de la serie de nitrógeno, 25 oxígeno y azufre), NR⁷R⁸ (en la que R⁷ representa hidrógeno o alquilo y R⁸ representa alquinilo, cicloalquilalquilo, alcoxi, haloalcoxi, alcoxicarbonilalquilo, alquiltioalquilo, arilalquilo o hetarilalquilo o R⁷ y R⁸ junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos forman un anillo, que dado al caso contiene uno o varios otros heteroátomos de la serie de nitrógeno, oxígeno y azufre), los restos de heterociclilo dioxanilo, 30 dioxolanilo, morfolinilo, triazolinonilo, oxazolinilo, dihidrooxadiazinilo, dihidrodioxazinilo y pirazolinonilo (que, a su vez, pueden estar sustituidos con alquilo, haloalquilo, alcoxi y alcoxialquilo), fenilo (que, a su vez, puede estar sustituido con halógeno, ciano, nitro, alquilo y haloalquilo), los restos heteroarilo piridilo, N-óxido de piridilo, pirimidilo, imidazolilo, pirazolilo, oxazolilo, tiazolilo, furanilo, tienilo, triazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, pirazinilo, triazinilo, tetrazinilo e isoquinolinilo (que, a su vez, pueden estar sustituidos con halógeno, nitro, alquilo, haloalquilo, alcoxi, haloalcoxi, alcoxialquilo, alquiltio, alquiltioalquilo y cicloalquilo) y los restos de 35 heteroarilalquilo triazolilalquilo, piridilalquilo, pirimidilalquilo y oxadiazolilalquilo (que, a su vez, pueden estar sustituidos con alquilo),
 - b representa un número de la serie de 1, 2 y 3,
 - E representa arilo, en especial fenilo,
- 40 R⁴ representa un resto de la serie de halógeno, ciano, alquilo, haloalquilo, alcoxi, haloalcoxi, dioxolanilo o dihidrodioxazinilo y
 - c representa un número de la serie de 0, 1, 2 y 3,

así como sus sales, complejos metálicos y N-óxidos.

También se prefieren los nuevos compuestos de la fórmula (I), en la que

- 45 G¹ representa N, CH o C-halógeno,
 - R¹ representa hidrógeno o alquilo C₁-C₆ y
 - G^2 representa A- R_a^2 , D- R_b^3 o E- R_c^4 , en la que
 - A representa heterociclilo de la serie de oxazolin-2-ilo, 5,6-dihidro-[1,3,4]-oxadiazin-2-ilo, 5,6-dihidro-[1,3,4]-tiadiazin-2-ilo, 5,6-dihidro-[1,4,2]-dioxazin-3-ilo e hidroxipiridilo,
- 50 R^2 representa un resto de la serie de halógeno, ciano, nitro, alquilo C_1 - C_6 , haloalquilo C_1 - C_6 , cicloalquilo C_3 - C_6 , alcoxi C_1 - C_6 , haloalcoxi C_1 - C_6 , alquil C_1 - C_6 -tio, haloalquil C_1 - C_6 -sulfinilo, haloalquilo C_1 - C_6 -sul

 C_1 - C_6 -carbonilamino, alcoxi C_1 - C_6 -carbonilamino, alcoxi C_1 - C_6 -alquilo C_1 - C_6 , haloalcoxi C_1 - C_6 -alquilo C_1 - C_6 , alquenilo C_2 - C_6 , alquinilo C_2 - C_6 , cicloalquil C_3 - C_6 -alquilo C_1 - C_6 , alquil C_1 - C_6 -carbonilo, alcoxi C_1 - C_6 -carbonilo, aminocarbonilo, piridilo y pirimidilo (en la que piridilo y pirimidilo, a su vez, también pueden estar sustituidos con halógeno, alquilo C_1 - C_6 , haloalquilo C_1 - C_6 , alcoxi C_1 - C_6 y haloalcoxi C_1 - C_6),

5 a representa un número de la serie de 0, 1, 2 y 3,

10

15

20

25

30

35

- representa un resto heteroarilo de la serie de pirrolilo, pirazolilo, imidazolilo, 1,2,3-triazolilo, 1,2,4-triazolilo, D oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, 1,2,3-oxadiazolilo, 1,2,4-oxadiazolilo, 1,3,4-oxadiazolilo, 1,2,5oxadiazolilo, 1,2,3-tiadiazolilo, 1,2,4-tiadiazolilo, 1,3,4-tiadiazolilo, 1,2,5-tiadiazolilo, piridilo, pirimidinilo, piridazinilo, pirazinilo, 1,2,3-triazinilo, 1,2,4-triazinilo, 1,3,5-triazinilo, benzofurilo, benzoisofurilo, benzotienilo, isoindolilo, indolilo, indazolilo. benzotiazolilo, benzoisotiazolilo. benzoxazolilo, benzoisotienilo. benzoisoxazolilo, bencimidazolilo, 2,1,3-benzoxadiazolilo, quinolinilo, isoquinolinilo, cinolinilo, ftalazinilo, quinazolinilo, quinoxalinilo, naftiridinilo, benzotriazinilo, purinilo, pteridinilo e indolizinilo (en especial pirid-2-ilo, pirid-3-ilo, pirimid-2-ilo, pirimid-4-ilo, imidazolilo, pirazol-1-ilo, pirazol-3-il pirazinilo, 1,2,3-triazinilo, 1,2,4triazinilo, 1,3,5-triazinilo, tiazol-2-ilo, tiazol-4-il 1,2,4-tiadiazolilo, 1,3,4-tiadiazolilo, 1,2,5-tiadiazolilo, 1,2,3oxadiazolilo, 1,2,4-oxadiazolilo, 1,3,4-oxadiazolilo, 1,2,5-oxadiazolilo y oxazolilo),
- R^3 representa un resto de la serie de cicloalquil C_3 - C_6 -alquilo C_1 - C_6 , alcoxi C_1 - C_6 -carbonil-alquilo C_1 - C_6 , alfahidroxiimino-alcoxi C₁-C₆-carbonilmetilo, alfa-alcoxi C₁-C₆-imino-alcoxi C₁-C₆-carbonilmetilo, C(X)NR⁵R⁶ (en la que X representa azufre o NOH, R⁵ representa hidrógeno o alquilo C₁-C₆ y R⁶ representa un resto de la serie de hidrógeno, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, ciano-alquilo C₁-C₆, alquinilo C₂-C₆, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-carbonil-alquilo C₁-C₆, alquil C₁-C₆-tioalquilo C_1 - C_6 , fenil-alquilo C_1 - C_6 y hetaril-alquilo C_1 - C_6 , en la que hetarilo representa pirimidilo o X representa azufre, NOH u oxígeno y R^5 y R^6 junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos forman un anillo de 5 a 7 miembros, que puede contener uno o varios otros heteroátomos de la serie de nitrógeno, oxígeno y azufre), NR⁷R⁸ (en la que R⁷ representa hidrógeno o alquilo C₁-C₆ y R⁸ representa un resto de la serie de alquinilo C₂-C₆, cicloalquil C₃-C₆-alquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆-carbonil-alquilo C₁-C₆, alquil C₁-C₆-tio-alquilo C₁-C₆, fenil-alquilo C₁-C₆ y hetaril-alquilo C₁-C₆, en la que hetarilo representa pirimidilo o R⁷ y R⁸ junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos forman un anillo de 5 a 7 miembros, que puede contener otro heteroátomo de la serie de nitrógeno, oxígeno y azufre), los restos de heterociclilo, dioxanilo, dioxolanilo, morfolinilo, triazolinonilo, oxazolinilo, dihidrooxadiazinilo, dihidrodioxazinilo y pirazolinonilo (que, a su vez, pueden estar sustituidos con alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆ y alcoxi C₁-C₆-alquilo C₁-C₆), fenilo (que, a su vez, puede estar sustituido con halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₆ y haloalquilo C₁-C₆), los restos heteroarilo piridilo, N-óxido de piridilo, pirimidilo, imidazolilo, pirazolilo, oxazolilo, tiazolilo, furanilo, tienilo, triazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, pirazinilo, triazinilo, tetrazinilo e isoquinolinilo (que, a su vez, pueden estar sustituidos con halógeno, nitro, alquilo C₁-C₆, haloalquilo C₁-C₆, alcoxi C₁-C₆, haloalcoxi C₁-C₆, alcoxi C_1 - C_6 -alquilo C_1 - C_6 , alquil C_1 - C_6 -tio, alquil C_1 - C_6 -tio-alquilo C_1 - C_6 y cicloalquilo C_3 - C_6) y los restos de heteroarilalquilo triazolil-alquilo C₁-C₆, piridil-alquilo C₁-C₆, pirimidil-alquilo C₁-C₆ y oxadiazolil-alquilo C₁-C₆ (que, a su vez, pueden estar sustituidos con alquilo C₁-C₆),
 - b representa un número de la serie de 1, 2 y 3,
 - E representa fenilo,
- 40 R^4 representa un resto de la serie de halógeno, ciano, alquilo C_1 - C_6 , haloalquilo C_1 - C_6 , alcoxi C_1 - C_6 , haloalcoxi C_1 - C_6 , dioxolanilo y dihidrodioxazinilo y
 - c representa un número de la serie de 0, 1, 2 y 3.

También se prefieren en especial los nuevos compuestos de la fórmula (I), en la que

- G¹ representa N, CH o C-halógeno,
- 45 R¹ representa hidrógeno y
 - G² representa A- R²_a, D- R³_b o E- R⁴_c, en la que
 - A representa heterociclilo de la serie de oxazolin-2-ilo, 5,6-dihidro-[1,3,4]-oxadiazin-2-il 5,6-dihidro-[1,3,4]-tiadiazin-2-ilo y 5,6-dihidro-[1,4,2]-dioxazin-3-ilo,
- representa un resto de la serie de halógeno, ciano, nitro, alquilo C_1 - C_4 , haloalquilo C_1 - C_4 , cicloalquilo C_3 - C_6 , alcoxi C_1 - C_4 , haloalcoxi C_1 - C_4 , alquil C_1 - C_4 -tio, haloalquil C_1 - C_4 -sulfinilo, alquil C_1 - C_4 -sulfinilo, haloalquil C_1 - C_4 -sulfinilo, amino, alquil C_1 - C_4 -amino, di-(alquil C_1 - C_4)amino, alquil C_1 - C_4 -carbonilamino, alcoxi C_1 - C_4 -alquilo C_1 - C_4 , haloalcoxi C_1 - C_4 -alquilo C_1 - C_4 , alquenilo C_2 - C_4 , alquinilo C_2 - C_4 , cicloalquil C_3 - C_6 -alquilo C_1 - C_4 , alquil C_1 - C_4 -carbonilo, aminocarbonilo, piridilo y pirimidilo (en la que piridilo y pirimidilo, a su vez, también pueden estar sustituidos

con halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄),

- a representa un número de la serie de 0, 1, 2 y 3,
- D representa un resto heteroarilo de la serie de pirid-2-ilo, pirid-3-ilo, pirimid-2-ilo, pirimid-4-ilo, imidazolilo, pirazol-1-ilo, pirazol-3-il pirazinilo, 1,2,3-triazinilo, 1,2,4-triazinilo, 1,3,5-triazinilo, tiazol-2-ilo, tiazol-4-ilo, 1,2,4-tiadiazolilo, 1,3,4-tiadiazolilo, 1,2,5-tiadiazolilo, 1,2,3-oxadiazolilo, 1,2,4-oxadiazolilo, 1,3,4-oxadiazolilo, 1,2,5-oxadiazolilo y oxazolilo (en especial pirazol-1-ilo, pirazol-3-ilo, pirid-2-ilo, pirid-3-ilo, pirimid-2-ilo, pirimid-4-ilo, tiazol-2-ilo y tiazol-4-ilo),
- R^3 representa un resto de la serie de cicloalquil C3-C6-alquilo C1-C4, alcoxi C1-C4-carbonil-alquilo C1-C4, alfahidroxiimino-alcoxi C_1 - C_4 -carbonilmetilo, alfa-alcoxi C_1 - C_4 -imino-alcoxi C_1 - C_4 -carbonilmetilo, $C(X)NR^5R^6$, (en la que X representa azufre, R^5 representa hidrógeno o alquilo C_1 - C_4 y R^6 representa un resto de la serie de 10 hidrógeno, alquilo C₁-C₅, haloalquilo C₁-C₄, ciano-alquilo C₁-C₄, alquinilo C₂-C₄, cicloalquilo C₃-C₆, cicloalquil C_3 - C_6 -alquilo C_1 - C_4 , alcoxi C_1 - C_4 -alquilo C_1 - C_4 , alquil C_1 - C_4 -tio-alquilo C_1 - C_4 o fenil-alquilo C_1 - C_4 o Xrepresenta azufre u oxígeno y R5 y R6 junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos forman un anillo de 5 a 7 miembros, que puede contener otro heteroátomo de la serie de nitrógeno, oxígeno y azufre), NR⁷R⁸ (en la que R^7 representa hidrógeno o alquilo C_1 - C_4 y R^8 representa un resto de la serie de alquinilo C_2 - C_4 , cicloalquilo C_3 - C_6 -alquilo C_1 - C_4 , alcoxi C_1 - C_4 , haloalcoxi C_1 - C_4 , alcoxi C_1 - C_4 -carbonil-alquilo C_1 - C_4 , alquilo C_1 - C_4 o fenil-alquilo C_1 - C_4 o R^7 y R^8 junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos forman un 15 anillo de 5 o 6 miembros, que puede contener otro heteroátomo de la serie de oxígeno, azufre y nitrógeno), los restos de heterociclilo dioxanilo, dioxolanilo, morfolinilo, triazolinonilo, oxazolinilo, dihidrooxadiazinilo, dihidrodioxazinilo y pirazolinonilo (en especial, 1,3-dioxolan-2-ilo, 1,3-dioxan-2-ilo y 1,2,4-triazolin-3-on-2-ilo) 20 (que, a su vez, pueden estar sustituidos con alquilo C₁-C₄ y haloalquilo C₁-C₄), fenilo (que, a su vez, puede estar sustituido con halógeno, ciano, nitro, alquilo C₁-C₄ o haloalquilo C₁-C₄), los restos heteroarilo piridilo, Nóxido de piridilo, pirimidilo, imidazolilo, pirazolilo, oxazolilo, tiazolilo, furanilo, tienilo, triazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, pirazinilo, triazinilo, tetrazinilo e isoquinolinilo (que, a su vez, pueden estar sustituidos con halógeno, nitro, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄, haloalcoxi C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄-alquilo C₁-C₄, 25 alquil C₁-C₄-tio, alquil C₁-C₄-tio-alquilo C₁-C₄ y cicloalquilo C₃-C₆) y los restos de heteroarilalquilo triazolilalquilo C_1 - C_4 , piridil-alquilo C_1 - C_4 , pirimidil-alquilo C_1 - C_4 y oxadiazolil-alquilo C_1 - C_4 (que, a su vez, pueden estar sustituidos con alquilo C₁-C₄),
 - b representa un número de la serie de 1 y 2,
- 30 E representa fenilo y

5

- R^4 representa un resto de la serie de halógeno, ciano, alquilo C_1 - C_4 , haloalquilo C_1 - C_4 , alcoxi C_1 - C_4 y haloalcoxi C_1 - C_4 y
- c representa un número de la serie de 0, 1 y 2.

También se prefieren muy especialmente los nuevos compuestos de la fórmula (I), en la que

- 35 G¹ representa N, CH o C-halógeno (en el caso de C-halógeno en especial CF y CI),
 - R¹ representa hidrógeno,
 - G² representa A- R²_a o D- R³_b, en la que
 - A representa heterociclilo de la serie de oxazolin-2-ilo, 5,6-dihidro-[1,3,4]-tiadiazin-2-ilo y 5,6-dihidro-[1,3,4]-oxadiazin-2-ilo.
- 40 R² representa un resto de la serie de piridilo y pirimidin-2-ilo, que pueden estar sustituidos con halógeno, alquilo C₁-C₄, haloalquilo C₁-C₄, alcoxi C₁-C₄ y haloalcoxi C₁-C₄,
 - a representa 0, 1 o 2 y en especial representa 1,
 - D representa un resto heteroarilo de la serie de pirazol-1-ilo, pirazol-3-ilo, pirid-2-ilo, pirid-3-ilo, pirimid-2-ilo, pirimid-4-ilo, tiazol-2-ilo y tiazol-4-ilo,

CH₃CH₂OCH₂CH₂CH₂, CH₃OC(CH₃)₂, alquil C₁-C₄-tio-alquilo C₁-C₄ (en especial CH₃SCH₂CH₂) y fenil-alquilo C₁-C₄ (en especial C₀H₅CH(CH₃) o X representa azufre u oxígeno y R⁵ y R⁰ junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos forman un anillo de 5 a 7 miembros, que dado al caso contiene otro heteroátomo de la serie de nitrógeno, oxígeno y azufre (en especial R^5 y R^6 representan juntos (CH_2)₄, (CH_2)₅ o (CH_2)₂O(CH_2)₂)), NR^7R^8 (en la que R^7 representa hidrógeno o metilo y R^8 representa alcoxi C_1 - C_4 -carbonil-alquilo C_1 - C_4 (en especial CH_2 CO₂ CH_3) o R^7 y R^8 junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos forman un anillo de 5 o 6 miembros, que puede contener un átomo de oxígeno, por ejemplo, R⁷ y R⁸ representan juntos (CH₂)₄, (CH₂)₅ o (CH₂)₂O(CH₂)₂), los restos de heterociclilo dioxanilo, dioxolanilo, morfolinilo, triazolinonilo, oxazolinilo, dihidrooxadiazinilo, dihidrodioxazinilo y pirazolinonil (en especial, 1,3-dioxolan-2-ilo, 1,3-dioxan-2-ilo y 1,2,4triazolin-3-on-2-ilo) (que, a su vez, pueden estar sustituidos con alquilo C_1 - C_4 (en especial metilo) y haloalquilo C_1 - C_4 (en especial C_3), fenilo (que, a su vez, puede estar sustituido con halógeno (en especial flúor y cloro), los restos heteroarilo piridilo, N-óxido de piridilo, pirimidinilo, pirazolilo, tiazolilo, furanilo, tienilo, triazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, pirazinilo, triazinilo, e isoquinolinilo (que, a su vez, pueden estar sustituidos con halógeno (en especial flúor y cloro), nitro, alquilo C₁-C₄ (en especial metilo, etilo, n-propilo, i-propilo y terc.-butilo), haloalquilo C₁-C₄ (en especial CF₃, CHF₂ y CFClH), alcoxi C₁-C₄ (en especial metoxi y etoxi), cicloalquilo C₃-C₆ (en especial ciclopropilo, ciclobutilo y ciclopentilo)), los restos de heteroarilalquilo triazolilalquilo C₁-C₄ (en especial triazolilmetilo), piridil-alquilo C₁-C₄ (en especial piridilmetilo), pirimidinil-alquilo C₁-C₄ (en especial pirimidinilmetilo) u oxadiazolil-alquilo C₁-C₄ (en especial oxadiazolilmetilo (que, a su vez, pueden estar sustituidos con alquilo C₁-C₄ (en especial metilo))

20 b representa 1 o 2 y en especial representa 1.

5

10

15

La cantidad de sustituyentes determinada por a y b puede estar limitada por la cantidad de átomos de hidrógeno sustituibles en los restos A, D y E.

Según la invención, se prefieren los compuestos de la fórmula (I) en los que hay una combinación de los significados mencionados previamente como preferentes.

Según la invención, se prefieren los compuestos de la fórmula (I) en los que hay una combinación de los significados mencionados previamente como de preferencia especial.

Según la invención, se prefieren los compuestos de la fórmula (I) en los que hay una combinación de los significados mencionados previamente como de preferencia muy especial.

En un grupo destacado de nuevos compuestos de la fórmula (I), G¹ representa CH.

30 En otro grupo destacado de nuevos compuestos de la fórmula (I), G¹ representa N.

En otro grupo destacado de nuevos compuestos de la fórmula (I), G¹ representa C-halógeno.

En otro grupo destacado de nuevos compuestos de la fórmula (I), G¹ representa CH y R¹ representa hidrógeno.

En otro grupo destacado de nuevos compuestos de la fórmula (I), G¹ representa N y R¹ representa hidrógeno.

En otro grupo destacado de nuevos compuestos de la fórmula (I), G¹ representa C-halógeno y R¹ representa hidrógeno.

En otro grupo destacado de nuevos compuestos de la fórmula (I). G¹ representa CH y R¹ representa metilo.

En otro grupo destacado de nuevos compuestos de la fórmula (I), G¹ representa N y R¹ representa metilo.

En otro grupo destacado de nuevos compuestos de la fórmula (I), G¹ representa C-halógeno y R¹ representa metilo.

En otro grupo destacado de nuevos compuestos de la fórmula (I), G² representa D- R³_b.

40 En otro grupo destacado de nuevos compuestos de la fórmula (I), G² representa D- R³_b y b representa 1.

Los compuestos de la fórmula (I) pueden estar presentes en función del tipo de sustituyentes como isómeros geométricos y/u ópticamente activos o las correspondientes mezclas isoméricas en distinta composición. La invención se refiere tanto a los isómeros puros como también a las mezclas isoméricas.

La invención también se refiere a sales, N-óxidos y complejos metálicos de los compuestos de la fórmula (I).

A modo ilustrativo y complementario, se explica la preparación de compuestos de la fórmula (I) en los siguientes esquemas de formulación. En este lugar, también se remite a los ejemplos de preparación. Los restos G¹ y G² pueden estar escritos en los esquemas como G₁ y G₂.

Esquema de fórmulas 1

La preparación de compuestos de la fórmula (I) según la invención se realiza a partir de 3-halopiridinas de la fórmula (II), por ejemplo, se obtienen, por reacción de un bromuro de la fórmula (II) con un pirazol de la fórmula (III) en presencia de un catalizador de cobre y una base auxiliar como carbonato de potasio, los compuestos de la fórmula (IV). Véase, por ejemplo, para 3-(4-bromo-pirazol-1-il)-piridina: Journal of Heterocyclic Chemistry 1981, 18, 9-14; European Journal of Organic Chemistry, 2004, 695. A partir de estos pirazoles de la fórmula (IV) se obtienen por reacción con bromo o N-bromosuccinimida los bromuros de la fórmula (V). Véase, por ejemplo, para 3-(4-bromopirazol-1-il)-piridina: Journal of Heterocyclic Chemistry 18, 1981, 9-14. A partir de los bromuros de la fórmula (V), se obtienen por reacción con bis-pinacolato-diboro en presencia de un catalizador de paladio y una base auxiliar los ésteres borónicos de la fórmula (VI). Los compuestos de la fórmula (I) según la invención se pueden obtener a partir de los bromuros de la fórmula (V) o de los halouros de la fórmula (II) por reacción con un compuesto de la fórmula (VII), que representa un componente H-G2, que contiene un N-H, como, por ejemplo, un 3-hetaril-pirazol, en presencia de un catalizador de cobre y una base auxiliar o según el mismo procedimiento por reacción de los bromuros de la fórmula (II) con un pirazol apropiado de la fórmula (IXXX). Además, se pueden obtener las halopiridinas de la fórmula (I) por reacción de los ésteres borónicos de la fórmula (VI) con una dihalopiridina de la fórmula (XXVI) en presencia de un catalizador de paladio y una base auxiliar (reacción de Suzuki). La reacción de las halopiridinas de la fórmula (I) con aminas en presencia de un catalizador de paladio y una base auxiliar proporciona análogamente al procedimiento descrito en Journal of Organic Chemistry 72, 2007, 3606-3607 aquellos compuestos de la fórmula (I) según la invención que llevan en G^2 la correspondiente amina (dppp = 1.3bis(difenilfosfino)propano).

Además, los compuestos de la fórmula (I) según la invención se pueden obtener por reacción de los ésteres borónicos de la fórmula (VI) con un halouro de la fórmula (VIII) en presencia de un catalizador de paladio y una base auxiliar (reacción de Suzuki).

Los compuestos de la fórmula (VII) y (IIX) necesarios son conocidos o se pueden preparar según procedimientos conocidos en principio, véase al respecto las siguientes referencias enumeradas a modo de ejemplo.

La 2-(6-bromo-piridin-2-il)-pirimidina se describe en Tetrahedron Letters, 2000, 1653, un procedimiento de preparación mejorado resulta teniendo en cuenta las observaciones descritas en Tetrahedron Letters 1996, 2537.

Para la dimetilamida del ácido 6-bromo-piridin-2-carboxílico, véase Journal of the Chemical Society, Perkin1, 16, 1996, 1927-1934.

30 Para la (6-bromo-piridin-2-il)-morfolin-4-il-metanona, véase el documento WO 2006/65209.

5

10

15

20

25

Para la 2-bromo-6-pirazol-1-il-piridina, véase Journal of Organic Chemistry, 1990, 4992-4994.

Para el éster terc-butílico del ácido (6-bromo-piridin-2-il)-carbámico, véase Journal of Medicinal Chemistry, 2005, 1886-1900.

Para el éster metílico del ácido [(6-bromo-piridin-2-il)-metil-amino]-acético, véase el documento US 5.008.275.

35 Para la 2-bromo-6-metoxi-piridina, véase Journal of the American Chemical Society 1994, 3657-3658.

Para la 5-(6-bromo-piridin-2-il)-1*H*-pirimidin-2,4-diona, véase Journal of Heterocyclic Chemistry 32, 4, 1995, 1159-1164.

- Para la 2-(1H-pirazol-4-il)-piridina, véase Journal of Medicinal Chemistry, 2004, 4645-4648.
- Para la 3-(1H-pirazol-4-il)-piridina, véase Angewandte Chemie Int. Ed. 2006, 1282-1284.
- Para el perclorato de [(Z)-3-dimetilamino-2-(4-trifluorometil-fenil)-aliliden]-dimetil-amonio, véase Bioorganic and Medicinal Chemistry 2008, 2463-2472.
- 5 Para el perclorato de [(Z)-3-dimetilamino-2-(3-trifluorometil-fenil)-aliliden]-dimetil-amonio, véase Journal of Organic Chemistry 1995, 3750.
 - Para el (Z)-3-hidroxi-2-(4-metoxi-fenil)-propenal, véase Journal of Heterocyclic Chemistry 11, 1974, 51, 52.
 - Para el (Z)-3-hidroxi-2-pirazin-2-il-propenal, véase Tetrahedron Letters 49, 2, 2008, 305-310.
 - Para el (Z)-3-hidroxi-2-piridin-4-il-propenal, véase Tetrahedron Letters 49, 2, 2008, 305-310.
- Para el 4-(4-cloro-fenil)-1*H*-pirazol, véase Synthetic Communications 17, 2, 1987, 165-172 o Journal of Organic Chemistry, 1991, 976; Journal of Heterocyclic Chemistry 28, 1991, 1281-1285.
 - La síntesis de 2-bromo-6-(dimetoximetil)piridina a partir de 6-bromopiridin-2-carbaldehído resulta al tener en cuenta las observaciones descritas en el documento WO 2004/37808.
- La síntesis de 2-bromo-6-(3,5-dimetil-1H-pirazol-1-il)piridina resulta a partir de 6-cloro-2-piridil)hidrazina y 2,4-15 pentadiona teniendo en cuenta los procedimientos descritos en el documento WO 2008/104077.
 - La síntesis de 2-cloro-6-(2,2,2-trifluoretoxi)piridina resulta a partir de 2,6-dicloropiridina teniendo en cuenta los procedimientos descritos en Journal of Fluorine Chemistry 53, 1991 143-153.
 - La síntesis de 2-bromo-5-(1,1-difluoroetil)piridina a partir de 1-(6-bromopiridin-3-il)etanona con trifluoruro de dietilaminoazufre (DAST) resulta teniendo en cuenta las observaciones descritas en el documento WO 2003/93231.
- La 2-(6-bromopiridin-2-il)-4-metil-5-(trifluorometil)-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-ona se puede preparar a partir de 4-metil-5-(trifluorometil)-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-ona por N-arilación catalizada con cobre-diamina. La síntesis se realizó análogamente al procedimiento descrito en Journal of Organic Chemistry 69, 2004, 5578-5587.

Esquema de fórmulas 2:

5

10

15

20

Determinados compuestos de la fórmula (VIII) necesario para el proceso descrito en el esquema de fórmulas 1 del tipo Hal-G² se pueden obtener según el esquema de fórmulas 2 y se pueden convertir en los compuestos de la fórmula (I) según la invención con un grupo R¹³ que forma una parte del grupo R³. La 2,6-dibromopiridina se metaliza, por ejemplo, por reacción con cloruro de isopropilmagnesio, véase al respecto Tetrahedron 2000, 1349; Tetrahedron Letters 1999, 4339; y con un agente de acilación como las dimetilamidas de la fórmula (XXVI) se transforma en las cetonas de la fórmula (VIII). Las dimetilamidas de la fórmula (XXVI) son conocidas o se pueden preparar según procedimientos conocidos en principio, véase por ejemplo, para la 2-metoxi-*N*,*N*-dimetil-acetamida, el documento DE 875807; Journal of Organic Chemistry 1974, 1233.

Según el proceso descrito en el esquema de fórmulas 1, se obtienen de las cetonas de la fórmula (VIII) por reacción con los ésteres borónicos de la fórmula (VI) en una reacción mediada por un metal de transición (por ejemplo, por reacción de Suzuki) las cetonas de la fórmula (I), a partir de las cuales se pueden obtener por reacción con un diol en una catálisis ácida y con extracción de agua los cetales de la fórmula (I), o por reacción con un agente de fluoración como DAST los compuestos de la fórmula (I) fluorados, véase al respecto el documento WO 2003/93231.

La reacción de cetonas de la fórmula (VIII) con un diol bajo catálisis ácida y extracción de agua proporciona los cetales de la fórmula (XXVII), que proporcionan por reacción con los ésteres borónicos de la fórmula (VI) en una reacción mediada por metales de transición (por ejemplo, por reacción de Suzuki) los cetales de la fórmula (I). La reacción de cetonas de la fórmula (VIII) con un agente de fluoración como DAST proporciona los compuestos de la fórmula (XXVIII) fluorados, a partir de los cuales por reacción con los ésteres borónicos de la fórmula (VI) en una reacción mediada por metales de transición (por ejemplo, por reacción de Suzuki) se obtienen los compuestos de la fórmula (I) fluorados, véase al respecto el documento WO 2003/93231.

Esquema de fórmulas 3

5

10

15

Alternativamente al procedimiento descrito en el esquema de fórmulas 1, se pueden obtener los compuestos de la fórmula (I) según la invención también de acuerdo con el esquema de fórmulas 3. El 6-metil-piridin-2-carbonitrilo (IX) se conoce, véase al respecto, por ejemplo, el documento EP 1 424 336 o Chem. Pharm Bull. 7, 1959, 925. Por reacción con dimetilformamida-dimetilacetal se obtiene la enamina (X), véase al respecto el documento US 4.176.183 y Synthesis 1997, 696. Por reacción con cloruro de clorometilen-dimetil-amonio, el reactivo de Vilsmeier, véase al respecto Organic Synthesis, 1987, 121, se obtiene la sal de vinamidinio (XI), véase al respecto, a su vez, Synthesis 1997, 696. Por reacción con piridilhidrazinas de la fórmula (XII), se obtienen de ello los nitrilos de la fórmula (I), una reacción de este tipo se describe en Tetrahedron Letters 1996, 1829. Las piridilhidrazinas de la fórmula (XII) son conocidas o se pueden preparar según procedimientos conocidos en principio, véase por ejemplo, el documento EP 1 426 366 o Liebigs Annalen 486, 1931, 95.

Los nitrilos de la fórmula (I) se hacen reaccionar con sulfuro de amonio, dando las tioamidas de la fórmula (I). A partir de las tioamidas, se obtienen por reacción con hidrazina y glioxal las triazinas de la fórmula (I), véase al respecto Chemische Berichte 101, 1968, 3952-3956; European Journal of Organic Chemistry 1999, 313-321; en el intermedio, se produce la amidrazona, véase al respecto Chemical Reviews 1970, 70(1), 151-170. A partir de las tioamidas de la fórmula (I) se obtienen por reacción con formhidrazidas, véase al respecto Chemische Berichte 1965, 3377, los triazoles de la fórmula (I).

A partir de las tioamidas de la fórmula (I) se pueden obtener por reacción con hidroxilamina los ácidos hidroxámicos de la fórmula (I), véase al respecto Journal of Heterocyclic Chemistry 1980, 819-821; se pueden hacer reaccionar con ortoésteres en los oxodiazoles de la fórmula (I), véase al respecto Journal of Medicinal Chemistry 1994, 2421-2436.

A partir de los nitrilos de la fórmula (I) se pueden obtener por reacción con alcoholato de sodio y cloruro de amonio las amidinas de la fórmula (XXII), a partir de las cuales se pueden obtener, alternativamente al proceso descrito en el esquema de fórmulas 1, por reacción con una sal de vinamidinio de la fórmula (XXIV) las pirimidinas de la fórmula (I). Las sales de vinamidinio de la fórmula (XXIV) necesarias son conocidas o se pueden preparar según procedimientos conocidos en principio, véase al respecto Journal of Organic Chemistry, 1960, 3812; Collect. Czech. Chem. Comm. Vol 61, 1996, 1637.

A partir de los nitrilos de la fórmula (I) se pueden obtener por reacción con un reactivo organometálico de la fórmula (XXV) como, por ejemplo, un compuesto de Gringnard, alternativamente al procedimiento descrito en el esquema de fórmulas 2, las cetonas de la fórmula (I), véase al respecto Journal of Heterocyclic Chemistry 1999, 81 y Journal of Organic Chemistry 1987, 3901. A partir de estas cetonas, se pueden obtener por reacción con dioles en catálisis ácida y extracción de agua los cetales de la fórmula (I).

Esquema de fórmulas 4

15

20

Alternativamente a los procedimientos descritos en los esquemas de fórmulas 1 y 2 se pueden obtener los compuestos de la fórmula (I) según la invención también en forma general de acuerdo con el esquema de fórmulas 4. Para ello, se hacen reaccionar las sales de vinamidinio de la fórmula (XIII) o los dialdehídos o bien los enoladehídos de la fórmula (XIV) con las piridilhidrazinas de la fórmula (XII) en los compuestos de la fórmula (I) según la invención. Los compuestos de la fórmula (XIII) y (XIV) son conocidos o se pueden obtener por medio de procedimientos conocidos en principio, véase al respecto, por ejemplo, Journal of Heterocyclic Chemistry 28, 1991, 1281; Angewandte Chemie 1976, 496.

Esquema de fórmulas 5

Según el esquema de fórmulas 5, se pueden obtener aquellos compuestos de la fórmula (I) según la invención que llevan en el resto G² un pirazol o una pirimidina. Los ácidos pirazolcarboxílicos de la fórmula (XV) son conocidos o se pueden preparar según procedimientos conocidos en principio. A modo de ejemplo, se obtiene ácido 1-(piridin-3-il)-1H-pirazol-4-carboxílico por disociación alcalina de éster del correspondiente éster etílico, cuya preparación se describe en Journal of Organic Chemistry 2004, 5578. Luego se convierten los ácidos de la fórmula (XV) con un agente de cloración como cloruro de tionilo en los correspondientes cloruros de ácido. La posterior reacción con *O,N*-dimetil-hidroxilamina en un agente de dilución como, por ejemplo, diclorometano o tetrahidrofurano y en presencia de una base como, por ejemplo, trietilamina o diisopropiletilamina, lleva a las amidas de la fórmula (XVI), que se pueden convertir por reacción con un compuesto metilmetálico, como cloruro de metilmagnesio, en las cetonas de la fórmula (XVII). Por reacción de los compuestos de la fórmula (XVII) con dimetilformamida-dimetilacetal se obtienen las enaminonas de la fórmula (XVIII), véase al respecto Heterocycles, 43,1, 1996, 221 y Journal of Heterocyclic Chemistry 24, 1987, 837.

A partir de las enaminonas de la fórmula (XVIII) se obtienen por reacción con hidrato de hidrazina en un diluyente como etanol los NH-pirazoles de la fórmula (XIX). Estos pirazoles se pueden convertir con un agente de alquilación o (het)arilación y una base auxiliar como hidruro de sodio en un diluyente como DMF en los pirazoles de la fórmula (I) según la invención.

Por reacción de las enaminonas de la fórmula (XVIII) con amidinas, en presencia de una base auxiliar como etanolato de sodio en un diluyente como etanol, se pueden obtener las pirimidinas de la fórmula (I) según la invención. Las amidinas necesarias son conocidas o se pueden preparar según procedimientos conocidos en principio.

Esquema de fórmulas 6

5

10

15

20

25

Las dihidrooxodiazinas de la fórmula (I) según la invención con un grupo R¹⁴, que forma una parte del grupo R², se obtienen de acuerdo con el esquema de fórmulas 6 haciendo reaccionar primero 2-hidrazinoetanol con un agente de alquilación o (het)arilación R¹⁴-X dando compuestos de la fórmula (XXX), una reacción de este tipo se describe en

Khim. Geterosikl. Soedin 1990, 8, 1065. A partir de ellas se pueden obtener, con ácidos de la fórmula (XV) con ayuda de un reactivo de activación como cloruro de ácido bis(2-oxo-3-oxazolidinil)-fosfínico (BOP-CI) o los correspondientes cloruros de ácido en presencia de una base auxiliar como trietilamina en un diluyente como DMF, las hidrazidas de la fórmula (XXXI), que se pueden convertir, por ejemplo, por reacción de Mitsunobu, tal como se describe en Heterocycles 37, 3, 1994, 1645, en las dihidrooxodiazinas de la fórmula (I) según la invención.

Los siguientes productos intermedios son nuevos y también son objeto de la invención.

Compuestos de la fórmula (VI)

$$\begin{array}{c|c}
N & O-R^9 \\
O-R^{10}
\end{array}$$
(VI)

en la que

5

R⁹ y R¹⁰ representan, de modo independiente, H, alquilo C₁-C₆ (en especial metilo, etilo, propilo e isopropilo) o dado al caso junto con los átomos a los que están unidos forman un anillo que preferentemente no contiene otros heteroátomos y, a su vez, puede estar mono- o polisustituido con alquilo C₁-C₆ (en especial metilo, etilo, propilo, isopropilo).

Compuestos de la fórmula (X)

$$R^{11} \bigvee_{\substack{N \\ R^{12}}} (X)$$

en la que

15

20

25

 R^{11} y R^{12} representan alquilo C_1 - C_6 (en especial metilo, etilo, propilo e isopropilo) o junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos forman un anillo (en especial pirrolidinilo, piperidinilo y morfolinilo).

Compuestos de la fórmula (XI)

$$R^{12}$$
 R^{11}
 N
 N
 N
 N
 N
 N
 N

en la que

 R^{11} y R^{12} representan alquilo C_1 - C_6 (en especial metilo, etilo, propilo e isopropilo) o junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos forman un anillo (en especial pirrolidinilo, piperidinilo, morfolinilo) en forma de sales, en especial de la serie de

- hexafluorofosfato, - perclorato, - clorhidrato, -oxalato y - tetrafluoroborato.

Compuesto de la fórmula

Compuesto de la fórmula

también en forma de sus sales, en especial como clorhidrato y sulfato de amidinio.

Los principios activos conocidos y nuevos según la invención son apropiados para la protección de plantas y órganos vegetales con una buena tolerancia por las plantas, favorable toxicidad en animales de sangre caliente y buena tolerancia por el medio ambiente, para aumentar la producción de la cosecha, mejorar la calidad de la cosecha y para combatir los parásitos animales, en especial insectos, arácnidos, helmintos, nematodos y moluscos, que se presentan en agricultura, en jardinería, en la cría de ganado, en la explotación forestal, en jardines e instalaciones de tiempo libre, en la protección de existencias y materiales, así como en el sector sanitario. Se pueden emplear preferentemente como agentes fitosanitarios. Son activos contra especies sensibles normales y resistentes, así como contra todos o algunos estadios de crecimiento. A los parásitos antes mencionados, pertenecen:

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

De la clase de los Arachnida, por ejemplo, Acarus spp., Aceria sheldoni, Aculops spp., Aculus spp., Amblyomma spp.,
Amphitetranychus viennensis, Argas spp., Boophilus spp., Brevipalpus spp., Bryobia praetiosa, Chorioptes spp.,
Dermanyssus gallinae, Eotetranychus spp., Epitrimerus pyri, Eutetranychus spp., Eriophyes spp., Halotydeus destructor, Hemitarsonemus spp., Hyalomma spp., Ixodes spp., Latrodectus mactans, Metatetranychus spp.,
Nuphersa 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 de los Bivalva, por ejemplo, Dreissena spp.

5

10

25

30

35

50

Del orden de los Chilopoda, por ejemplo, Geophilus spp., Scutigera spp.

Del orden de los Coleoptera, por ejemplo, Acalymma vittatum, Acanthoscelides obtectus, Adoretus spp., Agelastica alni, Agriotes spp., Amphimallon solstitialis, Anobium punctatum, Anoplophora spp., Anthonomus spp., Anthrenus spp., Apion spp., Apogonia spp., Atomaria spp., Attagenus spp., Bruchidius obtectus, Bruchus spp., Cassida spp., Cerotoma trifurcata, Ceutorrhynchus spp., Chaetocnema spp., Cleonus mendicus, Conoderus spp., Cosmopolites spp., Costelytra zealandica, Ctenicera spp., Curculio spp., Cryptorhynchus lapathi, Cylindrocopturus spp., Dermestes spp., Diabrotica spp., Dichocrocis spp., Diloboderus spp., Epilachna spp., Epitrix spp., Faustinus spp., Gibbium psylloides, Hellula undalis, Heteronychus arator, Heteronyx spp., Hylamorpha elegans, Hylotrupes bajulus, Hypera postica, Hypothenemus spp., Lachnosterna consanguinea, Lema spp., Leptinotarsa decemlineata, Leucoptera spp., Lissorhoptrus oryzophilus, Lixus spp., Luperodes spp., Lyctus spp., Megascelis spp., Melanotus spp., Meligethes aeneus, Melolontha spp., Migdolus spp., Monochamus spp., Naupactus xanthographus, Niptus hololeucus, Oryctes rhinoceros, Oryzaephilus surinamensis, Oryzaphagus oryzae, Otiorrhynchus spp., Oxycetonia jucunda, Phaedon cochleariae, Phyllophaga spp., Phyllotreta spp., Popillia japonica, Premnotrypes spp., Psylliodes spp., Ptinus spp., Rhizobius ventralis, Rhizopertha dominica, Sitophilus spp., Sphenophorus spp., Sternechus spp., Zabrus spp., Tanymecus spp., Tenebrio molitor, Tribolium spp., Trogoderma spp., Tychius spp., Xylotrechus spp., Zabrus spp.

Del orden de los Collembola, por ejemplo, Onychiurus armatus.

Del orden de los Diplopoda, por ejemplo, Blaniulus guttulatus.

Del orden de los Diptera, por ejemplo, Aedes spp., Agromyza spp., Anastrepha spp., Anopheles spp., Asphondylia spp., Bactrocera spp., Bibio hortulanus, Calliphora erythrocephala, Ceratitis capitata, Chironomus spp., Chrysomyia spp., Cochliomyia spp., Contarinia spp., Cordylobia anthropophaga, Culex spp., Cuterebra spp., Dacus oleae, Dasyneura spp., Delia spp., Dermatobia hominis, Drosophila spp., Echinocnemus spp., Fannia spp., Gastrophilus spp., Hydrellia spp., Hylemyia spp., Hyppobosca spp., Hypoderma spp., Liriomyza spp. Lucilia spp., Musca spp., Nezara spp., Oestrus spp., Escanilla frit, Pegomyia spp., Phorbia spp., Prodiplosis spp., Psila rosae, Rhagoletis spp., Stomoxys spp., Tabanus spp., Tannia spp., Tetanops spp., Tipula spp.

De la clase de los Gastropoda, por ejemplo, Arion spp., Biomphalaria spp., Bulinus spp., Deroceras spp., Galba spp., Lymnaea spp., Oncomelania spp., Pomacea 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, Diphyllobothrium latum,

Dracunculus medinensis, Echinococcus granulosus, Echinococcus multilocularis, Enterobius vermicularis, Faciola spp., Haemonchus spp., Heterakis spp., Hymenolepis nana, Hyostrongulus spp., Loa Loa, Nematodirus spp., Oesophagostomum spp., Opisthorchis spp., Onchocerca volvulus, Ostertagia spp., Paragonimus spp., Schistosomen spp, Strongyloides fuelleborni, Strongyloides stercoralis, Stronyloides spp., Taenia saginata, Taenia solium, Trichinella spiralis, Trichinella nativa, Trichinella britovi, Trichinella nelsoni, Trichinella pseudopsiralis, Trichostrongulus spp., Trichuris trichuria, Wuchereria bancrofti.

También se pueden combatir protozoos como Eimeria.

10

40

45

50

55

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

Del orden de los Homoptera, por ejemplo, Acyrthosipon spp., Acrogonia spp., Aeneolamia spp., Agonoscena spp., 15 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 helichrysii, Brachycolus spp., Brevicoryne brassicae, Calligypona marginata, Carneocephala fulgida, Ceratovacuna lanigera, Cercopidae, Ceroplastes spp., Chaetosiphon fragaefolii, Chionaspis tegalensis, Chlorita onukii, Chromaphis juglandicola, Chrysomphalus ficus, Cicadulina mbila, Coccomytilus halli, 20 Coccus spp., Cryptomyzus ribis, Dalbulus spp., Dialeurodes spp., Diaphorina spp., Diaspis spp., Drosicha spp., Dysaphis spp., Dysmicoccus spp., Empoasca spp., Eriosoma spp., Erythroneura spp., Euscelis bilobatus, Ferrisia spp., Geococcus coffeae, Hieroglyphus spp., Homalodisca coagulata, Hyalopterus arundinis, Icerya spp., Idiocerus spp., Idioscopus spp., Laodelphax striatellus, Lecanium spp., Lepidosaphes spp., Lipaphis erysimi, Macrosiphum spp., Mahanarva spp., Melanaphis sacchari, Metcalfiella spp., Metopolophium dirhodum, Monellia costalis, Monelliopsis pecanis, Myzus spp., Nasonovia ribisnigri, Nephotettix spp., Nilaparvata lugens, Oncometopia spp., 25 Orthezia praelonga, Parabemisia myricae, Paratrioza spp., Parlatoria spp., Pemphigus spp., Peregrinus maidis, Phenacoccus spp., Phloeomyzus passerinii, Phorodon humuli, Phylloxera spp., Pinnaspis aspidistrae, Planococcus spp., Protopulvinaria pyriformis, Pseudaulacaspis pentagona, Pseudococcus spp., Psylla spp., Pteromalus spp., Pyrilla spp., Quadraspidiotus spp., Quesada gigas, Rastrococcus spp., Rhopalosiphum spp., Saissetia spp., Scaphoides titanus, Schizaphis graminum, Selenaspidus articulatus, Sogata spp., Sogatella furcifera, Sogatodes 30 spp., Stictocephala festina, Tenalaphara malayensis, Tinocallis caryaefoliae, Tomaspis spp., Toxoptera spp., Trialeurodes spp., Trioza spp., Typhlocyba spp., Unaspis spp., Viteus vitifolii, Zygina spp.

Del orden de los Hymenoptera, por ejemplo, Athalia spp., Diprion spp., Hoplocampa spp., Lasius spp., Monomorium pharaonis, Vespa spp.

35 Del orden de los Isopoda, por ejemplo, Armadillidium vulgare, Oniscus asellus, Porcellio scaber.

Del orden de los Isoptera, por ejemplo, Acromyrmex spp., Atta spp., Cornitermes cumulans, Microtermes obesi, Odontotermes spp., Reticulitermes spp,

Del orden de los Lepidoptera, por ejemplo, Acronicta major, Adoxophyes spp., Aedia leucomelas, Agrotis spp., Alabama spp., Amyelois transitella, Anarsia spp., Anticarsia spp., Argyroploce spp., Barathra brassicae, Borbo cinnara, Bucculatrix thurberiella, Bupalus piniarius, Busseola spp., Cacoecia spp., Caloptilia theivora, Capua reticulana, Carpocapsa pomonella, Carposina niponensis, Cheimatobia brumata, Chilo spp., Choristoneura spp., Clysia ambiquella, Cnaphalocerus spp., Cnephasia spp., Conopomorpha spp., Conotrachelus spp., Copitarsia spp., Cydia spp., Dalaca noctuides, Diaphania spp., Diatraea saccharalis, Earias spp., Ecdytolopha aurantium, Elasmopalpus lignosellus, Eldana saccharina, Ephestia kuehniella, Epinotia spp., Epiphyas postvittana, Etiella spp., Eulia spp., Eupoecilia ambiguella, Euproctis spp., Euxoa spp., Feltia spp., Galleria mellonella, Gracillaria spp., Grapholitha spp., Hedylepta spp., Helicoverpa spp., Heliothis spp., Hofmannophila pseudospretella, Homoeosoma spp., Homona spp., Hyponomeuta padella, Kakivoria flavofasciata, Laphygma spp., Laspeyresia molesta, Leucinodes orbonalis, Leucoptera spp., Lithocolletis spp., Lithophane antennata, Lobesia spp., Loxagrotis albicosta, Lymantria spp., Lyonetia spp., Malacosoma neustria, Maruca testulalis, Mamestra brassicae, Mocis spp., Mythimna separata, Nymphula spp., Oiketicus spp., Oria spp., Orthaga spp., Ostrinia spp., Oulema oryzae, Panolis flammea, Parnara spp., Pectinophora spp., Perileucoptera spp., Phthorimaea spp., Phyllocnistis citrella, Phyllonorycter spp., Pieris spp., Platynota stultana, Plusia spp., Plutella xylostella, Prays spp., Prodenia spp., Protoparce spp., Pseudaletia spp., Pseudoplusia includens, Pyrausta nubilalis, Rachiplusia nu, Schoenobius spp., Scirpophaga spp., Scotia segetum, Sesamia spp., Sparganothis spp., Spodoptera spp., Stathmopoda spp., Stomopteryx subsecivella, Synanthedon spp., Tecia solanivora, Thermesia gemmatalis, Tinea pellionella, Tineola bisselliella, Tortrix spp., Trichoplusia spp., Tuta absoluta, Virachola spp.

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

gregaria.

10

15

20

25

40

45

50

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

Del orden de los Symphyla, por ejemplo, Scutigerella spp.

Del orden de los Thysanoptera, por ejemplo, Anaphothrips obscurus, Baliothrips biformis, Drepanothris reuteri, 5 Enneothrips flavens, Frankliniella spp., Heliothrips spp., Hercinothrips femoralis, Rhipiphorothrips cruentatus, Scirtothrips spp., Taeniothrips cardamoni, Thrips spp.

Del orden de los Thysanura, por ejemplo, Lepisma saccharina.

A los nematodos parásitos pertenecen, por ejemplo, Aphelenchoides spp., Bursaphelenchus spp., Ditylenchus spp., Globodera spp., Heterodera spp., Longidorus spp., Meloidogyne spp., Pratylenchus spp., Radopholus similis, Trichodorus spp., Tylenchulus semipenetrans, Xiphinema spp.

Los compuestos según la invención se pueden usar dado al caso en determinadas concentraciones o bien cantidades de aplicación también como herbicidas, protectores, reguladores del crecimiento o agentes para mejorar las propiedades de las plantas, o como microbicidas, por ejemplo, como fungicidas, antimicóticos, bactericidas, viricidas (incluyendo agentes contra virioides) o como agentes contra MLO (organismo tipo micoplasma) y RLO (organismo tipo Rickettsia). También se pueden usar dado al caso como productos intermedios o precursores para la síntesis de otros principios activos.

Los principios activos se pueden convertir en las formulaciones usuales, tales como soluciones, emulsiones, polvos para pulverización, suspensiones a base de agua y aceite, polvos, productos de espolvoreo, pastas, polvos solubles, granulados solubles, granulados para dispersión, concentrados de suspensión—emulsión, sustancias naturales impregnadas de principio activo, sustancias sintéticas impregnadas de principio activo, fertilizantes, así como encapsulaciones finas en sustancias poliméricas.

Estas formulaciones se preparan de manera conocida, por ejemplo, por mezcla de los principios activos con extensores, es decir, disolventes líquidos y/o vehículos sólidos, dado al caso usando agentes tensioactivos, es decir, emulsionantes y/o dispersantes y/o agentes generadores de espuma. La preparación de las formulaciones se realiza ya sea en instalaciones apropiadas o también antes o durante la aplicación.

Como coadyuvantes se pueden usar aquellas sustancias que son apropiadas para otorgar al agente en sí y/o a preparaciones derivadas de él (por ejemplo, caldos de pulverización, desinfectantes de simientes) propiedades particulares, tales como determinadas propiedades técnicas y/o también propiedades biológicas especiales. Como coadyuvantes típicos se tienen en cuenta: extensores, disolventes y vehículos.

Como extensores son apropiados, por ejemplo, agua, líquidos químicos orgánicos polares y no polares, por ejemplo, de las clases de los hidrocarburos aromáticos y no aromáticos (como parafinas, alquilbencenos, alquilnaftalinas, clorobencenos), alcoholes y polioles (que dado al caso también pueden estar sustituidos, eterificados y/o esterificados), cetonas (como acetona, ciclohexanona), ésteres (también grasas y aceites) y (poli–)éteres, aminas simples y sustituidas, amidas, lactamas (como N–alquilpirrolidonas) y lactonas, sulfonas y sulfóxidos (como dimetilsulfóxido).

En caso de usar agua como extensor, también se pueden usar, por ejemplo, disolventes orgánicos como disolventes coadyuvantes. Como disolventes líquidos se tienen en cuenta esencialmente: sustancias aromáticas tales como xileno, tolueno o alquilnaftalenos, sustancias aromáticas cloradas e hidrocarburos alifáticos clorados, tales como clorobencenos, cloroetilenos o cloruro de metileno, hidrocarburos alifáticos, tales como ciclohexano o parafinas, por ejemplo, fracciones de petróleo, aceites minerales y vegetales, alcoholes, tales como butanol o glicol, así como sus éteres y ésteres, cetonas como acetona, metiletilcetona, metilisobutilcetona o ciclohexanona, disolventes fuertemente polares como dimetilsulfóxido, así como agua.

Como vehículos sólidos, se tienen en cuenta:

por ejemplo, sales de amonio y polvos minerales naturales tales como caolines, arcillas, talco, creta, cuarzo, atapulgita, montmorileonita o tierra de diatomeas y polvos minerales sintéticos tales como ácido silícico muy disperso, óxido de aluminio y silicatos, como vehículos sólidos para granulados se tienen en cuenta: por ejemplo, rocas naturales rotas y fraccionadas tales como calcita, mármol, piedra pómez, sepiolita, dolomita, así como granulados sintéticos de polvos inorgánicos y orgánicos, así como granulados de material orgánico como papel, aserrín, cáscaras de coco, mazorcas de maíz y tallos de tabaco; como agentes emulsionantes y/o generadores de espuma se tienen en cuenta: por ejemplo, emulsionantes no ionógenos e inorgánicos, como ésteres de ácido graso de polioxietileno, éter de alcohol graso de polioxietileno, por ejemplo, éter de alquilaril—poliglicoléeter, sulfonatos de alquilo, sulfatos de alquilo, sulfonatos de arilo, así como hidrolizados de albúmina; como dispersantes, se tienen en cuenta sustancias no iónicas y/o iónicas, por ejemplo, de las clases de éter de alcohol—POE y/o éter de POP, éster de ácido y/o de POP—POE, éter de alquil—aril— y/o POP—POE, aductos

grasos y/o de POP-POE, derivados de POE- y/o POP-poliol, aductos de POE- y/o POP-sorbitano o de azúcar, sulfatos, sulfonatos y fosfatos de alquilo o arilo o los correspondientes aductos de PO-éter. Además, oligo- o polímeros apropiados, por ejemplo, partiendo de monómeros vinílicos, de ácido acrílico, de EO y/o PO solo o en combinación con, por ejemplo, (poli-)alcoholes o (poli-)aminas. También se pueden usar lignina y sus derivados de ácido sulfónico, celulosas simples y modificadas, ácidos sulfónicos aromáticos y/o alifáticos, así como sus aductos con formaldehído.

Se pueden usar en las formulaciones adhesivos como carboximetilcelulosa, polímeros naturales y sintéticos, pulverulentos, granulados o en forma de látex, como goma arábiga, alcohol polivinílico, acetato de polivinilo, así como fosfolípidos naturales como cefalina y lecitina, y fosfolípidos sintéticos.

- Se pueden usar colorantes como pigmentos inorgánicos, por ejemplo, óxido de hierro, óxido de titanio, azul de Prusia y colorantes orgánicos como colorantes de alizarina, azoicos y de metaloftalocianina y oligonutrientes tales como sales de hierro, de manganeso, de boro, de cobre, de cobalto, de molibdeno y de cinc. Otros aditivos pueden ser aromatizantes, aceites minerales o vegetales dado al caso modificados, ceras y nutrientes (también oligonutrientes), como sales de hierro, de manganeso, de boro, de cobre, de cobalto, de molibdeno y de cinc.
- También pueden estar contenidos estabilizantes como estabilizantes al frío, conservantes, agentes oxidantes, agentes fotoprotectores u otros agentes que mejoran la estabilidad química y / o física.

Las formulaciones contienen en general entre el 0.01 y el 98 % en peso de principio activo, preferentemente entre el 0.5 y el 90 %.

Los principios activos según la invención se pueden usar como tales o en sus formulaciones también en mezcla con uno o varios fungicidas, bactericidas, acaricidas, nematicidas, insecticidas, microbicidas, fertilizantes, atrayentes, esterilizantes, sinergistas, protectores, productos semioquímicos y/o reguladores del crecimiento de las plantas apropiados, a fin de ampliar de esta manera, por ejemplo, el espectro de acción, prolongar la acción, elevar la velocidad de acción, evitar la repelencia o prevenir el desarrollo de resistencias. Además, estas combinaciones pueden mejorar el crecimiento de las plantas, aumentar la tolerancia a altas o bajas temperaturas, contra sequía o contenido salino en aguas o suelos, aumentar el rendimiento de la florescencia, facilitar la cosecha y el rendimiento de la cosecha, acelerar la maduración, aumentar la calidad y/o el valor nutricional de los productos de la cosecha, prolongar la capacidad de almacenamiento y/o mejorar la procesabilidad de los productos cosechados. Por lo general, por combinación de los principios activos según la invención con asociados de mezcla, se obtienen efectos sinérgicos, es decir, la eficacia de cada mezcla es mayor que lo que era de esperar en virtud de la eficacia de cada uno de los componentes. En general, las combinaciones se pueden usar tanto en aplicaciones en simientes como también en premezclas, mezclas en tanque o mezclas listas para usar.

Los asociados de mezcla particularmente favorables son, por ejemplo, los siguientes:

Insecticidas / acaricidas / nematicidas:

5

20

25

30

35

40

45

Los principios activos mencionados en el presente documento con su "nombre común" son conocidos y se describen, por ejemplo, en el manual de pesticidas ("The Pesticide Manual" 14th Ed., British Crop Protection Council 2006) o se pueden buscar en Internet (por ejemplo, http://www.alanwood.net/pesticides).

- (1) Inhibidores de la acetilcolinesterasa (AChE) tales como, por ejemplo,
- carbamatos, por ejemplo, alanicarb, aldicarb, bendiocarb, benfuracarb, butocarboxim, butoxicarboxim, carbarilo, carbofurano, carbosulfano, etiofencarb, fenobucarb, formetanato, furatiocarb, isoprocarb, metiocarb, metomilo, metolcarb, oxamilo, pirimicarb, propoxur, tiodicarb, tiofanox, triazamato, trimetacarb, XMC y xililcarb; u
- organofosfatos, por ejemplo, acefato, azametifos, azinfos (-metilo, -etilo), cadusafos, cloroetoxifos, clorofenvinfos, cloromefos, cloropirifos (-metilo), coumafos, cianofos, demetona-S-metilo, diazinona, diclorvos/DDVP, dicrotofos, dimetoato, dimetilvinfos, disulfotona, EPN, etiona, etoprofos, fanfur, fenamifos, fenitrotion, fentiona, fostiazato, heptenofos, isofenfos, *O*-(metoxiaminotio-fosforil)salicilato de isopropilo, isoxationa, malationa, mecarbam, metamidofos, metidationa, mevinfos, monocrotofos, naled, ometoato, oxidemetona-metilo, parationa (-metilo), fentoato, forato, fosalona, fosmet, fosfamidona, foxim, pirimifos (-metilo), profenofos, propetanfos, protiofos, piraclofos, piridafentiona, quinalfos, sulfotep, tebupirimfos, temefos, terbufos, tetraclorvinfos, tiometona, triazofos, triclorfona y vamidotiona.
- (2) antagonistas del canal de cloruro controlado por GABA tales como, por ejemplo,
- organoclorados, por ejemplo, clorodano y endosulfano (alfa-); o
 - fiproles (fenilpirazoles), por ejemplo, etiprol, fipronilo, pirafluprol y piriprol.
 - (3) moduladores del canal de sodio / bloqueadores del canal de sodio dependientes del voltaje tales como, por

ejemplo,

5

25

30

35

piretroides, por ejemplo, acrinatrina, aletrina (d-cis-trans, d-trans), vicentina, bioaletrina, bioaletrina, bioaletrina, ciclopentenilo, bioresmetrina, cicloprotrina, ciflutrina (beta-), cihalotrina (gamma-, lambda-), cipermetrina (alfa-, beta-, teta-, zeta-), cifenotrina [isómeros (1R)-trans], deltametrina, dimeflutrina, empentrina [isómeros (EZ)-(1R)], esfenvalerato, etofenprox, fenpropatrina, fenvalerato, flucitrinato, flumetrina, fluvalinato (tau-), halfenprox, imiprotrina, metoflutrina, permetrina, fenotrina [isómero (1R)-trans], praletrina, proflutrina, piretrina (piretro), resmetrina, RU 15525, silafluofeno, teflutrina, tetrametrina [isómeros (1R)], tralometrina, transflutrina y ZXI 8901; DDT; o metoxicloro.

- (4) agonistas del receptor nicotinérgico de acetilcolina tales como, por ejemplo,
- neonicotinoides, por ejemplo, acetamiprida, clotianidina, dinotefurano, imidacloprida, nitenpiram, tiacloprida, tiametoxam; o nicotina.
 - (5) moduladores alostéricos del receptor de acetilcolina (agonistas) tales como, por ejemplo, espinosinas, por ejemplo, espinetoram y espinosad.
 - (6) activadores del canal de cloruro tales como, por ejemplo,
- 15 avermectina/milbemicina, por ejemplo, abamectina, benzoato de emamectina, lepimectina y milbemectina.
 - (7) análogos de la hormona juvenil, por ejemplo, hidropreno, quinopreno, metopreno; o fenoxicarb; piriproxifeno.
 - (8) principios activos con mecanismos de acción desconocidos o no específicos tales como, por ejemplo, agentes de gasificación, por ejemplo, bromuro de metilo y otros halouros de alquilo; o cloropicrina; fluoruro de sulfurilo; bórax; tártaro emético.
- 20 (9) agentes antinutritivos selectivos, por ejemplo, pimetrozina; o flonicamida.
 - (10) inhibidores del crecimiento de ácaros, por ejemplo, clofentezina, diflovidazina, hexitiazox, etoxazol.
 - (11) disruptores microbianos de la membrana intestinal de los insectos tales como, por ejemplo, *Bacillus thuringiensis* subespecie *israelensis*, *Bacillus sphaericus*, *Bacillus thuringiensis* subespecies *aizawai*, *Bacillus thuringiensis* subespecies *kurstaki*, *Bacillus thuringiensis* subespecie *tenebrionis*, y proteínas de plantas BT, por ejemplo, Cry1Ab, Cry1Ac, Cry1Fa, Cry2Ab, mCry3A, Cry3Ab, Cry3Bb, Cry34/35Ab1.
 - (12) inhibidores de la fosforilación oxidativa, disruptores de ATP tales como, por ejemplo, diafentiurona; o compuestos de organoestaño, por ejemplo, azociclotina, cihexatina, óxido de fenbutatina; o propargita; tetradifona.
 - (13) desacopladores de la fosforilación oxidativa por interrupción del gradiente de H-protones tales como, por ejemplo, clorofenapir y DNOC.
 - (14) antagonistas nicotinérgicos del receptor de acetilcolina tales como, por ejemplo, bensultap, cartap (clorhidrato), tiocilam y tiosultap (sodio).
 - (15) inhibidores de la biosíntesis de quitina, tipo 0, tales como, por ejemplo, benzoilureas, por ejemplo, bistriflurona, clorofluazurona, diflubenzurona, flucicloxurona, flufenoxurona, hexaflumurona, lufenurona, novalurona, noviflumurona, teflubenzurona y triflumurona.
 - (16) inhibidores de la biosíntesis de quitina, tipo 1, tales como, por ejemplo, buprofezina.
 - (17) principios activos que perturban la muda tales como, por ejemplo, ciromazina.
 - (18) agonistas/disruptores de ecdisona como, por ejemplo, diacilhidrazinas, por ejemplo, cromafenozida, halofenozida, metoxifenozida y tebufenozida.
- 40 (19) agonistas octopaminérgicos tales como, por ejemplo, amitraz.
 - (20) inhibidores del transporte de electrones complejo III tales como, por ejemplo, hidrametilnona; acequinocilo; fluacripirim.

- (21) inhibidores del transporte de electrones complejo I, por ejemplo, del grupo de los METI-acaricidas, por ejemplo, fenazaquina, fenpiroximato, pirimidifeno, piridabeno, tebufenpirad, tolfenpirad; o rotenona (Derris).
- (22) bloqueadores del canal de sodio dependientes del voltaje, por ejemplo, indoxacarb; metaflumizona.
- (23) inhibidores de la acetil-CoA-carboxilasa tales como, por ejemplo, derivados de ácido tetrónico, por ejemplo, espirodiclofeno y espiromesifeno; o derivados de ácido tetrámico, por ejemplo, espirotetramato.
- (24) inhibidores del transporte de electrones complejo IV tales como, por ejemplo, fosfinas, por ejemplo, fosfuro de aluminio, fosfuro de calcio, fosfina, fosfuro de zinc; o cianuro.
- (25) inhibidores del transporte de electrones complejo II tales como, por ejemplo, cienopirafeno.
- (28) efectores del receptor de rianodina tales como, por ejemplo, diamidas, por ejemplo, cloroantraniliprol (Rinaxipir), ciantraniliprol (ciazipir) y flubendiamida.

Otros principios activos con mecanismo de acción desconocido tales como, por ejemplo, azadiractina, amidoflumet, benzoximato, bifenazato, quinometionato, criolita, ciflumetofeno, dicofol, fluensulfona (5-cloro-2-[(3,4,4-trifluorobut-3-en-1-il)sulfonil]-1,3-tiazol), flufenerim, piridalilo y pirifluquinazona; además, preparados a base de Bacillus firmus (I-1582, BioNeem, Votivo) así como los siguientes compuestos activos conocidos

15 4-{[(6-bromopirid-3-il)metil](2-fluoroetil)amino}furan-2(5H)-ona (conocida del documento WO 2007/115644), 4-{[(6-bromopirid-3-il)metil](2fluoropirid-3-il)metil](2,2-difluoroetil)amino}furan-2(5H)-ona (conocida del documento WO 2007/115644), 4-{[(2-cloro-1,3-tiazol-5-il)metill(2-fluoroetil)amino}furan-2(5H)-ona (conocida del documento WO 2007/115644), 4-{[(6-cloropirid-3-il)metil](2-fluoroetil)amino}furan-2(5H)-ona (conocida del documento WO 2007/115644), 4-{[(6-cloropirid-3il)metil](2,2-difluoroetil)amino}furan-2(5H)-ona (conocida del documento WO 2007/115644), 4-{(6-cloro-5-fluorpirid-3il)metil](metil)amino}furan-2(5H)-ona (conocida del documento WO 2007/115643), 4-{[(5,6-dicloropirid-3-il)metil](2-20 fluoroetil)amino}furan-2(5H)-ona (conocida del documento WO 2007/115646), 4-{[(6-cloro-5-fluoropirid-3il)metil](ciclopropil)amino}furan-2(5H)-ona (conocida del documento WO 2007/115643), 4-{[(6-cloropirid-3il)metill(ciclopropil)amino)furan-2(5H)-ona documento EP-A-0 539 588). (conocida del 4-{[(6-cloropirid-3il)metil](metil)amino}furan-2(5H)-ona (conocida del documento EP-A-0 539 588). [(6-cloropiridin-3il)metil](metil)oxido-λ⁴-sulfanilidencianamida (conocida del documento WO 2007/149134), [1-(6-cloropiridin-3-25 il)etil](metil)oxido-λ⁴-sulfanilidencianamida (conocida del documento WO 2007/149134) y sus diastereómeros (A) y (B)

(asimismo conocidos del documento WO 2007/149134), [(6-trifluorometilpiridin-3-il)metil](metil)oxido-λ⁴-sulfanilidencianamida (conocida del documento WO 2007/095229), sulfoxaflor (también conocido del documento WO 2007/149134), 11-(4-cloro-2,6-dimetilfenil)-12-hidroxi-1,4-dioxa-9-azadeispiro[4.2.4.2]tetradec-11-en-10-ona (conocida del documento WO 2006/089633), 3-(4'-fluoro-2,4-dimetilbifenil-3-il)-4-hidroxi-8-oxa-1-azaespiro[4.5]dec-3-en-2-ona (conocida del documento WO 2008/067911) y 1-[2-fluoro-4-metil-5-[(2,2,2-trifluoroetil)sulfinil]fenil]-3-(trifluorometil)-1H-1,2,4-triazol-5-amina (conocida del documento WO 2006/043635).

Fungicidas

30

35

40

45

5

10

(1) inhibidores de la biosíntesis de ergosterol tales como, por ejemplo, aldimorf, azaconazol, bitertanol, bromouconazol, ciproconazol, diclobutrazol, difenoconazol, diniconazol, diniconazol-M, dodemorf, acetato de dodemorf, epoxiconazol, etaconazol, fenarimol, fenbuconazol, fenhexamida, fenpropidina, fenpropimorf, fluquinconazol, flurprimidol, flusilazol, flutriafol, furconazol, furconazol-cis, hexaconazol, imazalilo, sulfato de imazalilo, imibenconazol, ipconazol, metconazol, miclobutanilo, naftifina, nuarimol, oxpoconazol, paclobutrazol, pefurazoat, penconazol, piperalina, procloraz, propiconazol, protioconazol, piributicarb, pirifenox, quinconazol, simeconazol, espiroxamina, tebuconazol, terbinafina, tetraconazol, triadimefona, triadimenol, tridemorf, triflumizol, triforina, triticonazol, uniconazol, uniconazol-p, viniconazol, voriconazol, 1-(4-clorofenil)-2-(1H-1,2,4-triazol-1-il)cicloheptanol, 1-(2,2-dimetil-2,3-dihidro-1H-inden-1-il)-1H-imidazol-5-carboxilato de metilo, N'-{5-(difluorometil)-2-metil-4-[3-(trimetilsilil)propoxi]fenil}-N-etil-N-metilimidoformamida, N-etil-N-metil-N'-{2-metil-5-(trifluorometil)-4-[3-(trimetilsilil)propoxi]fenil}-inidazol-1-carbotioato.

(2) inhibidores de la respiración (inhibidores de la cadena respiratoria) tales como, por ejemplo, bixafeno, boscalida, carboxina, diflumetorim, fenfuram, fluopiram, flutolanilo, fluxapiroxad, furametpir, furmeciclox, isopirazam mezcla del racemato sin-epimérico 1RS,4SR,9RS y del racemato anti-epimérico 1RS,4SR,9SR, isopirazam (racemato anti-epimérico), isopirazam (enantiómero anti-epimérico 1R,4S,9S), isopirazam (enantiómero anti-epimérico 1S,4R,9R), isopirazam (racemato sin-epimérico 1RS,4SR,9RS), isopirazam (enantiómero sin-epimérico 1S,4R,9S), mepronilo, oxicarboxina, penflufeno, pentiopirad, sedaxano, tifluzamida, 1-metil-N-[2-(1,1,2,2-tetrafluoretoxi)fenil]-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-4-carboxamida, 3-(difluorometil)-1-metil-N-[2-(1,1,2,2-tetrafluoretoxi)fenil]-1H-pirazol-4-carboxamida y N-[1-(2,4-diclorofenil)-1-metoxipropan-2-il]-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida.

5

10

15

20

35

- (3) inhibidores de la respiración (inhibidores de la cadena respiratoria) en la cadena de respiración compleio III tales como, por ejemplo, ametoctradina, amisulbromo, azoxistrobina, ciazofamida, dimoxistrobina, enestroburina, famoxadona, fenamidona, fluoxastrobina, cresoxim-metilo, metominostrobina, orisastrobina, picoxistrobina, piraclostrobina, pirametostrobina, piraoxistrobina, piribencarb, trifloxistrobina, (2E)-2-(2-{[6-(3cloro-2-metilfenoxi)-5-fluorpirimidin-4-il]oxi}fenil)-2-(metoxiimino)-N-metiletanamida, (2E)-2-(metoxiimino)-Nmetil-2-(2-{[({(1E)-1-[3-(trifluorometil)fenil]etiliden}amino)oxi]metil}fenil)etanamida, (2E)-2-(metoxiimino)-N-metil-2-{2-[(E)-({1-[3-(trifluorometil)fenil]etoxi}imino)metil]fenil}etanamida, (2E)-2-{2-[({[(1E)-1-(3-{[(E)-1-fluoro-2feniletenil]oxi}fenil)etiliden]amino}oxi)metil]fenil}-2-(metoxiimino)-N-metiletanamida, (2E)-2-{2-[({[(2E,3E)-4-(2,6-(2E)-4-(2E) diclorofenil)but-3-en-2-iliden|amino}oxi)metil]fenil}-2-(metoxiimino)-N-metiletanamida, 2-cloro-N-(1,1,3-trimetil-2,3-dihidro-1H-inden-4-il)piridin-3-carboxamida. 5-metoxi-2-metil-4-(2-{[({(1E)-1-[3-(trifluorometil)fenil]etiliden}amino)oxi]metil}fenil)-2,4-dihidro-3H-1,2,4-triazol-3-on, metil-(2E)-2-{2-[({ciclopropil[(4-metoxifenil)imino|metil}sulfanil)metil]fenil}-3-metoxiprop-2-enoat, N-(3-etil-3,5,5trimetilciclohexil)-3-(formilamino)-2-hidroxibenzamida, 2-{2-[(2,5-dimetilfenoxi)metil]fenil}-2-metoxi-Nmetilacetamida y (2R)-2-{2-[(2,5-dimetilfenoxi)metil]fenil}-2-metoxi-N-metilacetamida.
- (4) inhibidores de la mitosis y la división celular tales como, por ejemplo, benomilo, carbendazim, clorofenazol, dietofencarb, etaboxam, fluopicolida, fuberidazol, pencicurona, tiabendazol, tiofanato-metilo, tiofanato, zoxamida, 5-cloro-7-(4-metilpiperidin-1-il)-6-(2,4,6-trifluorofenil)[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidina y 3-cloro-5-(6-cloropiridin-3-il)-6-metil-4-(2,4,6-trifluorofenil)piridazina.
- (5) compuestos con actividad multisitio tales como, por ejemplo, mezcla de Bordeaux, captafol, captano, clorotalonilo, preparaciones de cobre tales como hidróxido de cobre, naftenato de cobre, óxido de cobre, oxicloruro de cobre, sulfato de cobre, diclofluanida, ditianona, dodina, base libre de dodina, ferbam, fluorofolpet, folpet, guazatina, acetato de guazatina, iminoctadina, albesilato de iminoctadina, triacetato de iminoctadina, cobre Man, mancozeb, maneb, metiram, metiram de zinc, oxina de cobre, propamidina, propineb, azufre y preparaciones de azufre tales como, por ejemplo, polisulfuro de calcio, tiram, tolilfluanida, zineb y ziram.
 - (6) inductores de resistencia tales como, por ejemplo, acibenzolar-S-metilo, isotianilo, probenazol y tiadinilo.
 - (7) inhibidores de la biosíntesis de aminoácidos y proteínas tales como, por ejemplo, andoprim, blasticidina-S, ciprodinilo, casugamicina, hidrato de clorhidrato de casugamicina, mepanipirim y pirimetanilo.
 - (8) inhibidores de la producción de ATP tales como, por ejemplo, acetato de fentina, cloruro de fentina, hidróxido de fentina y siltiofam.
- 40 (9) inhibidores de la síntesis de la pared celular tales como, por ejemplo, bentiavalicarb, dimetomorf, flumorf, iprovalicarb, mandipropamida, polioxinas, polioxorim, validamicina A y valifenalato.
 - (10) inhibidores de la síntesis de lípidos y membrana tales como, por ejemplo, bifenilo, cloroneb, diclorano, edifenfos, etridiazol, yodocarb, iprobenfos, isoprotiolano, propamocarb, clorhidrato de propamocarb, protiocarb, pirazofos, quintoceno, tecnaceno y tolclofos-metilo.
- 45 (11) inhibidores de la biosíntesis de melanina tales como, por ejemplo, carpropamida, diclocimet, fenoxanilo, ftalida, piroquilona y triciclazol.
 - (12) inhibidores de la síntesis de ácidos nucleicos tales como, por ejemplo, benalaxilo, benalaxilo-M (Kiralaxilo), bupirimato, clozilacona, dimetirimol, etirimol, furalaxilo, himexazol, metalaxilo, metalaxilo-M (Mefenoxam), Ofurace, oxadixilo, ácido oxolínico.
- 50 (13) inhibidores de la transducción de señales tales como, por ejemplo, clozolinato, fenpiclonilo, fludioxonilo, iprodiona, procimidona, quinoxifeno y vinclozolina.
 - (14) desacopladores tales como, por ejemplo, binapacrilo, dinocap, ferimzona, fluazinam y meptildinocap.
 - (15) otros compuestos tales como, por ejemplo, bentiazol, betoxazina, capsimicina, carvona, quinometionato, clazafenona, cufraneb, ciflufenamida, cimoxanilo, ciprosulfamida, dazomet, debacarb, diclorofeno, diclomezina,

5

10

15

20

25

30

35

40

45

difenzoquat, metilsulfato de difenzoquat, difenilamina, ecomat, fenpirazamina, flumetover, fluoromida, flutianilo, fosetil-aluminio, fosetil-calcio, fosetil-sodio, hexaclorobenceno, irumamicina, metasulfocarb, metilisotiocianato, metrafenona, mildiomicina, natamicina, dimetilditiocarbamato de níquel, nitrotal-isopropilo, octilinona, oxamocarb, oxifentiína, pentaclorofenol y sus sales, fenotrina, ácido fosfórico y sus sales, fosetilato de propamocarb, propanosina-sodio, proquinazidà, pirrolnitrina, tebufloquina, tecloftalam, tolnifanida, triazóxido, triclamida, zarilamida, 1-(4-{4-[(5R)-5-(2,6-difluorofenil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3tiazol-2-il}piperidin-1-il)-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]etanona, 1-(4-{4-[(5S)-5-(2,6-difluorofenil)-4,5dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il)piperidin-1-il)-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]etanona, 1-(4-{4-[5-(2,6-difluorofenil)-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)-2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-1-(4-metoxifenoxi)-3,3-dimetilbutan-2-il-1H-imidazol-1-carboxilato, 2.3.5.6-tetracloro-4-(metilsulfonil)piridina, 2,3-dibutil-6-clorotieno[2,3-d]pirimidin-4(3H)-ona, 2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1il]-1-(4-{4-[(5R)-5-fenil-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il}piperidin-1-il)etanona, 2-[5-metil-3- $(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-(4-\{4-[(5S)-5-fenil-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il]-1,3-tiazol-2-il\} piperidin-1-il) et anona.$ 2-[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]-1-{4-[4-(5-fenil-4,5-dihidro-1,2-oxazol-3-il)-1,3-tiazol-2-il]piperidin-1il}etanona, 2-butoxi-6-yodo-3-propil-4H-cromen-4-ona, 2-cloro-5-[2-cloro-1-(2,6-difluoro-4-metoxifenil)-4-metil-1H-imidazol-5-il]piridina, 2-fenilfenol y sus sales, 3,4,5-tricloropiridin-2,6-dicarbonitrilo, 3-[5-(4-clorofenil)-2,3dimetil-1,2-oxazolidin-3-il]piridina, 3-cloro-5-(4-clorofenil)-4-(2,6-difluorofenil)-6-metilpiridazina, 4-(4-clorofenil)-5-(2.6-difluorofenil)-3.6-dimetilpiridazina, 5-amino-1.3,4-tiadiazol-2-tiol, 5-cloro-N'-fenil-N'-(prop-2-in-1-il)tiofen-2-5-metil-6-octil[1,2,4]triazolo[1,5-a]pirimidin-7-amina, etil-(2Z)-3-amino-2-cian-3-fenilprop-2-N-(4-clorobencil)-3-[3-metoxi-4-(prop-2-in-1-iloxi)fenil]propanamida, N-[(4-clorofenil)(cian)metil]-3-[3metoxi-4-(prop-2-in-1-iloxi)fenil]propanamida, N-[(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)metil]-2,4-dicloropiridin-3-N-[1-(5-bromo-3-cloropiridin-2-il)etil]-2,4-dicloropiridin-3-carboxamida, carboxamida, N-[1-(5-bromo-3-N-{(E)-[(ciclopropilmetoxi)imino][6-(difluormetoxi)-2,3cloropiridin-2-il)etil]-2-fluoro-4-iodpiridin-3-carboxamida, difluorofenil]metil}-2-fenilacetamida, N-{(Z)-[(ciclopropilmetoxi)imino][6-(difluormetoxi)-2,3-difluorofenil]metil}-2-N-metil-2-(1-{[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil}piperidin-4-il)-N-(1,2,3,4fenilacetamida, N-metil-2-(1-{[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1tetrahidronaftalen-1-il)-1,3-tiazol-4-carboxamida, il|acetil|piperidin-4-il|-N-[(1R)-1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-il]-1,3-tiazol-4-carboxamida, N-metil-2-(1-{[5-metil-3-(trifluorometil)-1H-pirazol-1-il]acetil}piperidin-4-il)-N-[(1S)-1,2,3,4-tetrahidronaftalen-1-il]-1,3-tiazol-4carboxamida, pentil-{6-[({[(1-metil-1H-tetrazol-5-il)(fenil)metiliden]amino}oxi)metil]piridin-2-il}carbamato, fenazin-1-carboxílico, quinolin-8-ol y quinolin-8-olsulfato (2:1).

(16) otros compuestos tales como, por ejemplo, 1-metil-3-(trifluorometil)-N-[2'-(trifluorometil)bifenil-2-il]-1Hpirazol-4-carboxamida, N-(4'-clorobifenil-2-il)-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, diclorobifenil-2-il)-3-(difluorometil)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, 3-(difluorometil)-1-metil-N-[4'-(trifluorometil)bifenil-2-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, N-(2',5'-difluorbifenil-2-il)-1-metil-3-(trifluorometil)-1H-3-(difluorometil)-1-metil-N-[4'-(prop-1-in-1-il)bifenil-2-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, pirazol-4-carboxamida, fluoro-1,3-dimetil-N-[4'-(prop-1-in-1-il)bifenil-2-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, 2-cloro-N-[4'-(prop-1-in-1-il)bifenil-2-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, 3-cloro-1-il]-1H-pirazol-4-carboxamida, 3-cloro-1-il]-1H-pirazolil]piridin-3-carboxamida, 3-(difluorometil)-N-[4'-(3,3-dimetilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]-1-metil-1H-pirazol-4-N-[4'-(3,3-dimetilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]-5-fluoro-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida, carboxamida, (difluorometil)-N-(4'-etinilbifenil-2-il)-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, N-(4'-etinilbifenil-2-il)-5-fluoro-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida, 2-cloro-N-(4'-etinilbifenil-2-il)piridin-3-carboxamida, 2-cloro-N-[4'-(3,3-dimetilbut-1-in-4-(difluorometil)-2-metil-N-[4'-(trifluorometil)bifenil-2-il]-1,3-tiazol-5-1-il)bifenil-2-il]piridin-3-carboxamida, carboxamida, 5-fluoro-N-[4'-(3-hidroxi-3-metilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida, 2cloro-N-[4'-(3-hidroxi-3-metilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]piridin-3-carboxamida, 3-(difluorometil)-N-[4'-(3-metoxi-3metilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]-1-metil-1H-pirazol-4-carboxamida, 5-fluoro-N-[4'-(3-metoxi-3-metilbut-1-in-1il)bifenil-2-il]-1,3-dimetil-1H-pirazol-4-carboxamida, 2-cloro-N-[4'-(3-metoxi-3-metilbut-1-in-1-il)bifenil-2-il]piridin-(5-bromo-2-metoxi-4-metilpiridin-3-il)(2,3,4-trimetoxi-6-metilfenil)metanon y clorofenil)prop-2-in-1-il]oxi}-3-metoxifenil)etil]-N2-(metilsulfonil)valinamida.

Todos los asociados de mezcla mencionados de las clases (1) a (16) pueden formar sales, cuando están en condiciones por sus grupos funcionales, dado al caso con bases o ácidos apropiados.

Cada principio activo adicional se puede mezclar en un intervalo amplio, preferentemente en una relación en peso de 100:1 a 1:100, con preferencia especial de 5 : 1 a 1 : 5, con los principios activos según la invención.

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

En una forma de realización preferente de la invención, se añade a los agentes fitosanitarios para aumentar la acción adicionalmente un promotor de la penetración. Como promotores de la penetración se tienen en cuenta, por ejemplo, sustancias que promueven la disponibilidad de los compuestos de la fórmula (I) en la capa rociada. Aquí corresponden, por ejemplo, aceites minerales o vegetales. Como aceites se tienen en cuenta todos los aceites – dado al caso modificados- minerales o vegetales que se aplican usualmente en agentes agroquímicos. A modo de ejemplo, se han de mencionar aceite de girasol, aceite de colza, aceite de oliva, aceite de ricino, aceite de nabo,

aceite de germen de maíz, aceite de semillas de algodón y aceite de habas de soja o los ésteres de los aceites mencionados. Se prefieren aceite de colza, aceite de girasol y sus ésteres metílico o etílico, en especial éster metílico de aceite de colza.

La concentración de los promotores de la penetración puede variar en los agentes según la invención en un amplio intervalo. En el caso de un agente fitosanitario formulado, es en general del 1 al 95 % en peso, preferentemente del 1 al 55 % en peso, con preferencia especial del 15 – 40 % en peso. En los agentes listos para usar (caldos de pulverización), la concentración es en general de entre 0,1 y 10 g/l, preferentemente de entre 0,5 y 5 g/l.

Los principios activos según la invención también pueden estar, al usar como insecticidas en sus formulaciones usuales en comercios, así como en las formas de aplicación preparadas a partir de estas formulaciones, en mezcla con sinergistas. Los sinergistas son compuestos por medio de los que se aumenta la acción de los principios activos, sin que el sinergista añadido deba ser activo en sí mismo.

Los principios activos según la invención también pueden presentarse, en su utilización como insecticidas, en sus formulaciones usuales en el comercio, así como en las formas de aplicación preparadas a partir de estas formulaciones, en mezclas con inhibidores que reducen una degradación del principio activo después del uso en los alrededores de la planta, sobre la superficie de partes vegetales o en tejidos vegetales.

El contenido de principio activo de las formas de aplicación preparadas a partir de las formulaciones usuales en el mercado puede variar en amplios intervalos. La concentración de principio activo de las formas de aplicación puede variar de 0,00000001 a 95 % en peso de principio activo, preferentemente entre 0,00001 y 1 % en peso.

La aplicación se realiza en una forma usual adecuada a las formas de aplicación.

10

15

- 20 Según la invención, se pueden tratar todas las plantas (se han de mencionar césped, vides, cereales, por ejemplo, trigo, cebada, centeno, avena, arroz, maíz y mijo; nabos, por ejemplo, remolachas y remolachas forrajeras; frutos, por ejemplo, fruta de pepita, fruta de carozo y bayas, por ejemplo, manzanas, peras, ciruelas, melocotones, almendras, cerezas y bayas, por ejemplo, fresas, frambuesas, moras; legumbres, por ejemplo, judías verdes, lentejas, guisantes y habas de soja; oleaginosas, por ejemplo, colza, mostaza, amapola, aceitunas, girasoles, cocos, 25 plantas de aceite de ricino, granos de cacao y cacahuetes; cucurbitáceas, por ejemplo, calabaza, pepinos y melones; fibras, por ejemplo, algodón, lino, cáñamo y yute; cítricos, por ejemplo, naranjas, limones, pomelos y mandarinas; variedades de verduras, por ejemplo, espinaca, lechuga, espárrago, coles, zanahorias, cebollas, tomates, patatas y pimientos; lauráceas, por ejemplo, aguacate, canela, alcanfor, o asimismo plantas tales como tabaco, nueces, café, berenjena, remolacha, té, pimienta, vides, lúpulo, bananas, caucho natural, así como plantas de adorno, por ejemplo, 30 flores, arbustos, árboles de hojas caduca y coníferas, en donde esta enumeración no establece ninguna limitación) y las partes de la planta. Por plantas se entienden a este respecto todas las plantas y las poblaciones de plantas como plantas silvestres deseadas y no deseadas o plantas de cultivo (incluso plantas de cultivo naturales). Las plantas de cultivo pueden ser plantas que se pueden obtener por medio de procedimientos de cría y optimización o por procedimientos biotecnológicos o de tecnología genética o combinaciones de estos procedimientos, incluyendo las plantas transgénicas y las especies de plantas que se pueden proteger o no por derechos de protección de especies. 35 Por partes de plantas se entienden todas las partes y órganos de las plantas aéreos y subterráneos, tales como brote, hoja, flor y raíz, enumerando a modo de ejemplo hojas, agujas, tallos, troncos, flores, ascocarpos, frutos y simientes, así como raíces, bulbos y rizomas. A las partes de las plantas pertenece también el material cosechado, así como material reproductivo vegetativo y generativo, por ejemplo, plantones, bulbos, rizomas, acudos y semillas.
- 40 El tratamiento según la invención de las plantas y partes de las plantas con los principios activos se realiza directamente o por acción sobre sus alrededores, hábitat o almacén según los procedimientos de tratamiento usuales, por ejemplo, por inmersión, pulverización, evaporación, nebulización, dispersión, esparcido, inyección y, en el caso del material de reproducción, en especial en las simientes, también por recubrimiento de una o varias capas.
- Tal como ya se mencionó con anterioridad, se pueden tratar según la invención todas las plantas y sus partes. En una forma de realización preferente, se tratan especies y variedades de plantas silvestres u obtenidas por procedimientos de cría biológicos convencionales como cruce o fusión de protoplastos, así como sus partes. En otra forma de realización preferente, se tratan plantas y variedades de plantas transgénicas que se obtuvieron con procedimientos de ingeniería genética dado al caso en combinación con procedimientos convencionales (organismo genéticamente modificado) y sus partes. Los términos "partes" o "partes de plantas" se explicaron con anterioridad.
- Con preferencia especial, según la invención se tratan plantas de las variedades de plantas usuales en cada caso en el mercado o que se hallan en uso. Por variedades de plantas se entienden plantas con nuevas propiedades ("rasgos"), que se criaron tanto por cría convencional, por mutagénesis o por técnicas de ADN recombinantes. Pueden ser variedades, biotipos o genotipos.
- Según las especies de plantas o variedades de plantas, su lugar de emplazamiento y condiciones de crecimiento (suelos, clima, período vegetativo, alimentación), también pueden aparecer efectos superaditivos ("sinérgicas") por el tratamiento según la invención. De esta manera, son posibles, por ejemplo, menores cantidades de aplicación y/o

ampliaciones del espectro de acción y/o un incremento de la acción de las sustancias y agentes útiles según la invención, mejor crecimiento de la planta, mayor tolerancia a las altas o bajas temperaturas, mayor tolerancia a la sequía o al contenido de agua o suelo salino, mayor capacidad de florescencia, cosecha más simple, aceleración de la maduración, mayores productos de la cosecha, mayor calidad y/o mayor valor nutricional de los productos cosechados, mayor capacidad en almacenamiento y/o procesabilidad de los productos cosechados, que van más allá de los efectos en realidad esperables.

5

10

15

20

25

30

35

40

45

Entre las plantas o las variedades de plantas transgénicas (obtenidas por tecnología genética) preferentes, por tratar según la invención, se cuentan todas las plantas que recibieron material genético por modificación de tecnología genética, que les otorga a estas plantas ventajosas propiedades valiosas ("rasgos"). Ejemplos de tales propiedades son mejor crecimiento de la planta, mayor tolerancia a altas o bajas temperaturas, mayor tolerancia a la seguía o al contenido de agua o suelo salino, mayor florescencia, cosecha más sencilla, aceleración de la maduración, mayores productos de la cosecha, mayor calidad y/o mayor valor nutricional de los productos cosechados, mayor capacidad de almacenamiento y/o procesabilidad de los productos cosechados. Otros ejemplos especialmente destacados de las propiedades son una mayor defensa de las plantas contra parásitos animales y microbianos, como contra insectos, ácaros, hongos fitopatógenos, bacterias y/o virus, así como una mayor tolerancia de las plantas contra determinados principios activos herbicidas. Como ejemplos de plantas transgénicas se mencionan los principales cultivos como cereales (maíz, arroz), maíz, soja, patata, remolachas, tomates, guisantes y otros tipos de hortalizas, algodón, tabaco, colza, así como plantas frutales (con las frutas manzanas, peras, cítricos y uvas), destacándose en especial maíz, soja, patata, algodón, tabaco y colza. Como propiedades ("rasgos") se destacan en especial la mayor defensa de las plantas contra insectos, arácnidos, nematodos y caracoles por las toxinas que se producen en las plantas, en especial aquellas que se generan por el material genético de Bacillus thuringiensis (por ejemplo, por los genes CrylA(a), CrylA(b), CrylA(c), CrylIIA, CrylIIB2, Cry9c, Cry2Ab, Cry3Bb y CryIF, así como sus combinaciones) en las plantas (de ahora en adelante, "plantas Bt"). Como propiedades ("rasgos") se destacan en especial la mayor defensa de las plantas contra hongos, bacterias y virus por resistencia sistémica adquirida (SAR), sistemina, fitoalexinas, desencadenantes, así como genes de resistencia y proteínas y toxinas expresadas correspondientemente. Como propiedades ("rasgos") se destacan también en especial la mayor tolerancia de las plantas frente a determinados principios activos herbicidas, por ejemplo, imidazolinonas, sulfonilureas, glifosatos o fosfinotricina (por ejemplo, gen "PAT"). Los genes que otorgan las propiedades deseadas en cada caso ("rasgos") también pueden aparecer en combinación entre sí en las plantas transgénicas. Como ejemplos de las "plantas Bt" se han de mencionar variedades de maíz, variedades de algodón, variedades de soja y variedades de patata, que se comercializan con los nombres comerciales de YIELD GARD® (por ejemplo, maíz, algodón, soja), KnockOut® (por ejemplo, maíz), StarLink® (por ejemplo, maíz), Bollgard® (algodón), Nucotn® (algodón) y NewLeaf® (patata). Como ejemplos de plantas tolerantes a herbicidas se han de mencionar variedades de maíz, variedades de algodón y variedades de soja que se comercializan con los nombres comerciales de Roundup Ready® (tolerancia a glifosatos, por ejemplo, maíz, algodón, soja), Liberty Link® (tolerancia a fosfinotricina, por ejemplo, colza), IMI® (tolerancia a imidazolinonas) y STS® (tolerancia a sulfonilureas, por ejemplo, maíz). Como plantas resistentes a herbicidas (criadas convencionalmente con tolerancia a herbicidas) se han de mencionar también las variedades comercializadas con el nombre de Clearfield® (por ejemplo, maíz). Por supuesto, estas explicaciones también rigen para las variedades desarrolladas en el futuro o bien que se lancen en un futuro al mercado con estas propiedades o con propiedades desarrolladas en un futuro ("rasgos").

Las plantas enumeradas se pueden tratar según la invención de forma particularmente ventajosa con los compuestos de la fórmula (I) o bien con las mezclas de principios activos según la invención. Los intervalos preferentes antes indicados en el caso de los principios activos o las mezclas rigen también para el tratamiento de estas plantas. Se ha de destacar en especial el tratamiento de plantas con los compuestos o mezclas enumerados en especial en el presente texto.

Los principios activos según la invención no sólo actúan contra parásitos de plantas, sanitarios y provisiones, sino también en el sector veterinario contra parásitos animales (ecto— y endoparásitos) como garrapatas escarabajos, garrapatas blandas, ácaros de la sarna, Trombidiidae, moscas (picadoras y chupadoras), larvas de moscas parásitas, piojos, malófagos y pulgas. A estos parásitos pertenecen:

Del orden de los Anoplurida, por ejemplo, Haematopinus spp., Linognathus spp., Pediculus spp., Phtirus spp., Solenopotes spp.

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

Del orden de los Diptera y los subórdenes Nematocerina, así como Brachycerina, por ejemplo, Aedes spp., Anopheles spp., Culex spp., Simulium spp., Eusimulium spp., Phlebotomus spp., Lutzomyia spp., Culicoides spp., Chrysops spp., Hybomitra spp., Atylotus spp., Tabanus spp., Haematopota spp., Philipomyia spp., Braula spp., Musca spp., Hydrotaea spp., Stomoxys spp., Haematobia spp., Morellia spp., Fannia spp., Glossina spp., Calliphora spp., Lucilia spp., Chrysomyia spp., Wohlfahrtia spp., Sarcophaga spp., Oestrus spp., Hypoderma spp.,

Gasterophilus spp., Hippobosca spp., Lipoptena spp., Melophagus spp.

Del orden de los Siphonapterida, por ejemplo, Pulex spp., Ctenocephalides spp. (Ctenocephalides canis, Ctenocephalides felis), Xenopsylla spp., Ceratophyllus spp.

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

5 Del orden de los Blattarida, por ejemplo, Blatta orientalis, Periplaneta americana, Blattela germanica, Supella spp.

De la subclase de los Acari (Acarina) y los órdenes de los Meta— y Mesostigmata, por ejemplo, Argas spp., Ornithodorus spp., Otobius spp., Ixodes spp., Amblyomma spp., Boophilus spp., Dermacentor spp., Haemophysalis spp., Hyalomma spp., Rhipicephalus spp., Dermanyssus spp., Raillietia spp., Pneumonyssus spp., Sternostoma spp., Varroa spp.

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

Los principios activos de la fórmula (I) según la invención son apropiados también para combatir artrópodos, animales útiles en agricultura tales como, por ejemplo, vacas, ovejas, cabras, caballos, cerdos, burros, camellos, búfalos, conejos, pollos, pavas, patos, gansos, abejas, otros animales domésticos tales como, por ejemplo, perros, gatos, pájaros domesticados, peces de acuario, así como los llamados animales de ensayo tales como, por ejemplo, hámsteres, cobayas, ratas y ratones. Con el combate de estos artrópodos, se deben reducir los fallecimientos y los rendimientos (en carne, leche, lana, pieles, huevos, miel, etc.), de modo que es posible con la aplicación de los principios activos según la invención una tenencia de los animales más económica y más simple.

La aplicación de los principios activos según la invención se realiza en el sector veterinario y en la tenencia de los animales de manera conocida por administración enteral en forma de por ejemplo comprimidos, cápsulas, brebajes, pociones, granulados, pastas, bolos, procedimiento con la alimentación, supositorios, por administración parenteral como, por ejemplo, por inyecciones (intramuscular, subcutánea, intravenosa, intraperitoneal, etc.), implantes, por aplicación nasal, por aplicación dérmica en forma de por ejemplo inmersión o baño, pulverización, vertido dorsal y en la cruz (pour—on y spot—on), lavado, empolvado, así como con ayuda de cuerpos moldeados con contenido de principios activos como collares y colleras, marcadores para orejas, marcadores para rabos, bandas para miembros, ronzales, dispositivos de marcación, etc.

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

Además se halló que los compuestos según la invención muestran una gran acción insecticida contra insectos que destruyen los materiales técnicos.

35 A modo de ejemplo y preferentemente –sin establecer una limitación–, se han de mencionar los siguientes insectos:

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

himenópteros tales como Sirex juvencus, Urocerus gigas, Urocerus gigas taignus, Urocerus augur;

termitas tales como Kalotermes flavicollis, Cryptotermes brevis, Heterotermes indicola, Reticulitermes flavipes, Reticulitermes santonensis, Reticulitermes lucifugus, Mastotermes darwiniensis, Zootermopsis nevadensis, Coptotermes formosanus;

45 Campodeidae como Lepisma saccharina.

25

30

40

50

Por materiales técnicos se entienden en el presente contexto materiales no vivos tales como preferentemente plásticos, adhesivos, colas, papeles y cartones, cuero, madera, productos del procesamiento de la madera y pinturas.

Los agentes listos para usar pueden contener dado al caso otros insecticidas y dado al caso uno o varios fungicidas.

En cuanto a las posibles parejas de mezcla adicionales, se hace remisión a los insecticidas y fungicidas antes mencionados.

Al mismo tiempo, se pueden emplear los compuestos según la invención para proteger la vegetación de objetos, en especial de barcos, tamices, redes, construcciones, muelles e instalaciones de señales que tienen relación con agua de mar o agua salobre.

Además, se pueden emplear los compuestos según la invención solos o en combinación con otros principios activos como agentes antifouling.

Los principios activos son apropiados también para combatir parásitos animales en la protección doméstica, de higiene y las existencias, en especial de insectos, arácnidos y ácaros que aparecen en ambientes cerrados tales como, por ejemplo, viviendas, naves de fábricas, oficinas, cabinas de conductores, etc. Se pueden usar para combatir estos parásitos solos o en combinación con otros principios activos o agentes coadyuvantes en productos insecticidas domésticos. Son activos contra especies sensibles y resistentes, así como contra todos los estadios de desarrollo. A estos parásitos pertenecen:

Del orden de los Scorpionidea, por ejemplo, Buthus occitanus.

10

15

25

35

40

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

Del orden de los Araneae, por ejemplo, Aviculariidae, Araneidae.

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

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

20 Del orden de los Diplopoda, por ejemplo, Blaniulus guttulatus, Polydesmus spp.

Del orden de los Chilopoda, por ejemplo, Geophilus spp.

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

Del orden de los Blattaria, por ejemplo, Blatta orientalies, Blattella germanica, Blattella asahinai, Leucophaea maderae, Pancloroa spp., Parcoblatta spp., Periplaneta australasiae, Periplaneta americana, Periplaneta brunnea, Periplaneta fuliginosa, Supella longipalpa.

Del orden de los Saltatoria, por ejemplo, Acheta domesticus.

Del orden de los Dermaptera, por ejemplo, Forficula auricularia.

Del orden de los Isoptera, por ejemplo, Kalotermes spp., Reticulitermes spp.

Del orden de los Psocoptera, por ejemplo, Lepinatus spp., Liposcelis spp.

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

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

Del orden de los Lepidoptera, por ejemplo, Achroia grisella, Galleria mellonella, Plodia interpunctella, Tinea cloacella, Tinea pellionella, Tineola bisselliella.

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

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

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

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

La aplicación en el área de los insecticidas domésticos se realiza sola o en combinación con otros principios activos apropiados tales como ésteres de ácido fosfórico, carbamatos, piretroides, neonicotinoides, reguladores del crecimiento o principios activos de otras clases conocidas de insecticidas.

La aplicación se realiza en aerosoles, medios de pulverización sin presión, por ejemplo, sprays pulverizadores y de bomba, nebulizadores, foggers, espumas, geles, productos de evaporación con plaquitas vaporizadoras de celulosa o plástico, evaporadores líquidos, evaporadores de gel y membrana, evaporadores operados con hélice, sistemas de evaporación sin energía o pasivos, papeles para polillas, saquitos para polillas y geles para polillas, como granulados o polvos, en cebos dispersos o estaciones con cebos.

Ejemplos de preparación

10 **Ejemplo 1**:

5

15

25

35

Etapa 1: 3-(4-bromo-pirazol-1-il)-piridina

Se disolvió 3-pirazol-1-il-piridina (500 mg, 3,44 mmol) en acetonitrilo (15 ml) y se mezcló con nitrato de amonio y cerio (IV) (944 mg, 1,72 mmol) (ligera exotermia). Se añadió N-bromosuccinimida (736 mg, 4,13 mmol) en porciones (ligera exotermia) y la mezcla se agitó durante 30 min a temperatura ambiente y luego se calentó durante 3 horas (h) a reflujo. Después de enfriar la mezcla, se añadió acetato de etilo. La fase orgánica se lavó con agua, se lavó con una solución de sulfato de sodio y luego se secó con sulfato de magnesio. El disolvente se eliminó al vacío en el evaporador rotativo.

Rendimiento: 750 mg (93 % d.t), logP (HCOOH) 1,56, [M+1] 224,0

20 RMN de ¹H (d₆-DMSO): 7,54 (m, 1H), 7,90 (s, 1H), 8,20 (m, 1H), 8,55 (m, 1H), 8,79 (s, 1H), 9,06 (m, 1H).

Etapa 2: 3-[4-(4,4,5,5-tetrametil-[1,3,2]dioxaborolan-2-il)-pirazol-1-il]-piridina

Bajo argón se mezclaron 3-(4-bromo-pirazol-1-il)-piridina (1,00 g, 4,46 mmol), 1,1'-bis(difenilfosfino)ferroceno (dppf) (74 mg, 0,13 mmol), dicloruro de paladio-dppf (109 mg, 0,13 mmol), acetato de potasio (1,31 g, 13,3 mmol), pinacolatodiborano (1,19 g, 4,68 mmol) con dioxano (11 mL). La mezcla se calentó durante 24 h a reflujo y luego se enfrió. El disolvente se eliminó al vacío en el evaporador rotativo y el residuo se mezcló con diclorometano (100 ml) y agua (100 ml), el sólido obtenido se filtró por succión y se descartó. El filtrado se extrajo con diclorometano y la fase orgánica se secó con sulfato de magnesio. El disolvente se eliminó al vacío en el evaporador rotativo y el residuo se cromatografió (acetato de etilo, ciclohexano).

30 Rendimiento: 680 mg (55 % d. t.), logP (HCOOH) 2,19, [M+1] 272,2

RMN de 1 H (d₆-DMSO): 1,30 (s, 12H), 7,51 (m, 1H), 7,90 (s, 1H), 8,25 (m, 1H), 8,51 (m, 1H), 8,73 (s, 1H), 9,12 (m, 1H).

Etapa 3: 2-(6-bromo-piridin-2-il)-pirimidina

54,5 ml (137,1 mmol) de una solución 2,5 molar de n-butil-litio (n-BuLi) se diluyeron bajo argón con 70 ml de THF. A

una temperatura inferior a -70 °C, se añadieron gota a gota 32,5 g (137,1 mmol) de 2,6-dibromopiridina en 150 ml de THF. Se agitó durante 15 min y luego se mezcló, después a una temperatura inferior a -70 °C, con 19,2 ml (107 mmol) de una solución 5,6 molar de cloruro de zinc en éter dietílico. Se deja descongelar, se mezcló con una solución de 17,4 g (109 mmol) de bromopirimidina en 50 ml de THF y una suspensión de 3,9 g (3,4 mmol) de tetraxis(trifenilfosfina)paladio en 50 ml de THF. La mezcla se hirvió durante 4 h a reflujo, después de enfriar, se mezcló con Na-EDTA en agua y lejía de sosa diluida hasta pH = 10. Se filtró por succión para eliminar la parte no disuelta, se extrajo la fase acuosa tres veces con acetato de etilo, se secaron las fases orgánicas combinadas con MgSO₄ y se evaporó. Se cristalizó el residuo en 60 ml de trifluoruro de benceno, se coció brevemente con carbón activado y se filtró en caliente.

10 Rendimiento: 14,82 g (52 % d.t), logP (HCOOH) 1,3 [M+1] 236,0

5

15

20

RMN de ¹H (CD₃CN): 7,4 (t, 1H), 7,65 (d, 1H), 7,8 (dd, 1H), 8,4 (d, 1H), 8,9 (m, 2H)

Etapa 4: 2-[6-(1-piridin-3-il-1*H*-pirazol-4-il)-piridin-2-il]-pirimidina

Bajo argón se preparó una mezcla de acetonitrilo (50 ml) y carbonato de sodio (1 N en agua, 30 ml) (solución A). 3-[4-(4,4,5,5-tetrametil-[1,3,2]dioxaborolan-2-il)-pirazol-1-il]-piridina (2,0 g, 7,37 mmol), 2-(6-bromo-piridin-2-il)-pirimidina (1,74 g, 7,37 mmol) y tetraquis-(trifenilfosfin)-paladio (255 mg, 0,22 mmol) se mezclaron con la solución A bajo argón y se agitó durante la noche a 75 °C. La mezcla se enfrió y se concentró. El residuo se mezcló con diclorometano/agua y el sólido obtenido se separó y se descartó. El filtrado se extrajo y las fases orgánicas combinadas se secaron sobre sulfato de magnesio y se concentraron. El residuo primero se lavó una vez con cloroformo y luego dos veces con éter dietílico.

Rendimiento: 1,11 g (50 % d.t), logP (HCOOH) 1,36 [M+1] 301,1

RMN de 1 H (d₆-DMSO): 7,55 (m, 2H), 7,93 (d, 1H), 8,02 (m, 1H), 8,21 (d, 1H), 8,31 (m, 1H), 8,43 (s, 1H), 8,56 (m, 1H), 9,00 (m, 2H), 9,15 (m, 2H).

Síntesis alternativa del ejemplo 1:

25 **Etapa 1:** 6-((E)-2-dimetilamino-vinil)-piridin-2-carbonitrilo

20 g (169 mmol) de 6-metil-piridin-2-carbonitrilo se hicieron reaccionar en una mezcla de 100 ml de DMF y DMF-dimetilacetal durante la noche en autoclave a 175 °C. Después de enfriar, se evaporó, se disolvió en diclorometano, se filtró, se concentró y el residuo se destiló al vacío en tubo esférico.

30 Rendimiento (porcentual calculado a partir de 2 preparaciones) 26,8 g (73 % d.t.), [M+] de CGEM 173

RMN de ¹H (CD₃CN): 2,9 (s, 6H), 5,15 (d, 1H), 7,1 (m, 2H), 7,5 (m, 2H)

Etapa 2: 2-(6-ciano-piridin-2-il)-3-dimetilamino-aliliden]-dimetil-amoniohexafluorofosfato

Se mezclaron 5 ml (65 mmol) de DMF en aproximadamente 100 ml de diclorometano bajo enfriamiento con baño de hielo con 7 ml (80 mmol) de cloruro de oxalilo, la mezcla obtenida se concentró, se volvieron a suspender en diclorometano y se vertieron bajo enfriamiento con baño de hielo/etanol en una solución de 7,5 g (43 mmol) de 6-((E)-2-dimetilamino-vinil)-piridin-2-carbonitrilo en 100 ml de diclorometano. Se agitó durante 15 min y se evaporó luego. El residuo se mezcló bajo enfriamiento con baño de hielo/etanol con aproximadamente 50 ml de etanol y 40 ml de dimetilamina como solución en etanol (5,6 M, equivalente a 224 mmol). Se agitó durante 10 min, se mezcló con 6,5 ml de ácido hexafluorofosfórico (solución acuosa al 60 %, equivalente a 44 mol), se agitó durante otros 15 min en baño de enfriamiento, se filtró el precipitado cristalino formado por succión, se lavó con etanol frío y se secó en el evaporador rotativo.

10 Rendimiento 13,1 g (81 % d. t), logP (HCOOH) -0,07, [M+] 229,2 (catión sin PF6-)

RMN de ¹H (CD₃CN) 2,45 (ancho, 6H), 3,3 (s, 6H), 7,5 (s, 2H), 7,6 (m, 1H), 7,85 (m, 1H), 8,0 (m, 1H)

Etapa 3: 6-(1-piridin-3-il-1*H*-pirazol-4-il)-piridin-2-carbonitrilo

5

15

20

25

30

35

Se disolvieron 2,2 g (5,9 mmol) de 2-(6-ciano-piridin-2-il)-3-dimetilamino-aliliden]-dimetil-amoniohexafluorofosfato y 0,65 g (5,9 mmol) de 3-hidrazinopiridina se disolvieron en aproximadamente 50 ml de dioxano/acetonitrilo. Se dejó reposar durante la noche a temperatura ambiente y luego se concentró. El residuo se mezcló con cloruro de sodio acuoso, citrato de Na acuoso, lejía de sosa diluida hasta pH = 9 y acetato de etilo. La fase acuosa se extrajo luego dos veces con diclorometano/2-propanol. Las fases orgánicas combinadas se secaron sobre MgSO₄ y se evaporaron, el residuo se recristalizó en etanol, filtrando en caliente, el filtrado se concentró algo, el precipitado formado se filtró por succión, se lavó con MTBE y se secó en el evaporador rotativo.

Rendimiento: 0,76 g (52 % d. t), logP (neutro) 1,79; [M+1] 248,1

RMN de 1 H (d₆-DMSO): 7,6 (m, 1H), 7,9 (m, 1H), 8,1 (m, 2H), 8,3 (m, 1H), 8,5 (m, 1H), 8,6 (m, 1H), 9,2 (m, 1H), 9,3 (2, 1H)

Etapa 4: 6-(1-piridin-3-il-1*H*-pirazol-4-il)-piridin-2-carboxamidina

Se disolvieron 0,7 g (2,8 mmol) 6-(1-piridin-3-il-1*H*-pirazol-4-il)-piridin-2-carbonitrilo en 150 ml de metanol absoluto bajo calentamiento y se mezclaron con 1 ml de solución de metanolato de sodio en metanol (30 %, equivale a 5,4 mmol). Se agitó a 65 °C hasta que el cromatograma de capa fina (CCF) mostró una reacción completa, se mezcló con 1,5 g de cloruro de amonio y se concentró. El residuo se hirvió dos veces con 30 ml de etanol, se filtró en caliente y los filtrados combinados se concentraron. Se dejó reposar durante 20 min a TA, se filtró el precipitado formado, se lavó con MTBE y se secó en el evaporador rotativo.

Rendimiento: 0,74 g (95 % d. t), log P (neutro) 1,99; [M+1] 265,2

RMN de 1 H (d₆-DMSO) 7,5 (ancho, 3H), 7,65 (m, 1H), 8,2 (m, 2H), 8,35 (, 2H), 8,6 (d, 1H), 8,7 (s, 1H), 9,7 (s, 1H)

Etapa 5: 2-[6-(1-piridin-3-il-1*H*-pirazol-4-il)-piridin-2-il]-pirimidina

Se calentaron 0,73 g (2,7 mmol) de 6-(1-piridin-3-il-1*H*-pirazol-4-il)-piridin-2-carboxamidina y 0,8 g (2,9 mmol) de hexafluorofosfato de (3-dimetilamino-alilidene)-dimetil-amonio en 30 ml de etanol con 3 ml de etanolato de sodio como solución en etanol (21 %, equivalente a 8,1 mmol) durante 6 h bajo argón a reflujo. Se concentró, se mezcló con tampón de citrato de sodio, lejía de sosa diluida hasta pH = 9, NaCl acuoso, acetato de etilo/THF, se extrajo la fase acuosa tres veces con diclorometano/2-propanol, se secaron las fases orgánicas combinadas con MgSO₄ y se evaporaron. El residuo se recristalizó en etanol, en este caso se hirvió brevemente con carbón activado y se filtró en caliente, el filtrado se concentró un poco y el precipitado formado se lavó con MTBE y se secó en el evaporador rotativo. El residuo se siguió purificando por una filtración a través de gel de sílice con acetona.

10 Rendimiento: 0,37 g (43 % d. t), logP (neutro) 1,52, [M+1] 301,1

RMN de 1 H (CD₃CN): 7,45 (t, 1H), 7,5 (dd, 1H), 7,8 (d, 1H), 7,95 (t, 1H), 8,2 (m, 1H), 8,3 (d, 1H), 8,35 (s, 1H), 8,55 (d, 1H), 8,8 (s, 1H), 8,95 (m, 2H), 9,1 (d, 1H)

Ejemplo 2:

Etapa 1: 3-dimetilamino-1-pirimidin-2-il-propenona

15

5

Se agitaron 11 g (90 mmol) de 2-acetilpirimidina con 23 g (193 mmol) de DMF-DMA (dimetilacetamida) en un puente de destilación corto durante 1 h a 100 °C, pasando un poco de destilado. Se evaporó, el residuo se recristalizó en trifluoruro de benceno.

Rendimiento: 11,4 g (70 % d. t)

20 RMN de ¹H (d₆-DMSO): 3,1 (s, 6H), 6 (d, 1H), 7,5 (t, 1H), 7,7 (d, 1H), 8,9 (d, 2H)

Etapa 2: 2-(1H-pirazol-3-il)-pirimidina

$$\begin{array}{c} & & & & \\ & & \\ & & & \\ & & & \\ & & & \\ & & & \\ & & & \\ & & & \\ & & & \\ & & & \\ & & & \\ & & & \\$$

Se calentaron 11,2 g (63,2 mmol) de 3-dimetilamino-1-pirimidin-2-il-propenona con 4,5 ml (92,5 mmol) de hidrato de hidrazina en 200 ml de EtOH durante 2 h a reflujo. Se evaporó y se recristalizó el residuo en trifluoruro de benceno.

25 Rendimiento: 8,72 g (94 % d. t) logP(HCOOH) 0,1

RMN de ¹H (d₆-DMSO) 9,65 (s, 1H), 7,4 (s, 1H), 7,6-7,8 (ancho, 1H), 8,85 (m, 2H), 13-13,5 (ancho, 1H)

Etapa 3: 1'-(piridin-3-il)-3-(pirimidin-2-il)-1'H-1,4'-bipirazol

Se agitaron 3-(4-bromo-pirazol-1-il)-piridina (800 mg, 3,57 mmol), 2-(1H-pirazol-3-il)-pirimidina (783 mg, 5,35 mmol), carbonato de cesio (1,86 g, 5,71 mmol), Cu₂O (29 mg, 0,17 mmol) y salicilaldoxima (97,8 mg, 0,71 mmol) bajo argón en DMF (4 ml) a 130 °C. Después de 36 h, se enfrió la mezcla y se filtró. El filtrado se concentró y el residuo se cromatografió primero con acetato de etilo/ciclohexano y luego con acetato de etilo/isopropanol en gel de sílice.

Rendimiento: 274 mg (27 % d.t), logP (HCOOH) 1,18, [M+1] 290,1

RMN de 1 H (d_{6} -DMSO): 7,19 (m, 1H), 7,48 (m, 1H), 7,60 (m, 1H), 8,33 (m, 1H), 8,40 (s, 1H), 8,43 (m, 1H), 8,58 (m, 1H), 8,90 (m, 2H), 9,19 (m, 1H), 9,24 (s, 1H)

Ejemplo 3: 1'-piridin-3-il-3-trifluorometil-1'H-[1,4']bipirazolilo

Se mezclaron 3-(4-bromo-pirazol-1-il)-piridina (1,00 g, 4,46 mmol), 3-trifluorometilpirazol (911 mg, 6,69 mmol), carbonato de cesio (2,33 g, 7,14 mmol), Cu_2O (36 mg, 0,22 mmol) y salicilaldoxima (122 mg, 0,89 mmol) bajo argón en DMF (5 ml) y se agitó a 130 °C. Después de 24 h, la mezcla se enfrió hasta temperatura ambiente y se filtró sobre gel de sílice (acetona). El disolvente se eliminó al vacío. El residuo se mezcló con una solución saturada de NaCl y los componentes orgánicos se extrajeron con acetato de etilo. La fase orgánica se secó con sulfato de magnesio y el disolvente se eliminó al vacío. El residuo se cromatografió (acetato de etilo, ciclohexano).

Rendimiento: 200 mg (15 % d.t), logP (HCOOH) 2,27, [M+1] 280,1

RMN de 1 H (d₆-DMSO): 6,97 (m, 1H), 7,57 (m, 1H), 8,28 (m, 1H), 8,31 (s, 1H), 8,44 (m, 1H), 8,58 (m, 1H), 9,13 (m, 2H).

20 **Ejemplo 4:** 2-[1-(piridin-3-il)-1H-pirazol-4-il]-6-(trifluorometil)piridina

Bajo argón se preparó una mezcla de acetonitrilo (4,8 ml) y carbonato de sodio (1 N en agua, 5,9 ml) (solución A). Se mezclaron 3-[4-(4,4,5,5-tetrametil-[1,3,2]dioxaborolan-2-il)-pirazol-1-il]-piridina (400 mg, 1,47 mmol), 2-bromo-6-(trifluorometil)piridina (333 mg, 1,47 mmol) y tetraxis-(trifenilfosfina)-paladio (51 mg, 0,04 mmol) con la solución A bajo argón y se agitó durante la noche a 75 °C. La mezcla se enfrió y se concentró. El residuo se mezcló con acetato de etilo/agua y se extrajo. La fase orgánica se secó sobre sulfato de magnesio y se concentró. El residuo se purificó primero en gel de sílice (acetato de etilo, ciclohexano) y luego con HPLC preparativa (RP, acetonitrilo, agua).

Rendimiento: 210 mg (49 % d.t), logP (HCOOH) 2,51, [M+1] 291,1

RMN de 1 H (d₆-DMSO): 7,56 (m, 1H), 7,72 (m, 1H), 8,09 (m, 2H), 8,31 (m, 1H), 8,40 (s, 1H), 8,56 (m, 1H), 9,18 (m, 2H)

Ejemplo 5:

5

10

15

25

30

Etapa 1: amida del ácido 6-(1-piridin-3-il-1*H*-pirazol-4-il)-piridin-2-carbotiónico

Se disolvió 1 g (4 mmol) de 6-(1-piridin-3-il-1*H*-pirazol-4-il)-piridin-2-carbonitrilo en 30 ml de piridina bajo calentamiento y se mezcló con 1,5 ml de sulfuro de amonio (solución acuosa al 40 %, equivalente a 8,8 mmol). Después de 1 h, se evaporó. El residuo se recristalizó en etanol, filtrando en caliente, el filtrado se concentró algo, el precipitado formado se filtró por succión, se lavó con MTBE y se secó en el evaporador rotativo.

Rendimiento: 1,2 g (98 %d. t), logP (neutro) 1,77, [M+1] 282,1

RMN de 1 H (d₆-DMSO): 7,6 (m, 1H), 7,9 (m, 2H), 8,3 (m, 1H), 8,4 (d, 1H), 8,55 (m, 2H), 9,25 (d, 1H), 9,4 (s, 1H)

Etapa 2: N-hidroxi-6-(1-piridin-3-il-1H-pirazol-4-il)-piridin-2-carboxamidina

Se disolvieron 0,4 g (1,4 mmol) de amida del ácido 6-(1-piridin-3-il-1*H*-pirazol-4-il)-piridin-2-carbotiónico en 40 ml de dioxano-THF 1:3 bajo calentamiento, se mezclaron con 0,4 ml de hidroxilamina (solución acuosa al 50 %, equivalente a 6,8 mmol) y se agitó durante 1 h a 60 °C, luego se evaporó. El producto crudo obtenido de esta manera no se purificó.

Rendimiento: 0,34 g, logP (neutro) 1,23, [M+H] 281,1

15 **Etapa 3:** 2-[1,2,4]oxadiazol-3-il-6-(1-piridin-3-il-1*H*-pirazol-4-il)-piridina

Se disolvieron 0,24 g de N-hidroxi-6-(1-piridin-3-il-1H-pirazol-4-il)-piridin-2-carboxamidina (producto crudo de la etapa anterior) en THF/trietilortoformato y se mezclaron con 0,2 g de BF₃-ET₂O. Después de 2 h se mezcló con acetato de etilo, tampón acuoso de citrato pH = 6, NaCl acuoso y la fase acuosa se extrajo tres veces con acetato de etilo. Las fases orgánicas combinadas se secaron con MgSO₄ y se evaporaron, el residuo se purificó por cromatografía en gel de sílice (éter de petróleo/acetona).

Rendimiento: 0,1 g logP(neutro) 1,54, [M+1) 291,1

RMN de 1 H (d₆-DMSO): 7,55 (dd, 1H), 8,0 (m, 2H), 8,05 (m, 1H), 8,3 (m, 1H), 8,4 (s, 1H), 8,55 (m, 1H), 9,2 (m, 2H), 9,7 (s, 1H)

25 **Ejemplo 6:**

20

5

2-(1-metil-1*H*-[1,2,4]triazol-3-il)-6-(1-piridin-3-il-1*H*-pirazol-4-il)-piridina

$$\begin{array}{c|c}
N & & & \\
N & & \\
N & & & \\
N & &$$

Se agitaron 0,57 g (2 mmol) de amida del ácido 6-(1-piridin-3-il-1*H*-pirazol-4-il)-piridin-2-carbotiónico y 2,5 ml (27 mmol) de 1-metil-1-formilhidrazina durante 6 h a 145 °C. Después de enfriar, la mezcla se purificó por cromatografía en gel de sílice (ciclohexano/acetona).

Rendimiento: 0,31 g (50 % d. t), logP (neutro) 1,29; [M+1] 304,2

5 RMN de 1 H (d₆-DMSO): 4 (s, 3H), 7,55 (m, 1H), 7,8 (m, 1H), 7,95 (m, 2H), 8,3 (m, 1H), 8,4 (s, 1H), 8,55 (s, 1H), 8,6 (m, 1H), 9,1 (s, 1H), 9,2 (m, 1H)

Ejemplo 7: 3-[6-(1-piridin-3-il-1H-pirazol-4-il)-piridin-2-il]-[1,2,4]triazina

Se calentaron 0,4 g (1,4 mmol) de amida del ácido 6-(1-piridin-3-il-1*H*-pirazol-4-il)-piridin-2-carbotiónico en 30 ml de etanol con 0,2 ml (4,1 mmol) de hidrato de hidrazina durante 20 min a reflujo, formándose una mezcla clara. Se mezcló con 0,6 ml de glioxal (solución acuosa al 40 %, equivalente a 4 mmol) y se calentó durante otros 20 min a reflujo. La mezcla se filtró y se evaporó, el residuo se purificó por cromatografía en gel de sílice (éter de petróleo/acetona).

Rendimiento: 0.13 g (29 % d. t), logP (neutro) 1.32, [M+1] 302.1

15 RMN de 1 H (d₆-DMSO): 7,55 (dd, 1H), 8,0 (m, 1H), 8,1 (m, 1H), 8,3 (m, 2H), 8,45 (s, 1H), 8,55 (m, 1H), 9,1 (d, 1H), 9,2 (m, 2H), 9,5 (m, 1H)

Ejemplo 8:

Etapa 1: N-metoxi-N-metil-1-(piridin-3-il)-1H-pirazol-4-carboxamida

- Se dispuso ácido 1-(piridin-3-il)-1H-pirazol-4-carboxílico (7,54 g, 39,8 mmol) bajo argón en diclorometano (190 ml) y se mezcló con dimetilformamida (2 ml). Luego se añadieron dicloruro de ácido oxálico (14,67 g, 115 mmol) a temperatura ambiente y la mezcla se agitó durante 1 h a temperatura ambiente. El disolvente se eliminó en el evaporador rotativo al vacío, el residuo se mezcló con tolueno (10 ml) y la mezcla se concentró. El cloruro de ácido se hizo reaccionar luego directamente.
- El cloruro de ácido se disolvió en dioxano (125 ml) y se añadió gota a gota diisopropiletilamina (base de Hünig, 22,9 g, 177 mmol). La mezcla se agitó luego durante 30 min a temperatura ambiente. Se suspendió clorhidrato de (metoxiamino)metano (4,32 g, 44,3 mmol) en dioxano (245 ml) y se añadió en porciones (ligera exotermia). La mezcla se agitó durante la noche a temperatura ambiente. Se filtró del material no disuelto. El filtrado se concentró y se mezcló con cloroformo. El sólido se filtró por succión y se purificó por cromatografía en columna (acetato de etilo).
- 30 Rendimiento: 6,510 g (63 % d.t), logP (HCOOH) 0,91, [M+1] 233,1

RMN de 1 H (d₆-DMSO): 3,27 (s, 3H), 3,77 (s, 3H), 7,53-7,57 (m, 1H), 8,14 (s, 1H), 8,27-8,30 (m, 1H), 8,58 (m, 1H), 8,89 (s, 1H), 9,14 (m, 1H)

Etapa 2: 1-[1-(piridin-3-il)-1H-pirazol-4-il]etanona

Se dispuso N-metoxi-N-metil-1-(piridin-3-il)-1H-pirazol-4-carboxamida (5,00 g, 21,5 mmol) bajo argón en THF seco (200 ml) y se enfrió hasta 0 °C. Se añadió gota a gota cloruro de metilmagnesio (17,9 ml, 3 M en THF) y la mezcla se agitó durante la noche a temperatura ambiente. La mezcla de reacción se combinó con solución saturada de cloruro de amonio (160 ml) y las fases se separaron. La fase acuosa se extrajo nuevamente con acetato de etilo y las fases orgánicas combinadas se secaron con sulfato de magnesio. El disolvente se eliminó en el evaporador rotativo al vacío.

Rendimiento: 4,110 g (99 % d.t), logP (HCOOH) 0,76, [M+1] 188,1

5

25

30

RMN de 1 H (d₆-DMSO): 2,47 (s, 3H), 7,57 (m, 1H), 8,21 (s, 1H), 8,28 (m, 1H), 8,59 (m, 1H), 9,14 (m, 1H), 9,19 (s, 1H)

10 Etapa 3: (2E)-3-(dimetilamino)-1-[1-(piridin-3-il)-1H-pirazol-4-il]prop-2-en-1-ona

Se reunieron 1-[1-(piridin-3-il)-1H-pirazol-4-il]etanona (860 mg, 4,59 mmol), dimetilformamida-dimetilacetal (6 ml) y dimetilformamida (6 ml) en un matraz redondo y la mezcla se calentó durante 6 h a 100 °C con un puente de destilación. La mezcla luego se enfrió y se concentró.

15 Rendimiento: 1,13 g (100 % d.t), logP (HCOOH) 0,93, [M⁺+1] 243,2

RMN de 1 H (d₆-DMSO): 3,01 (bs, 6H), 5,65 (d, 1H), 7,55 (m, 1H), 7,63 (d, 1H), 8,13 (s, 1H), 8,26 (m, 1H), 8,54 (m, 1H), 8,99 (s, 1H), 9,13 (m, 1H)

Etapa 4: 1'-(piridin-3-il)-1H,1'H-3,4'-bipirazol

20 (2E)-3-(dimetilamino)-1-[1-(piridin-3-il)-1H-pirazol-4-il]prop-2-en-1-ona (800 mg, 3,30 mmol) se dispuso en etanol (7 ml) y se vertió gota a gota hidrazina (6,60 ml, 6,60 mmol). La mezcla se calentó durante 5 h a reflujo, luego se enfrió y se concentró.

Rendimiento: 700 mg (100 % d.t), logP (HCOOH) 0,79, [M+1] 212,1

RMN de 1 H (d₆-DMSO): 6,51 (m, 1H), 7,54 (m, 1H), 7,73 (m, 1H), 8,09 (m, 1H), 8,22 (m, 1H), 8,52 (m, 1H), 8,81 (m, 1H), 9,11 (m, 1H), 12,65 (m, 1H)

Etapa 5: 1'-(piridin-3-il)-1-[4-(trifluorometil)pirimidin-2-il]-1H,1'H-3,4'-bipirazol

Se dispuso bajo argón en dimetilamida 1'-(piridin-3-il)-1H,1'H-3,4'-bipirazol (200 mg, 0,94 mmol). Se añadió hidruro de sodio (56,8 mg, 1,42 mmol, 60 % en aceite de parafina) y la mezcla se agitó durante 30 min a temperatura ambiente (ligera exotermia). Se añadió 2-cloro-4-trifluorometilpirimidina (173 mg, 0,94 mmol) y la mezcla se agitó durante la noche a 40 °C. A continuación, la mezcla se concentró y el residuo se agitó con diclorometano.

Rendimiento: 240 mg (71 % d.t), logP (HCOOH) 2,15, [M+1] 358,1

RMN de 1 H (d₆-DMSO): 7,00 (m, 1H), 7,56 (m, 1H), 7,90 (d, 1H), 8,31 (m, 2H), 8,56 (m, 1H), 8,73 (m, 1H), 9,10 (s, 1H), 9,17-9,22 (m, 2H)

Ejemplo 9: 2-(Pentafluoroetil)-4-[1-(piridin-3-il)-1H-pirazol-4-il]pirimidina

(2E)-3-(dimetilamino)-1-[1-(piridin-3-il)-1H-pirazol-4-il]prop-2-en-1-ona (200 mg, 0,82 mmol), metilato de sodio (56 mg, 1,03 mmol), 2,2,3,3,3-pentafluoropropionamidina (166 mg, 1,02 mmol) se dispusieron juntos en metanol (2 ml). La mezcla se agitó durante la noche a 55 °C. Se enfrió y se evaporó. El residuo se purificó por medio de cromatografía en columna (acetona, isopropanol, 1:1).

Rendimiento: 125 mg (44 % d.t), logP (HCOOH) 2,7, [M+1] 342,1

RMN de 1 H (d₆-DMSO): 7,58 (m, 1H), 8,13 (d, 1H), 8,33 (m, 1H), 8,52 (s, 1H), 8,61 (m, 1H), 9,03 (d, 1H), 9,18 (m, 1H), 9,37 (s, 1H)

10 **Ejemplo 10**

5

15

25

30

Etapa 1: 1-[6-(1-piridin-3-il-1*H*-pirazol-4-il)-piridin-2-il]-etanona

$$\begin{array}{c|c}
N & & \\
N &$$

Se agitaron 0,52 g (2,1 mmol) de 6-(1-piridin-3-il-1*H*-pirazol-4-il)-piridin-2-carbonitrilo bajo argón en 100 ml de THF con 1,5 ml de cloruro de metilmagnesio (3 M, equivalente a 24 mmol) y varias puntas de espátula de complejo de CuBr-dimetilsulfuro durante 2 h a temperatura ambiente. Se mezcló con ácido clorhídrico diluido, tampón de citrato y lejía de sosa diluida hasta pH = 9, así como NaCl acuoso y acetato de etilo. La fase acuosa se extrajo 3 veces con acetato de etilo, las fases orgánicas combinadas se secaron con MgSO₄ y se evaporaron. El residuo se purificó por cromatografía en gel de sílice (éter de petróleo /acetona).

Rendimiento: 0,12 g (20 % d. t), logP (neutro) 1,94 [M+1] 265,2

20 RMN de 1 H (d₆-DMSO): 2,7 (s, 3H), 7,55 (m, 1H), 7,8 (m, 1H), 8,0 (m, 2H), 8,3 (m, 1H), 8,45 (s, 1H), 5,8 (m, 1H), 9,2 (m, 2H)

Etapa 2: 2-(2-metil-1,3-dioxolan-2-il)-6-(1-piridin-3-il-1H-pirazol-4-il)-piridina

Se calentaron 0,13 g (0,49 mmol) de 1-[6-(1-piridin-3-il-1*H*-pirazol-4-il)-piridin-2-il]-etanona en 100 ml de 1,1,1-benzotrifluoruro con 0,1 g (0,58 mmol) de ácido 4-toluensulfónico y 1,8 ml (32 mmol) de 1,2-etanodiol en un aparato de reflujo con extractor Soxlet, que estaba cargado con tamiz molecular 4A, se calentó durante 2 h a reflujo. La mezcla de reacción se evaporó, el residuo se mezcló con acetato de etilo, lejía de sosa diluida, tampón de citrato hasta pH = 9, así como NaCl acuoso, la fase acuosa se extrajo dos veces con acetato de etilo, las fases orgánicas combinadas se secaron con MgSO₄ y se evaporaron. El residuo se purificó por cromatografía en gel de sílice (éter de petróleo/acetona).

Rendimiento: 0,12 g (75 % d. t), log P(neutro) 1,89, [M+1] 309,1

RMN de 1 H (d₆-DMSO): 1,7 (s, 3H), 3,9 (m, 2H), 4,1 (m, 2H), 7,4 (d, 1H), 7,55 (m, 1H), 7,7 (m, 1H), 7,8 (m, 1H), 8,3

(d, 1H), 8,35 (s, 1H), 8,55 (m, 1H), 9,1 (s, 1H), 9,2 (s, 1H)

Ejemplo 11

20

Etapa 1: 1-(6-bromo-piridin-2-il)-2-metoxi-etanona

Se disolvieron 14,5 g (61,2 mmol) de 2,6-dibromopiridina en aproximadamente 50 ml de THF y se mezclaron bajo argón con 35 ml de cloruro de isopropilmagnesio 2 M (equiv. 70 mmol). La mezcla se calentó. Se agitó durante otras 1,5 h a temperatura ambiente y 2 h a 30 °C, se enfrió con un baño de CO₂/EtOH y se mezcló con una solución de 8 g (68,2 mmol) de 2-metoxi-*N*,*N*-dimetil-acetamida en THF, se diluyó la cantidad espesa de reacción con más THF, se dejó descongelar, se mezcló con acetato de etilo, ácido cítrico acuoso, lejía de sosa diluida hasta pH = 6, NaCl acuosa, la fase acuosa se extrajo tres veces con acetato de etilo, se secaron las fases orgánicas combinadas con MgSO₄ y se evaporaron. El residuo se destiló al vacío en tubo de bolas y el destilado se recristalizó en un poco de trifluoruro de benceno.

Rendimiento (porcentual calculado a partir de dos preparaciones): 5,36 g (34 % d. t) logP (neutro) 1,73 [M+1] 232,0 (isótopo más pesado)

15 RMN de ¹H (CD₃CN): 3,4 (s, 3H), 4,85 (s, 2H), 7,75 (, 1H), 7,8 (m, 1H), 7,95 (m, 1H)

Etapa 2: 2-metoxi-1-[6-(1-piridin-3-il-1H-pirazol-4-il)-piridin-2-il]-etanona

Se agitaron 0,042 g (0,23 mmol) de cloruro de paladio (II), 0,27 g (1 mmol) de trifenilfosfano y 1 g de cloruro de tetrabutilamonio bajo argón en 20 ml de DMF durante 10 min a 100 °C y después de enfriar, se mezclaron con 0,9 g (3,9 mmol) de 1-(6-bromo-piridin-2-il)-2-metoxi-etanona, 0,98 g (3,6 mmol) de 3-[4-(4,4,5,5-tetrametil-[1,3,2]dioxaborolan-2-il)-pirazol-1-il]-piridina y 1 g (7,2 mmol) de carbonato de potasio. Se agitó durante otras 2 h a 105 °C. Después de enfriar, se evaporó, el residuo con NaCl acuoso, acetato de etilo, lejía de sosa diluida hasta pH = 9 y la fase acuosa se extrajo cuatro veces con acetato de etilo. Las fases orgánicas combinadas se secaron con MgSO₄ y se evaporaron. El residuo se purificó por cromatografía en gel de sílice (éter de petróleo/acetona).

25 Rendimiento: 0,62 g (58 % d. t), logP(HCOOH) 1,66 [M+1] 295,1

RMN de 1 H (d₆-DMSO): 3,4 (s, 3H) 5,2 (s, 2H), 7,54 (m, 1H), 7,8 (m, 1H), 8,05(m, 2H), 8,3 (m, 1H), 8945 (s, 1H), 8,55 (m, 1H), 9,2 (m, 2H)

Etapa 3: 2-(1,1-difluoro-2-metoxi-etil)-6-(1-piridin-3-il-1*H*-pirazol-4-il)-piridina

Se agitaron 0,2 g (0,68 mmol) de 2-metoxi-1-[6-(1-piridin-3-il-1*H*-pirazol-4-il)-piridin-2-il]-etanona con 1,5 ml (11,3 mmol) de trifluoruro de dietilaminoazufre en tetracloruro de carbono con dos gotas de ácido trifluoracético durante 1 h a 77 °C en un aparato de reflujo con matraz de PFA. Después de enfriar, se mezcló con hielo, luego tampón de citrato, lejía de sosa diluida hasta pH = 9, NaCl acuoso y acetato de etilo, La fase acuosa se extrajo 3 veces con acetato de etilo, las fases orgánicas combinadas se secaron con MgSO₄ y se evaporaron. El residuo se purificó por cromatografía en gel de sílice (éter de petróleo/acetona).

Rendimiento: 0,12 g (54 % d. t), logP (neutro) 2,3 [M+1] 317,2

RMN de 1 H (CD₃CN): (CD₃CN): 3,4 (s, 3H), 4,15 (t, 2H), 7,45 (m, 1H), 7,55 (m, 1H), 7,75 (d, 1H), 7,9 (dd,1H), 8,15 (m, 1H), 8,3 (s, 1H), 8,55 (m, 1H), 8,75 (s, 1H), 9,1 (m, 1H)

De modo análogo, se prepararon otros compuestos según la invención, que se enumeran en la tabla siguiente, en la que los ejemplos nº 1 a 11 representan los productos finales de los ejemplos de preparación descritos anteriormente de forma detallada.

Ejemplo Nº		logP (neutro)	logP (HCOOH)	[M ⁺ +1]	Datos de RMN de ¹ H /(Disolvente)
1		1,52	1,36	301,1	(CD ₃ CN): 7,45 (t, 1H), 7,5 (dd, 1H), 7,8 (d, 1H), 7,95 (t, 1H), 8,2 (m, 1H), 8,3 (d, 1H), 8,35 (s, 1H), 8,55 (d, 1H), 8,8 (s, 1H), 8,95 (m, 2H), 9,1 (d, 1H)
2			1,18	290,1	(D ₆ -DMSO): 7,19 (m, 1H), 7,48 (m, 1H), 7,60 (m, 1H), 8,33 (m, 1H), 8,40 (s, 1H), 8,43 (m, 1H), 8,58 (m, 1H), 8,90 (m, 2H), 9,19 (m, 1H), 9,24 (s, 1H)
3	N N F F		2,27	280,1	(D ₆ -DMSO): 6,97 (m, 1H), 7,57 (m, 1H), 8,28 (m, 1H), 8,31 (s, 1H), 8,44 (m, 1H), 8,58 (m, 1H), 9,13 (m, 2H)

Ejemplo Nº		logP (neutro)	logP (HCOOH)	[M ⁺ +1]	Datos de RMN de ¹ H /(Disolvente)
4	N N N F F		2,51	291,1	(D ₆ -DMSO): 7,56 (m, 1H), 7,72 (m, 1H), 8,09 (m, 2H), 8,31 (m, 1H), 8,40 (s, 1H), 8,56 (m, 1H), 9,18 (m, 2H)
5	N N N N N N N N N N N N N N N N N N N	1,54		291,1	(D ₆ -DMSO): 7,55 (dd, 1H), 8,0 (m, 2H), 8,05 (m, 1H), 8,3 (m, 1H), 8,4 (s, 1H), 8,55 (m, 1H), 9,2 (m, 2H), 9,7 (s, 1H)
6	N N N N N N N N N N N N N N N N N N N	1,29		304,2	(D ₆ -DMSO): 4 (s, 3H), 7,55 (m, 1H), 7,8 (m, 1H), 7,95 (m, 2H), 8,3 (m, 1H), 8,4 (s, 1H), 8,55 (s, 1H), 8,6 (m, 1H), 9,1 (s, 1H), 9,2 (m, 1H)
7		1,32		302,1	(D ₆ -DMSO): 7,55 (dd, 1H), 8,0 (m, 1H), 8,1 (m, 1H), 8,3 (m, 2H), 8,45 (s, 1H), 8,55 (m, 1H), 9,1 (d, 1H), 9,2 (m, 2H), 9,5 (m, 1H)

Ejemplo Nº		logP (neutro)	logP (HCOOH)	[M ⁺ +1]	Datos de RMN de ¹ H /(Disolvente)
8	N N N F F F		2,15	358,1	(D ₆ -DMSO): 7,00 (m, 1H), 7,56 (m, 1H), 7,90 (d, 1H), 8,31 (m, 2H), 8,56 (m, 1H), 8,73 (m, 1H), 9,10 (s, 1H), 9,17-9,22 (m, 2H)
9	F F F F F F F F F F F F F F F F F F F		2,7	342,1	(D ₆ -DMSO): 7,58 (m, 1H), 8,13 (d, 1H), 8,33 (m, 1H), 8,52 (s, 1H), 8,61 (m, 1H), 9,03 (d, 1H), 9,18 (m, 1H), 9,37 (s, 1H)
10		1,89		309,1	(D ₆ -DMSO): 1,7 (s, 3H), 3,9 (m, 2H), 4,1 (m, 2H), 7,4 (d, 1H), 7,55 (m, 1H), 7,7 (d, 1H), 7,8 (m, 1H), 8,3 (m, 1H), 8,35 (s, 1H), 8,55 (m, 1H), 9,1 (s, 1H), 9,2 (m, 1H)
11	N N N N N N N N N N N N N N N N N N N	2,3		317,2	(CD ₃ CN): 3,4 (s, 3H), 4,15 (t, 2H), 7,45 (m, 1H), 7,55 (m, 1H), 7,75 (d, 1H), 7,9 (dd,1H), 8,15 (m, 1H), 8,3 (s, 1H), 8,55 (m, 1H), 8,75 (s, 1H), 9,1 (m, 1H)

Ejemplo Nº		logP (neutro)	logP (HCOOH)	[M ⁺ +1]	Datos de RMN de ¹ H /(Disolvente)
12			0,81	223,1	(D ₆ -DMSO), 7,25 (m, 1H), 7,55 (m, 1H), 7,8 (m, 2H), 8,3 (m, 1H), 8,35 (s, 1H), 8,55 (m, 2H), 9,1 (s, 1H), 9,15 (m, 1H)
13	N N N N N N N N N N N N N N N N N N N		1,59	309,2	(D6-DMSO): 1,50 (m,1H), 2,08 (m, 1H), 4,02 (m, 2H), 4,18 (m, 2H), 5,53 (s, 1H), 7,40 (d, 1H), 7,56 (m, 1H), 7,77 (d, 1H), 7,86 (m, 1H), 8,30 (m, 1H), 8,33 (s, 1H), 8,54 (m, 1H), 9,07 (s, 1H), 9,16 (m, 1H)
14	F N N N N N N N N N N N N N N N N N N N		1,81	319,1	(D6-DMSO): 7,55 (m,1H), 7,92(m,1H), 8,05 (m,1H), 8,22 (m,1H), 8,31 (m,1H), 8,45 (m,1H), 8,55 (m,1H), 9,0 (m,2H), 9,10 (m,1H), 9,22 (m,1H)
15	N N N N F F		2,13	292	(D6-DMSO): 7,60 (m, 1H), 8,11 (d, 1H), 8,32 (m, 1H), 8,55 (s, 1H), 8,60 (m, 1H), 9,00 (d, 1H), 9,19 (m, 1H), 9,39 (s, 1H)

Ejemplo Nº		logP (neutro)	logP (HCOOH)	[M ⁺ +1]	Datos de RMN de ¹ H /(Disolvente)
16	N N N F F F F		2,1	388,1	(D6-DMSO): 3,40 (s, 3H), 7,56 (m, 1H), 7,77 (m, 2H), 8,04 (t, 1H), 8,28 (m, 1H), 8,35 (s, 1H), 8,57 (m, 1H), 9,10 (s, 1H), 9,16 (m, 1H)
17			1,24	294,1	(D6-DMSO): 3,04 (s, 6H), 7,39 (d, 1H), 7,55 (m, 1H), 7,84 (d, 1H), 7,93 (t, 1H), 8,29 (m, 1H), 8,37 (s, 1H), 8,55 (m, 1H), 9,12 (s, 1H), 9,17 (m, 1H)
18			1,23	336,2	(D6-DMSO): 3,67 (m, 8H), 7,46 (d, 1H), 7,56 (m, 1H), 7,86 (d, 1H), 7,95 (t, 1H), 8,36 (s, 1H), 8,55 (m, 1H), 9,10 (s, 1H), 9,17 (m, 1H)
19			2,21	289,2	(D6-DMSO): 6,59 (m, 1H), 7,57 (m, 1H), 7,72 (d, 1H), 7,78 (d, 1H), 7,81 (m, 1H), 8,00 (t, 1H), 8,33 (m, 1H), 8,49 (s, 1H), 8,57 (m, 1H), 8,91 (m, 1H), 9,20 (m, 1H), 9,27 (s, 1H)

Ejemplo Nº		logP (neutro)	logP (HCOOH)	[M ⁺ +1]	Datos de RMN de ¹ H /(Disolvente)
20	N CI		2,05	257	(D6-DMSO):7,34 (d, 1H), 7,56 (m, 1H), 7,78 (d, 1H), 7,88 (t, 1H), 8,30 (m, 1H), 8,36 (s, 1H), 8,56 (m, 1H), 9,13 (s, 1H), 9,17 (m, 1H)
21			2,64	317,2	(D6-DMSO): 2,22 (s, 3H), 2,72 (s, 3H), 6,12 (s, 1H), 7,56 (m, 1H), 7,66 (m, 2H), 7,95 (t, 1H), 8,28 (m, 1H), 8,36 (s, 1H), 8,57 (m, 1H), 9,09 (s, 1H), 9,16 (m, 1H)
22	N F F F F F		2,38	291,1	(D6-DMSO): 7,57 (m, 1H), 8,01 (m, 1H), 8,22 (m, 1H), 8,29 (m, 1H), 8,46 (s, 1H), 8,57 (m, 1H), 8,91 (m, 1H), 9,17 (m, 1H), 9,27 (s, 1H)
23			1,19	290,1	(D6-DMSO): 7,09 (s, 1H), 7,37 (m, 1H), 7,61 (m, 1H), 7,91 (m, 1H), 8,04 (m, 1H), 8,32 (m, 1H), 8,37 (m, 2H), 8,59 (m, 1H), 8,63 (m, 1H), 9,18 (m, 2H)

Ejemplo Nº		logP (neutro)	logP (HCOOH)	[M ⁺ +1]	Datos de RMN de ¹ H /(Disolvente)
24	N N Br		2,18	302	(D6-DMSO): 5,69 (s, 1H), 7,48 (d, 1H), 7,54 (m, 1H), 7,81 (m, 1H), 8,29 (m, 1H), 8,34 (s, 1H), 8,55 (m, 1H), 9,12 (s, 1H), 9,17 (m, 1H)
25	N N O F F F		2,96	321,1	(D6-DMSO): 5,11 (q, 2H), 6,82 (d, 1H), 7,49 (d, 1H), 7,58 (m, 1H), 7,82 (t, 1H), 8,28 (m, 1H), 8,39 (s, 1H), 8,56 (m, 1H), 9,15 (m, 2H)
26	N N F F F F F F F F F F F F F F F F F F		2,51	294,1	(D6-DMSO): 2,39 (s, 3H), 6,96 (m, 1H), 7,56 (m, 1H), 8,22 (m, 1H), 8,29 (m, 1H), 8,54 (m, 1H), 9,01 (s, 1H), 9,09 (m, 1H)
27	N N O O O O O O O O O O O O O O O O O O		2,87	282,1	(D6-DMSO): 1,50 (s, 9H), 7,41 (d, 1H), 7,56 (m, 1H), 7,62 (d, 1H), 7,76 (t, 1H), 8,23 (m, 1H), 8,28 (s, 1H), 8,55 (m, 1H), 9,00 (s, 1H), 9,13 (m, 1H), 9,19 (m, 1H)

Ejemplo Nº		logP (neutro)	logP (HCOOH)	[M ⁺ +1]	Datos de RMN de ¹ H /(Disolvente)
28			1,71	320,1	(D6-DMSO): 4,07 (s, 3H), 6,85 (d, 1H), 6,90 (m, 1H), 7,56 (m, 1H), 8,24 (s, 1H), 8,29 (m, 1H), 8,54 (m, 2H), 8,69 (m, 1H), 9,03 (s, 1H), 9,17 (m, 1H)
29	N N N F F		2,46	287,1	(D6-DMSO):2,09 (t, 3H), 7,55 (m, 2H), 7,91 (d, 1H), 8,00 (m, 1H), 8,31 (m, 1H), 8,40 (s, 1H), 8,57 (m, 1H), 9,16 (m, 2H)
30		1,73		248,1	(D6-DMSO): 7,55 (m, 1H), 7,85 (m, 1H), 8,1 (m, 2H), 8,3 (m, 1H), 8,4 (s, 1H), 8,55 (d, 1H), 9,15 (m, 1H), 9,25 (s, 1H)
31	N F N N N N		1,52	308,1	(D6-DMSO): 6,92 (m, 1H), 7,57 (m, 1H), 8,23-8,34 (m, 2H), 8,56 (m, 1H), 8,64 (m, 1H), 8,93 (m, 2H), 9,05 (s, 1H), 9,19 (m, 1H)

Ejemplo Nº		logP (neutro)	logP (HCOOH)	[M ⁺ +1]	Datos de RMN de ¹ H /(Disolvente)
32			2,18	324,1	(D6-DMSO): 2,08 (s, 3H), 3,63 (s, 3H), 4,39 (s, 2H), 6,55 (d, 1H), 7,03 (d, 1H), 7,53-7,59 (m, 2H), 8,21 (s, 1H), 8,24 (m, 1H), 8,54 (m, 1H), 8,92 (s, 1H), 9,12 (m, 1H)
33			1,33	290,1	(D6-DMSO): 6,92 (m, 1H), 7,45 (t, 1H), 7,56 (m, 1H), 8,26 (s, 1H), 8,29 (m, 1H), 8,55 (m, 1H), 8,69 (s, 1H), 8,87 (d, 1H), 8,90 (m, 1H), 9,06 (s, 1H), 9,17 (m, 1H)
34			1,17	301,1	(D6-DMSO): 7,54 (m,1H), 7,75 (m,1H), 7,95 (m,1H), 8,13 (m,2H), 8,39 (m,3H), 8,72 (m,1H), 9,0 (m,2H)
35	N N N F F		2,23	292,1	(D6-DMSO): 7,57 (m, 1H), 7,79 (d, 1H), 8,36 (m, 1H), 8,44 (s, 1H), 8,59 (m, 1H), 9,17 (d, 1H), 9,22 (m, 1H), 9,26 (s, 1H)

Ejemplo Nº		logP (neutro)	logP (HCOOH)	[M ⁺ +1]	Datos de RMN de ¹ H /(Disolvente)
36	N N N O		1,5	295,1	(D6-DMSO): 4,01 (m, 2H), 4,15 (m, 2H), 5,78 (s, 1H), 7,39 (d, 1H), 7,57 (m, 1H), 7,79 (d, 1H), 7,88 (t, 1H), 8,29 (m, 1H), 8,35 (s, 1H), 8,56 (m, 1H), 9,09 (s, 1H), 9,17 (m, 1H)
37	N N N N N N N N N N N N N N N N N N N		2,37	426,9	(D6-DMSO): 7,54 (m,1H), 7,90 (m,1H), 8,05 (m,1H), 8,23 (m,1H), 8,42 (m,1H), 8,75 (m,2H), 9,00 (m,2H), 9,20 (m,2H).
38	N N N O		2,12	253,1	(D6-DMSO): 3,96 (s, 3H), 6,68 (d, 1H), 7,40 (d, 1H), 7,60 (m, 1H), 7,75 (t, 1H), 8,32 (m, 1H), 8,38 (s, 1H), 8,57 (m, 1H), 9,16 (s, 1H), 9,19 (m, 1H)
39	N N N		0,39	223,1	(D6-DMSO): 7,45 (m, 1H), 7,55 (m, 1H), 8,1 (m, 1H), 8,25 (m, 1H), 8,35 (s, 1H), 8,45 (m, 1H), 8,55 (d, 1H), 8,95 (m, 1H), 9,1 (s, 1H), 9,15 (m, 1H)

	(continuation)								
Ejemplo Nº		logP (neutro)	logP (HCOOH)	[M ⁺ +1]	Datos de RMN de ¹ H /(Disolvente)				
40	N F F		2,04	287,1	(D6-DMSO): 2,04 (t, 3H), 7,56 (m, 1H), 7,91 (d, 1H), 8,01 (m, 1H), 8,29 (m, 1H), 8,41 (s, 1H), 8,56 (m, 1H), 8,77 (m, 1H), 9,17 (m, 1H), 9,19 (s, 1H)				
41	N N N F F F		3,18	357,1	(D6-DMSO): 6,95 (s, 1H), 7,56 (m, 1H), 7,81 (m, 1H), 8,24-8,31 (m, 4H), 8,55 (m, 1H), 8,63 (s, 1H), 9,05 (s, 1H), 9,16 (s, 1H)				
42			1,81	323,1	(D6-DMSO): 6,84 (m, 1H), 7,55 (m, 2H), 8,18 (m, 2H), 8,29 (m, 2H), 8,54 (m, 2H), 8,96 (s, 1H), 9,15 (m, 1H)				
43	N N N N N F F		3,22	357,1	(D6-DMSO): 6,96 (s, 1H), 7,56 (m, 1H), 8,17 (d, 1H), 8,28 (m, 2H), 8,38 (m, 1H), 8,55 (m, 1H); 8,72 (s, 1H), 8,85 (s, 1H), 9,05 (s, 1H), 9,17 (m, 1H)				

	(oshanasish)								
Ejemplo Nº		logP (neutro)	logP (HCOOH)	[M ⁺ +1]	Datos de RMN de ¹ H /(Disolvente)				
44	N N N N N N N N N N N N N N N N N N N		1,56	362,1	(D6-DMSO): 4,00 (s, 6H), 6,35 (s, 1H), 7,57 (m, 1H), 7,93 (d, 1H), 8,32 (m, 1HG), 8,53 (s, 1H), 8,58 (m, 1H), 8,93 (d, 1H), 9,18 (m, 1H), 9,33 (s, 1H)				
45			1,75	297,1	(D6-DMSO): 3,40 (s, 6H), 5,31 (s, 1H), 7,35 (d, 1H), 7,57 (m, 1H), 7,62 (d, 1H), 7,77 (m, 1H), 8,30 (m, 1H), 8,34 (s, 1H), 8,56 (m, 1H), 9,07 (s, 1H), 9,16 (m, 1H)				
46	N N N N		0,86	302,1	(D6-DMSO): 7,60 (m, 1H), 7,68 (m, 1H), 8,00 (m, 1H), 8,38 (m, 1H), 8,59 (m, 2H), 9,04 (m, 3H), 9,22 (m, 1H), 9,45 (s, 1H)				
47			1,55	307	(D6-DMSO): 7,36 (m, 1H), 7,58 (m, 1H), 7,92 (t, 1H), 8,16 (d, 1H), 8,22 (s, 1H), 8,32-8,36 (m, 2H), 8,58 (m, 1H), 8,63 (m, 1H), 9,19 (m, 1H), 9,22 (s, 1H)				

Ejemplo Nº		logP (neutro)	logP (HCOOH)	[M ⁺ +1]	Datos de RMN de ¹ H /(Disolvente)
48	N-N H F		1,52	302,1	(D6-DMSO): 3,79 (m, 2H), 6,17 (m, 1H), 6,47 (d, 1H), 6,73 (m, 1H), 6,99 (d, 1H), 7,45 (t, 1H), 7,54 (m, 1H), 8,24 (s, 1H), 8,26 (m, 1H), 8,54 (m, 1H), 8,64 (s, 1H), 9,15 (m, 1H)
49		1,69		353,2	
50	F F F		2,98	290,1	(D6-DMSO): 7,55 (m, 1H), 7,75 (m, 2H), 7,95 (m, 2H), 8,3 (d, 1H), 8,35 (s, 1H), 8,55 (m, 1H), 9,15 (m, 2H)
51	Z, Z, Z		2,71	256,1	(D6-DMSO): 7,45 (m, 2H), 7,55 (m, 1H), 7,75 (m, 2H), 8,25 (m, 2H), 8,55 (ancho, 1H), 9 (s, 1H), 9,15 (ancho, 1H)

Ejemplo N°		logP (neutro)	logP (HCOOH)	[M ⁺ +1]	Datos de RMN de ¹ H /(Disolvente)
52	F F F F		2,99	290,1	(D6-DMSO): 7,55-7,7 (m, 3H), 8,05 (m, 2H), 8,3 (d, 1H), 8,4 (s, 1H), 8,55 (m, 1H), 9,15 (m, 2H)
53			2,12	252,1	(D6-DMSO): 3,8 (s, 3H), 7 (m, 2H), 7,55 (m, 1H), 7,6 (m 2H), 8,15 (s, 1H), 8,25 (d, 1H), 8,5 (m, 1H), 8,9 (s, 1H), 9,1 (m, 1H)
54			1,63	290,1	(D6-DMSO): 7,59-7,62(m,1H), 7,88-7,90(m,1H), 7,91-7,93(m,1H), 8,13(t,1H), 8,23(s,2H), 8,36-8,38(m,1H), 8,46(s,1H), 8,58-8,59(m,1H), 9,28(s,1H)
55			1,4	308,2	(D6-DMSO): 4,21(t,2H), 4,56(t,2H), 7,54-7,60(m,1H), 7,64-7,69(m,1H), 7,88-7,95(m,2H), 8,33-8,35(m,1H), 8,38(s,1H), 8,56-8,57(m,1H), 9,18- 9,20(m,2H)
56			1,31	301,1	(D6-DMSO): 3,42(s,3H), 7,59-7,63(m,1H), 7,87-7,89(m,1H), 8,11-8,13(m,1H), 8,20(t,1H), 8,33-8,36(m,1H), 8,54(s,1H), 8,58-8,60(m,1H), 9,21-9,22(m,1H), 9,37(s,1H)
57	F F NH		2,12	348,2	(D6-DMSO): 4,12-4,21(m,2H), 7,57-7,63(m,2H), 7,91- 7,94(m,1H), 7,98-8,06(m,2H), 8,25-8,29(m,1H), 8,54- 8,59(m,1H), 8,63(s,1H), 9,15- 9,16(m,1H), 9,22(ancho,NH), 9,31(s,1H)

Ejemplo N°		logP (neutro)	logP (HCOOH)	[M ⁺ +1]	Datos de RMN de ¹ H /(Disolvente)
58		1,68	1,54	321,1	(D6-DMSO): 2,78(s,3H), 3,02-3,05(m,2H), 4,50-4,52(m,2H), 7,56-7,59(m,1H), 7,63(d,1H), 7,75(d,1H), 7,77-7,84(m,1H), 8,31-8,35(m,2H), 8,55-8,56(m,1H), 9,12(s,1H), 9,18-9,19(m,1H)
59	N N F F F	3,14	3,1	309,1	(D6-DMSO): 7,77-7,79(m,1H), 8,10-8,19(m,2H), 8,36-8,39(m,1H), 8,49-8,50(m,1H), 8,60-8,61(m,1H), 9,12-9,13(m,1H), 9,32-9,33(m,1H)
60		2,12	1,97	335,2	(D6-DMSO): 0,38-0,42(m,2H), 0,66-0,70(m,2H), 3,37-3,40(m,2H), 4,30-4,33(m,2H), 5,62(s,1H), 7,44-7,46(m,1H), 7,56-7,60(m,1H), 7,80-7,82(m,1H), 7,88-7,92(m1H), 8,31-8,35(m,1H), 8,38(s,1H), 8,55-8,57(m,1H), 9,17(s,1H), 9,19-9,20(m,1H)
61			1,68	290,2	(D6-DMSO): 7,61-7,64(m,1H), 7,92-7,94(m,1H), 7,98-8,00(m,1H), 8,08-8,09(m,1H), 8,16(t,1H), 8,3-8,35(m,1H), 8,59-8,62(m,2H), 9,21-9,23(m,2H), 9,44-9,45(m,1H)
62			2,16	331,1	(D6-DMSO): 1,22-1,25(m,2H), 1,29-1,33(m,2H), 2,46-2,48(m,1H), 7,57-7,61(m,1H), 7,87-7,90(m,1H), 7,98-8,00(m,1H), 8,03-8,08(m,1H), 8,33-8,36(m,1H), 8,43(s,1H), 8,57-8,58(m,1H), 9,20-9,21(m,1H), 9,23(s,1H)
63	F N N N N N N N N N N N N N N N N N N N		2,02	273,0	(D6-DMSO): 6,97(t,1H), 7,56-7,61(m,2H), 7,98(d,1H), 8,06(t,1H), 8,32-8,35(m,1H), 8,43(s,1H), 8,57-8,58(m,1H), 9,18-9,19(m,1H), 9,24(s,1H)

Ciarril.	\ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \ \							
Ejemplo N°		logP (neutro)	logP (HCOOH)	[M ⁺ +1]	Datos de RMN de ¹ H /(Disolvente)			
64	N N NH		1,14	290,1	(D6-DMSO): 7,61-7,64(m,1H), 7,85-7,98(m,2H), 8,03(t,1H), 8,14(s,1H), 8,27-8,30(m,1H), 8,59-8,60(m,1H), 8,67(s,1H), 9,16-9,17(m,1H), 9,42(s,1H)			
65	CI N N		3,22	297,1	(D6-DMSO): 1,51-1,54(m,2H), 1,81-1,85(m,2H), 7,57-7,60(m,1H), 7,63-7,68(m,2H), 7,86-7,90(m,1H), 8,30-8,33(m,1H), 8,36(s,1H), 8,55-8,57(m,1H), 9,16(s,1H), 9,18-9,19(m,1H)			
66	F N N N N N N N N N N N N N N N N N N N	3,22		315,1	(D6-DMSO): 1 (d, 6H), 2,9 (sep, 1H), 7,5 (d, 1H), 7,55 (dd, 1H), 8,4 (m, 1H), 8,0 (m, 1H), 8,3 (m, 1H), 8,4 (s, 1H), 8,55 (d, 1H), 9,15 (s, 1H), 9,2 (m, 1H)			
67		2,84		293,2	(CD3CN): 1,2 (d, 6H), 4,25 (sep, 1H), 7,5 (m, 1H), 7,85 (m, 2H), 7,95 (m, 1H), 8,2 (m, 1H), 8,35 (s, 1H), 8,55 (m, 1H), 8,8 (s, 1H), 9,2 (m, 1H)			
68	N N N N N N N N N N N N N N N N N N N	1,56	1,51	310,1	(D6-DMSO): 1,47-1,50(m,1H), 2,02-2,09(m,1H), 3,96-4,02(m,2H), 4,16-4,20(m,2H), 5,54(s,1H), 7,41-7,43(m,1H), 7,79-7,81(m,1H), 7,89-7,93(m,1H), 8,46(s,1H), 9,17(s,1H), 9,24(s,1H), 9,40(s,2H)			
69			1,78	323,2	(D6-DMSO): 1,36-1,42(m,1H), 1,51(s,3H), 1,86-1,92(m,1H), 3,74- 3,80(m,2H), 3,88-3,92(m,2H), 7,37(d,1H), 7,57-7,60(m,1H), 7,73- 7,75(m,1H), 7,88-7,92(m,1H), 8,32- 8,35(m,1H), 8,37(s,1H), 8,56- 8,58(m,1H), 9,14(s,1H), 9,19- 9,20(m,1H)			

Ejemplo Nº		logP (neutro)	logP (HCOOH)	[M ⁺ +1]	Datos de RMN de ¹ H /(Disolvente)
70		(ISSEE)	1,66	305,1	(D6-DMSO): 2,71(s,3H), 7,61-7,64(m,1H), 7,91-7,94 (m,1H), 8,00-8,02(m,1H), 8,06-8,09(m,1H), 8,37-8,41(m,1H), 8,45(s,1H), 8,58-8,60(m,1H), 9,26(s,1H)
71			2,37	337,2	(D6-DMSO): 1,20(d,6H), 1,22(m,1H), 1,68(m,1H), 4,00(m2H), 5,55(s,1H), 7,41(d,1H), 7,55(m,1H), 7,75(d,1H), 7,86(m,1H), 8,28(m,m1H), 8,33(s,1H), 8,54(m,1H), 9,07(s,1H), 9,16(m,1H)
72				323,2	Observaciones: Mezcla de isómeros 58 % (logPHCOOH 2,13) y 42 % (logPHCOOH 2,09)
73	N N O O O O O O O O O O O O O O O O O O	2,13	2,12	327,2	(D6-DMSO): 1,40-1,51(m,1H), 2,02-2,11(m,1H), 3,96-4,04(m,2H), 4,16-4,20(m,2H), 5,54(s,1H), 7,40-7,42(m,1H), 7,78-7,81(m,1H), 7,89-7,92(m,1H), 8,32-8,36(m,1H), 8,42(s,1H), 8,57-8,58(m,1H), 9,11-9,12(m,1H), 9,23(s,1H)
74	F ON N N N N N N N N N N N N N N N N N N		2,77	359,1	(D6-DMSO): 7,58-7,62(m,1H), 8,01-8,04(m,1H), 8,08-8,16(m,2H), 8,34-8,37(m,1H), 8,47(s,1H), 8,58- 8,59(m,1H), 9,21-9,22(m,1H), 9,28(s,1H)
75			1,9	321,1	(D6-DMSO): 4,49(m,2H), 4,55(m,2H), 5,06(s,2H), 5,69(s,1H), 7,39(d,1H), 7,54(m,1H), 7,78(d,1H), 7,86(t,1H), 8,30(m,1H), 8,33(s1H), 8,54(m,1H), 9,08(s,1H), 9,16(m,1H)
76		1,69	1,575	290,1	(D6-DMSO): 7,48-7,49(m,1H), 7,58-7,61(m,2H), 7,93- 8,06(m,3H), 8,34-8,37(m,2H), 8,57-8,59(m,1H), 9,20- 9,21(m,1H), 9,25(s,1H)

Ejemplo N°		logP (neutro)	logP (HCOOH)	[M ⁺ +1]	Datos de RMN de ¹ H /(Disolvente)
77			2,51	303,2	(D6-DMSO): 2,31(s,3H), 6,38-6,39(m,1H), 7,55-7,59(m,1H), 7,64-7,70(m,2H), 7,93-7,98(m,1H), 8,29-8,33(m,1H), 8,47-8,48(m,1H), 8,56-8,57(m,1H), 8,77-8,78(m,1H), 9,19-9,20(m,1H), 9,24-9,25(m,1H)
78	N N N OH		1,49	305,1	(D6-DMSO): 2,21(s,3H), 7,09(ancho,2H), 7,60-7,63(m,1H), 7,81-7,83(m,1H), 7,92-7,95(m,2H), 8,29-8,33(m,1H), 8,57-8,59(m,1H), 8,63(s,1H), 9,19-9,20(m,1H), 9,47(s,1H)
79			2,59	303,1	(D6-DMSO): 2,16-2,17(m,3H), 7,56-7,72(m,4H), 7,94-7,98(m,1H), 8,30-8,33(m,1H), 8,47-8,48(m,1H), 8,56-8,58(m,1H), 8,66-8,67(m,1H), 9,19-9,20(m,1H), 9,24-9,25(m,1H)
80			1,86	306,1	(D6-DMSO): 2,04-2,13(m,2H), 2,57-2,62(m,2H), 4,16(t,2H), 7,49-7,52(m,1H), 7,54-7,58(m,1H), 7,79-7,83(m,1H), 8,13-8,16(m,1H), 8,26-8,30(m,1H), 8,34(s,1H), 8,52-8,56(m,1H), 9,07(s,1H), 9,16-9,17(m,1H)
81			1,59	320,2	(D6-DMSO): 1,83-1,95(m,4H), 2,50-2,53(m,2H), 4,00(t,2H), 7,54- 7,57(m,2H), 7,60-7,63(m,1H), 7,77-7,81(m,1H), 8,27-8,30(m,1H), 8,34(s,1H), 8,54-8,56(m,1H), 9,08(s,1H), 9,16-9,17(m,1H)
82			2,23	390,1	(D6-DMSO): 1,36(t,6H), 4,44(q,4H), 6,28(s,1H), 7,56- 7,60(m,1H), 7,92(d,1H), 8,29- 8,33(m,1H), 8,52(s,1H) 8,58- 8,60(m,1H), 8,93(d,1H), 9,17- 9,18(m,1H), 9,32(s,1H)

Ejemplo		logP	logP	+ ·-	
Nº		(neutro)	(HCOOH)	[M ⁺ +1]	Datos de RMN de ¹ H /(Disolvente)
83			1,51	300,1	(D6-DMSO): 2,53(s,6H), 7,54-7,57(m,1H), 8,04(s,1H), 8,25(s,1H), 8,26-8,28(m,1H), 8,54-8,55(m,1H), 8,97-8,98(m,1H), 9,14-9,15(m,1H)
84		1,45	0,9	292,1	(D6-DMSO): 4,03(t,2H), 4,47(t,2H), 7,55-7,61(m,1H), 7,85-7,89(m,1H), 7,92-7,98(m,2H), 8,32-8,37(m,1H), 8,39(s,1H), 8,56-8,59(m,1H), 9,18- 9,23(m,2H)
85			1,66	295,1	(D6-DMSO): 3,45 (s, 3H), 5,2 (s, 2H), 7,55 (dd, 1H), 7,8 (m, 1H), 8,05 (m 2H), 8,3 (d, 1H), 8,45 (s, 1H), 8,6 (m, 1H), 9,2 (m, 2H)
86	H,N N	1,3	0,29	238,1	(D6-DMSO): 5,88(ancho,1H), 6,35(d,1H), 6,93(d,1H), 7,42(t,1H), 7,54-7,58(m,1H), 8,22(m,1H), 8,26- 8,30(m,1H), 5,53-8,55(m1H), 8,97(s,1H), 9,15(d,1H)
87	F NH N N N N N N N N N N N N N N N N N N	1,69	1,53	348,1	(D6-DMSO): 4,10-4,19(m,2H), 7,57-7,61(m,1H), 7,94-7,96(m,1H), 8,29-8,36(m,2H), 8,48(s,1H), 8,56- 8,58(m,1H), 9,05-9,06(m,1H), 9,20(d,1H), 9,26(t,1H), 9,33(s,1H)
88			1,91	326,0	(CDCl3): 7,30-7,69 (m,3H), 7,88-7,95 (m,1H), 8,22-9,05 (m,6H), 9,30 (m,1H)
89			1,37	316,1	(D6-DMSO): 6,36-6,40(m,1H), 6,50-6,53(m,1H), 7,50-7,58(m,2H), 7,65-7,68(m,1H), 7,83-7,86(m,1H), 7,98-8,03(m,2H), 8,28-8,32(m,1H), 8,40(s,1H), 8,55-8,56(m,1H), 9,16-9,18(m,2H)

	(55								
Ejemplo Nº		logP (neutro)	logP (HCOOH)	[M ⁺ +1]	Datos de RMN de ¹ H /(Disolvente)				
90		2,53	2,37	335,1	(D6-DMSO): 1,56-1,69(m,1H), 1,70-1,78(m,1H), 2,18-2,26(m,2H), 2,30-2,40(m,2H), 4,00-4,07(m,1H), 4,19(d,1H), 5,81(s,1H), 7,35(d,1H), 7,56-7,59(m,1H), 7,81(d,1H),7,91(t,1H), 8,31-8,33(d,1H), 8,39(s,1H), 8,55-8,57(m,1H), 9,18-9,20(m,2H)				
91	NH NH		0,84	280,2	(D6-DMSO): 3,94(s,3H), 7,56-7,59(m,1H), 7,66-7,68(m,1H), 7,90-7,93(m,1H), 7,96-8,00(m,1H), 8,50(s,1H), 8,55-8,57(m,1H), 9,19-9,20(m,1H), 9,49(ancho,1H)				
92		1,98		299,2	(CD3CN): 3,4 (s, 3H), 3,9 (m, 2H), 5,7 (m, 1H), 7,3 (m, 1H), 7,5 (m, 1H) 7,6 (d, 1H), 7,8 (m, 1H), 8,15 (d, 1H), 8,25 (s, 1H), 8,55 (m, 1H), 8,7 (s, 1H), 9,1 (m, 1H)				
93			1,16	290,1					
94	O NH		1,31	280,1	(D6-DMSO): 2,13(s,3H), 7,46-7,48(m,1H), 7,54-7,58(m,2H), 7,78(t,1H), 7,89(d,1H), 8,23-8,27(m,1H), 8,29(s,1H), 8,54-8,56(m,1H), 9,02(s,1H), 9,12-9,13(m,1H), 10,15(s,1H)				
95			1,32	229,0	(D6-DMSO): 7,54-7,56(m,1H), 7,66(d,1H), 7,84(d,1H), 8,26(s,1H), 8,28-8,32(m,1H), 8,55-8,57(m,1H), 9,13(d,1H), 9,16-9,17(m,1H)				
96	HN-N N	0,32	1,36	291,1	(D6-DMSO): 5,7 (ancho, 1H), 7,65 (dd, 1H), 8-8,15 (m, 3H), 8,3 (d, 1H), 8,6 (m, 1H), 8,65 (s, 1H), 9,2 (m, 1H), 9,4 (s, 1H)				

Ejemplo Nº		logP (neutro)	logP (HCOOH)	[M ⁺ +1]	Datos de RMN de ¹ H /(Disolvente)
97	N N N N N N N N N N N N N N N N N N N	1,2	0,95	305,1	(D6-DMSO): 4,4 (s, 2H), 7,6 (dd, 1H), 7,95 (d, 1H), 8,3 (d, 1H), 8,35 (d, 1H), 8,5 (s, 1H), 8,6 (d, 1H), 9,05 (m, 1H), 9,2 (m, 1H), 9,3-9,4 (m, 2H),
98	NH-N N		0,78	212,1	(D6-DMSO): 6,51(ancho,1H), 7,48-7,57(m,1H), 7,71(ancho,1H), 8,08(ancho,1H), 8,19-8,27(m,1H), 8,52(ancho,1H), 8,81(s,1H), 9,12(ancho,1H)
99		1,96	1,83	295,1	(D6-DMSO): 1,37(t,3H), 4,39(q,2H), 7,57-7,61(m,1H), 7,88- 7,93(m,1H), 8,01-8,07(m,2H), 8,32- 8,35(m,1H), 8,42(s,1H), 8,56- 8,58(m,1H), 9,18-9,22(m,1H), 9,33(s,1H)
100			0,46	349,1	(D6-DMSO): 2,30-2,40(m,1H), 3,50(m,2H), 3,67(m,2H), 7,39-7,42(m,1H), 7,54-7,58(m,1H), 7,83-7,85(m,1H), 7,94(t,1H), 8,27-8,31(m,1H), 8,34-8,35(m,1H), 8,55-8,57(m,1H), 9,10-9,11(m,1H), 9,16-9,17(m,1H)
101		1,24	0,01	223,1	(D6-DMSO): 7,55 (m, 1H), 7,7 (d, 2H), 8,25 (d, 1H), 8,4 (s, 1H), 8,55 (m, 3H), 9,15 (m, 1H), 9,2 (s, 1H)
102			1,64	335,1	(D6-DMSO): 7,06(d,1H), 7,54-7,58(m,1H), 8,29-8,32(m,2H), 8,55-8,57(m,1H), 8,79-8,80(m,1H), 9,13-9,14(m,1H), 9,17-9,18(m,1H), 9,57(s,1H)
103	HN N	2,28	2,21	334,0	(D6-DMSO): 7,60 (m,1H), 7,75 (m,1H), 7,80 (m,1H), 7,99 (m,1H), 8,32 (m,1H), 8,38 (m,1H), 8,60 (m,1H), 9,20 (m,2H), 11,9 (m,1H)

Fiomple		logD	logD.	<u> </u>	
Ejemplo Nº		logP (neutro)	logP (HCOOH)	[M ⁺ +1]	Datos de RMN de ¹ H /(Disolvente)
104		2,55	2,44	337,1	(D6-DMSO):0,78(s,3H), 1,25(s,3H), 3,66-3,69(m,4H), 5,44(s,1H), 7,44(d,1H), 7,53- 7,56(m,1H), 7,76(m,1H),7,88(m,1H), 8,28(m1H), 8,30(s,1H), 8,54(m,1H), 9,07(s,1H), 9,15(m1H)
105	F N N N		1,77	241,1	(D6-DMSO): 6,97-7,00(m,1H), 7,54-7,58(m,1H), 7,71- 7,74(m,1H), 7,98-8,04(m,1H), 8,27-8,31(m,1H), 8,35(s,1H), 8,55-8,57(m,1H), 9,13- 9,14(m,1H), 9,16-9,17(m,1H)
106	F NH ₂	1,59	0,64	256,1	(D6-DMSO): 5,90 (m,2H), 6,38 (m,1H), 6,95 (m,1H), 7,43 (m,1H), 8,28 (m,2H), 8,57 (m,1H), 9,05 (m,2H)
107	N N F F	2,38	2,36	292,1	(D6-DMSO): 7,77-7,79(m,1H), 8,11-8,19(m,2H), 8,54(s,1H), 9,19(s,1H), 9,34(s,1H), 9,41(s,2H)
108	N N N		2,2	266,1	(D6-DMSO): 7,89-7,94(m,1H), 8,12-8,15(m,2H), 8,34- 8,38(m,1H), 8,52(s,1H), 8,60- 8,61(m,1H), 9,12-9,13(m,4H), 9,37(s,1H)
109	N O O F F F F F	2,18	2,11	416,0	(D6-DMSO): 4,12 (m,2H), 7,60 (m,1H), 8,32 (m,2H), 8,60 (m,2H), 8,87 (m,1H), 9,20 (m,1H), 9,45 (m,2H)

(continuación)

Ejemplo Nº		logP (neutro)	logP (HCOOH)	[M ⁺ +1]	Datos de RMN de ¹ H /(Disolvente)
110			1,56	251,1	(D6-DMSO): 7,54-7,59(m,1H), 7,77-7,82(m,1H), 8,07- 8,09(m,2H), 8,29-8,34(m,1H), 8,45(s,1H), 8,56-8,58(m,1H), 9,17-9,18(m,1H), 9,22(s,1H), 10,05(s,1H)
111	Br N		2,17	379,0	(D6-DMSO): 7,55 (m,1H), 7,91 (m,1H), 8,03 (m,1H), 8,21 (m,1H), 8,45 (m,1H), 8,65 (m,2H), 8,99 (m,2H), 9,20 (m,2H)
112			1,37	289,1	(D6-DMSO): 7,54-7,57(m,2H), 8,11(s,2H), 8,18-8,23(m,2H), 8,51-8,55(m,2H), 8,79- 8,82(m,2H), 8,84(s,2H), 9,09- 9,10(m,2H)
113	N N N N N N N N N N N N N N N N N N N		0,89	224,1	(D6-DMSO): 7,55 (m, 1H), 7,85 (d, 1H), 8,3 (d, 1H), 8,5 (s, 1H), 8,6 (m, 1H), 8,8 (d, 1H), 9,1 (s, 1H), 9,2 (m, 1H), 9,3 (s, 1H)
114	HN NH		0,86	281,0	(D6-DMSO): 5,96(m,2H), 7,56(m,1H), 7,70-7,83(m,3H), 8,28(m1H), 8,49(s,1H), 8,55(m,2H), 9,18(m,1H), 9,30(s,1H), 9,72(s,1H)

Según los procedimientos de preparación descritos anteriormente, se obtuvieron los productos intermedios de la fórmula (VI) siguientes.

Ejemplo nº		logP (neutro)	logP (HCOOH)	[M ⁺ +1]	Datos de RMN de ¹ H/(Disolvente)
VI-1	N B O		2,19	272,2	(d ₆ -DMSO): 1,30(s,12H), 7,51(m,1H), 7,90(s,1H), 8,25(m,1H), 8,51(m,1H), 8,73(s,1H), 9,12(m,1H)
VI-2	F N B O		2,88	290,1	(d ₆ -DMSO): 1,30 (s,12H), 7,96(s,1H), 8,28-8,32(m,1H), 8,55-8,56(m,1H), 8,91(s,1H), 9,08(s,1H)
VI-3	N B O		2,10	273,2	(d ₆ -DMSO):1,30 (s,12H), 8,00 (s,1H), 8,94 (s,1H), 9,15 (s,1H), 9,36(s,2H)

Ejemplos biológicos

Ejemplo N.º 1

5

10

Ensayo de Myzus (tratamiento de pulverización)

Disolvente: 78 partes en peso de acetona

1,5 partes en peso de dimetilformamida

Emulsionante: 0,5 partes en peso de alquilarilpoliglicoléter

Para obtener una preparación de principio activo conveniente, se mezclan 1 parte en peso de principio activo con las cantidades indicadas de disolvente y emulsionante y se diluye el concentrado con agua con contenido de emulsionante hasta la concentración deseada. Se rocían discos de hojas de repollo (*Brassica pekinensis*), que están infestados por todos los estadios del pulgón verde del melocotonero (Myzus persicae), con una preparación de principio activo de la concentración deseada.

Después de 6 días, se determinó la acción en %. En este caso, 100 % significa que se exterminaron todos los pulgones de las hojas; 0 % significa que no se exterminó ningún pulgón de las hojas.

15 En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran un efecto del 80 % con una cantidad de aplicación de 500g/ha : 35, 105, 110, 112.

En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran un efecto del 80 % con una cantidad de aplicación de 100g/ha : 25.

En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una acción del 90 % con una cantidad de aplicación de 500g/ha :

```
8, 13, 14, 16, 29, 40, 43, 50, 51, 61, 65, 87, 92, 95, 96, 97, 103, 106, 107, 108, 109.
```

En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una acción del 100 % con una cantidad de aplicación de 500g/ha :

```
1, 2, 3, 4, 5, 6, 7, 9, 10, 11, 12, 15, 17, 18, 19, 21, 22, 23, 24, 26, 27, 28, 30, 31, 32, 33, 34, 36, 37, 38, 39, 42, 44, 45, 46, 47, 48, 49, 54, 56, 57, 58, 59, 60, 62, 63, 64, 66, 67, 68, 69, 70, 71, 72, 73, 74, 75, 76, 77, 78, 79, 80, 81, 82, 83, 84, 85, 86, 88, 89, 90, 91, 93, 94, 98, 99, 100, 101, 102.
```

En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una acción del 100 % con una cantidad de aplicación de 100 g/ha : 55.

Ejemplo N.º 2

5

10

20

30

35

40

Ensayo de Phaedon (tratamiento de pulverización)

15 Disolvente: 78.0 partes en peso de acetona

1,5 partes en peso de dimetilformamida

Emulsionante: 0,5 partes en peso de alquilarilpoliglicoléter

Para obtener una preparación de principio activo conveniente, se mezclan 1 parte en peso de principio activo con las cantidades indicadas de disolvente y emulsionante y se diluye el concentrado con agua con contenido de emulsionante hasta la concentración deseada. Se rocían discos de hojas de repollo (*Brassica pekinensis*) con una preparación de principio activo de la concentración deseada y después de secar, se ocupan con larvas de *Phaedon cochleariae*.

A los 7 días, se determinó la acción en %. En este caso, 100 % significa que se exterminaron todas las larvas de escarabajo; 0 % significa que no se exterminó ninguna larva de escarabajo.

En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una acción del 100 % con una cantidad de aplicación de 500 g/ha : 16, 22.

Ejemplo N.º 3

Ensayo de Spodoptera frugiperda (tratamiento de pulverización)

Disolvente: 78,0 partes en peso de acetona

1,5 partes en peso de dimetilformamida

Emulsionante: 0,5 partes en peso de alquilarilpoliglicoléter

Para obtener una preparación de principio activo conveniente, se mezclan 1 parte en peso de principio activo con las cantidades indicadas de disolvente y emulsionante y se diluye el concentrado con agua con contenido de emulsionante hasta la concentración deseada. Se rocían discos de hojas de maíz (*Zea mays*) con una preparación de principio activo de la concentración deseada y después de secar, se ocupan con orugas de *Spodoptera frugiperda*.

A los 7 días, se determinó la acción en %. En este caso, 100 % significa que se exterminaron todas las orugas; 0 % significa que no se exterminó ninguna oruga.

En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una acción del 100 % con una cantidad de aplicación de 500 g/ha: 16, 32.

Ejemplo N.º 4

Ensayo de Tetranychus; resistente a OP (tratamiento de pulverización)

Disolvente: 78,0 partes en peso de acetona

1,5 partes en peso de dimetilformamida

Emulsionante: 0,5 partes en peso de alquilarilpoliglicoléter

Para obtener una preparación de principio activo conveniente, se mezclan 1 parte en peso de principio activo con las cantidades indicadas de disolvente y emulsionante y se diluye el concentrado con agua con contenido de emulsionante hasta la concentración deseada. Se rocían discos de hojas de judía (*Phaseolus vulgaris*), que están infestados con todos los estadios de *Tetranychus urticae*, con una preparación de principio activo de la concentración deseada.

Después de 6 días, se determinó la acción en %. En este caso, 100 % significa que se exterminaron todos los ácaros; 0 % significa que no se exterminó ningún ácaro.

En este ensayo, por ejemplo, los siguientes compuestos de los ejemplos de preparación muestran una acción del 90 % con una cantidad de aplicación de 500 g/ha : 34.

5

REIVINDICACIONES

1. Uso no terapéutico de compuestos de la fórmula (I),

$$G_{N}^{1}$$
 G^{2} G^{2}

en la que

10

15

20

25

30

35

5 G¹ representa N, CH o C-halógeno,

R¹ representa hidrógeno o alquilo y

G² representa heterociclo dado al caso sustituido, representa heteroarilo dado al caso sustituido o representa arilo dado al caso sustituido,

así como sales, complejos metálicos y N-óxidos de los compuestos de la fórmula (I), para combatir parásitos animales.

2. Compuestos de la fórmula (I)

$$G^{1}$$
 N
 G^{2}
 G^{1}
 G^{2}
 G^{1}
 G^{2}
 G^{2}

en la que

G¹ representa N, CH, C-halógeno C-nitro, C-ciano, C-alquilo, C-haloalquilo, C-cicloalquilo, C-alcoxi, C-haloalcoxi,

R¹ representa hidrógeno, alquilo, haloalquilo, cicloalquilo, halógeno, ciano, alcoxi, haloalcoxi, amino, alquilamino, dialquilamino o alquiltio,

 G^2 representa A- R^2_a , D- R^3_b o E- R^4_c , en la que

A representa heterociclilo de la serie de 2-tetrahidrofuranilo, 3-tetrahidrofuranilo, 2-tetrahidrotienilo, 3tetrahidrotienilo, 2-pirrolidinilo, 3-pirrolidinilo, 3-isoxazolidinilo, 4-isoxazolidinilo, 5-isoxazolidinilo, isotiazolidinilo, 4-isotiazolidinilo, 5-isotiazolidinilo, 3-pirazolidinilo, 4-pirazolidinilo, 5-pirazolidinilo, oxazolin-2-ilo, 2-oxazolidinilo, 4-oxazolidinilo, 5-oxazolidinilo, 2-tiazolidinilo, 4-tiazolidinilo, 5-tiazolidinilo, 2-imidazolidinilo, 4imidazolidinilo, 5,6-dihidro-[1,3,4]-oxadiazin-2-ilo, 5,6-dihidro-[1,3,4]-tiadiazin-2-ilo, 5,6-dihidro-[1,4,2]-dioxazin-3-ilo, hidroxipiridilo, 1,2,4-oxadiazolidin-3-ilo, 1,2,4-oxadiazolidin-5-ilo, 1,2,4-tiadiazolidin-3-ilo, 1,2,4tiadiazolidin-5-ilo, 1,2,4-triazolidin-3-ilo, 1,3,4-oxadiazolidin-2-ilo, 1,3,4-tiadiazolidin-2-ilo, 1,3,4-triazolidin-2-ilo, 2,3-dihidrofur-2-ilo, 2,3-dihidrofur-3-ilo, 2,4-dihidrofur-2-ilo, 2,3-dihidrotien-2-ilo, 2,3-dihidrotien-3-ilo, 2,4-dihidrotien-2-ilo, 2-pirrolin-3-ilo, 3-pirrolin-2-ilo, 3-pirrolin-3-ilo, 2-isoxazolin-3-ilo, 3-isoxazolin-3-ilo, 3-isoxazolin-3-il ilo, 4-isoxazolin-3-ilo, 2-isoxazolin-4-ilo, 3-isoxazolin-4-ilo, 4-isoxazolin-4-ilo, 2-isoxazolin-5-ilo, 3-isoxazolin-5ilo, 4-isoxazolin-5-ilo, 2-isotiazolin-3-ilo, 3-isotiazolin-3-ilo, 4-isotiazolin-3-ilo, 2-isotiazolin-4-ilo, 3-isotiazolin-4ilo, 4-isotiazolin-4-ilo, 2-isotiazolin-5-ilo, 3-isotiazolin-5-ilo, 4-isotiazolin-5-ilo, 2,3-dihidropirazol-1-ilo, 2,3dihidropirazol-2-ilo, 2,3-dihidropirazol-3-ilo, 2,3-dihidropirazol-4-ilo, 2,3-dihidropirazol-5-ilo, 3,4-dihidropirazol-1-ilo, 3,4-dihidropirazol-3-ilo, 3,4-dihidropirazol-4-ilo, 3,4-dihidropirazol-5-ilo, 4,5-dihidropirazol-1-ilo, 4,5dihidropirazol-3-ilo, 4,5-dihidropirazol-4-ilo, 4,5-dihidropirazol-5-ilo, 2,3-dihidrooxazol-2-ilo, 2,3-dihidrooxazol-3-ilo, 2,3-dihidrooxazol-4-ilo, 2,3-dihidrooxazol-5-ilo, 3,4-dihidrooxazol-2-ilo, 3,4-dihidrooxazol-3-ilo, 3,4-dihidrooxazol-3-ilo, 3,4-dihidrooxazol-4-ilo, 3,4-dihidrooxazol-5-ilo, 2-piperidinilo, 3-piperidinilo, 4-piperidinilo, 1,3-dioxan-5-ilo, 2-piperidinilo, 4-piperidinilo, 1,3-dioxan-5-ilo, 2-piperidinilo, 4-piperidinilo, 4-pi tetrahidropiranilo, 4-tetrahidropiranilo, 2-tetrahidrotienilo, 3-hexahidropiridazinilo, 4-hexahidropiridazinilo, 2hexahidropirimidinilo, 4-hexahidropirimidinilo, 5-hexahidropirimidinilo, 2-piperazinilo, 1,3,5-hexahidro-triazin-2ilo y 1,2,4-hexahidrotriazin-3-ilo,

R² representa un resto de la serie de halógeno, ciano, nitro, alquilo, haloalquilo, cicloalquilo dado al caso

sustituido, alcoxi, haloalcoxi, alquiltio, haloalquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, haloalquilsulfinilo, haloalquilsulfonilo, amino, alquilamino, dialquilamino, alquilcarbonilamino, alcoxicarbonilamino, alcoxicarbonilo, haloalcoxialquilo, alquenilo, alquinilo, cicloalquilalquilo dado al caso sustituido, alquilcarbonilo, alcoxicarbonilo, aminocarbonilo, piridilo y pirimidilo (en la que piridilo y pirimidilo, a su vez, también pueden estar sustituidos con halógeno, alquilo, haloalquilo, alcoxi y haloalcoxi),

a representa un número de la serie de 0, 1, 2 y 3,

5

10

15

20

25

30

35

40

45

50

55

D representa un resto heteroarilo de la serie de pirrolilo, pirazolilo, imidazolilo, 1,2,3-triazolilo, 1,2,4-triazolilo, oxazolilo, isoxazolilo, tiazolilo, isotiazolilo, 1,2,3-oxadiazolilo, 1,2,4-oxadiazolilo, 1,3,4-oxadiazolilo, 1,3,4-oxadiazolilo, 1,2,5-oxadiazolilo, 1,2,3-tiadiazolilo, 1,2,4-tiadiazolilo, 1,3,4-tiadiazolilo, 1,2,5-tiadiazolilo, piridilo, benzotienilo, benzosofurilo, benzosofurilo, benzotienilo, benzotienilo, indolilo, isoindolilo, indazolilo, benzotiazolilo, benzosotiazolilo, benzosoxazolilo, benzosoxazolilo, benzomidazolilo, 2,1,3-benzoxadiazolilo, quinolinilo, isoquinolinilo, cinolinilo, ftalazinilo, quinazolinilo, quinoxalinilo, naftiridinilo, benzotriazinilo, purinilo, pteridinilo e indolizinilo,

R³ representa un resto de la serie de cicloalquilo dado al caso sustituido, cicloalquenilo dado al caso sustituido, cicloalquilalquilo dado al caso sustituido, en la que en la parte cicloalquilo del resto cicloalquilalquilo uno o dos grupos CH2 pueden estar reemplazados por oxígeno o azufre, pero dos átomos de oxígeno no deben estar inmediatamente adyacentes, bis(alcoxi)alquilo, bis(haloalcoxi)alquilo, alcoxi(alquilsulfanil)alquilo, alcoxi(alquilsulfinil)alquilo, alcoxi(alquilsulfonil)alquilo, bis(alquilsulfanil)alquilo, bis(haloalquilsulfanil)alquilo, bis(hidroxialquilsulfanil)alquilo, alcoxicarbonilalquilo, alfa-hidroxiiminoalcoxicarbonilalquilo, alfa-alcoxiimino-alcoxicarbonilalquilo, C(X)NR⁵R⁶, (en la que X representa azufre o NOH, R⁵ representa hidrógeno o alquilo y R⁶ representa un resto de la serie de hidrógeno, alquilo, haloalquilo, cianoalquilo, alquinilo, cicloalquilo, cicloalquilalquilo, alquilcarbonilo, alcoxialquilo, alcoxicarbonilo, alcoxicarbonilalquilo, alquiltioalquilo, arilo, arilalquilo y hetarilalquilo o X representa azufre, NOH, NR15 u oxígeno y R⁵ y R⁶ junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos forman un anillo, que dado al caso contiene uno o varios otros heteroátomos de la serie de NH, NCH₃, NC₂H₅, oxígeno y azufre, en la que dos átomos de oxígeno no deben estar inmediatamente adyacentes o R⁵ y R¹⁵ junto con los átomos de nitrógeno a los que están unidos forman un anillo, que puede contener uno o varios otros heteroátomos de la serie de NH, NCH₃, NC₂H₅, oxígeno y azufre, en la que dos átomos de oxígeno no deben estar inmediatamente adyacentes), NR⁷R⁸, (en la que R⁷ representa hidrógeno o alquilo y R⁸ representa alquinilo, cicloalquilalquilo, alcoxi, haloalcoxi, alcoxicarbonilalquilo, alquiltioalquilo, arilalquilo o hetarilalquilo o R⁷ y R⁸ junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos forman un anillo, que dado al caso contiene uno o varios otros heteroátomos de la serie de NH, NCH₃, NC₂H₅, oxígeno y azufre, en la que dos átomos de oxígeno no deben estar inmediatamente advacentes), los restos de heterociclilo cicloalquilo y cicloalquenilo, en los que uno o dos grupos CH₂ están reemplazados por oxígeno o azufre, en la que dos átomos de oxígeno no deben estar inmediatamente adyacentes, en especial dioxanilo, dioxolanilo, dioxepanilo, dioxocanilo, oxatianilo, oxatiolanilo, oxatiepanilo, oxatiocanilo, ditianilo, ditiolanilo, ditiepanilo, ditiocanilo, óxido de oxatianilo, óxido de oxatiolanilo, óxido de oxatiepanilo, óxido de oxatiocanilo, dióxido de oxatianilo, dióxido de oxatiolanilo, dióxido de oxatiepanilo, dióxido de oxatiocanilo (en donde en estos restos de heterociclilo dos átomos de H unidos al mismo átomo de C pueden estar reemplazados por =CH₂, -CH₂-CH₂-, -CH₂-CH₂-CH₂- o -CH₂-CH₂-CH₂-, morfolinilo, triazolinonilo, oxazolinilo, dihidrooxadiazinilo, dihidrodioxazinilo, dihidrooxazolilo, dihidrooxazinilo y pirazolinonilo, en la que todos los restos heterociclilo, a su vez, también pueden estar sustituidos con alquilo, haloalquilo, alcoxi y alcoxialquilo), fenilo (que, a su vez, puede estar sustituido con halógeno, ciano, nitro, alquilo y haloalquilo), los restos heteroarilo piridilo, N-óxido de piridilo, pirimidilo, imidazolilo, pirazolilo, oxazolilo, tiazolilo, furanilo, tienilo, triazolilo, tetrazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, pirazinilo, triazinilo, tetrazinilo e isoquinolinilo (que, a su vez, pueden estar sustituidos con halógeno, nitro, alquilo, haloalquilo, alcoxi, haloalcoxi, alcoxialquilo, alquiltio, alquiltioalquilo y cicloalquilo) y los restos de heteroarilalquilo triazolilalquilo, piridilalquilo, pirimidilalquilo y oxadiazolilalquilo (que, a su vez, pueden estar sustituidos con alquilo),

b representa un número de la serie de 1, 2 y 3,

E representa arilo,

R⁴ representa un resto de la serie de halógeno, nitro, amino, formilo, ciano, alquilamino, haloalquilamino, dialquilamino, alquilo, haloalquilo, cicloalquilo dado al caso sustituido, cicloalquenilo dado al caso sustituido, cicloalquilalquilo dado al caso sustituido, en la que en la parte cicloalquilo del resto cicloalquilalquilo uno o dos grupos CH2 pueden estar reemplazados por oxígeno o azufre, pero dos átomos de oxígeno no deben estar inmediatamente adyacentes, alcoxi, haloalcoxi, alcoxialquilo, alcoxialquilo halogenado, bis(alcoxi)alquilo, alcoxi(alquilsulfinil)alquilo. bis(haloalcoxi)alquilo, alcoxi(alquilsulfanil)alquilo, alcoxi(alquilsulfonil)alquilo, bis(hidroxialquilsulfanil)alquilo, alcoxicarbonilo, bis(alquilsulfanil)alquilo, bis(haloalquilsulfanil)alquilo, alcoxicarbonilalquilo, alfa-hidroxiimino-alcoxicarbonilalquilo, alfa-alcoxiimino-alcoxicarbonilalquilo, C(X)NR⁵R⁶ (en la que X representa oxígeno, azufre, NR¹⁵ o NOH, R⁵ representa hidrógeno o alquilo y R⁶ representan, de modo independiente entre sí, un resto de la serie de hidrógeno, alquilo, haloalquilo,

alquinilo, cicloalquilo, cicloalquilalquilo, alquilcarbonilo, alcoxialquilo, alcoxicarbonilo, alcoxicarbonilalquilo, alquiltioalquilo, arilo, arilalquilo y hetarilalquilo y R⁶ también puede representar OH o R⁵ y R⁶ junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos forman un anillo, que puede contener uno o varios otros heteroátomos de la serie de NH, NCH₃, NC₂H₅, oxígeno y azufre, en la que dos átomos de oxígeno no deben estar inmediatamente adyacentes o R^5 y R^{15} junto con los átomos de nitrógeno a los que están unidos forman un anillo, que puede contener uno o varios otros heteroátomos de la serie de NH, NCH₃, $N_{\rm C}^2$ H₅, oxígeno y azufre, en la que dos átomos de oxígeno no deben estar inmediatamente adyacentes), NR⁷R⁸, (en la que R⁷ representa hidrógeno o alquilo y R⁸ representa un resto de la serie de hidrógeno, alquilo, haloalquilo, cianoalquilo, alquinilo, cicloalquilo, cicloalquilalquilo, alcoxi, haloalcoxi, alcoxialquilo, alcoxicarbonilo, alcoxicarbonilalquilo, alquiltioalquilo, arilo, arilalquilo o hetarilalquilo o R⁷ y R⁸ junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos forman un anillo, que puede contener uno o varios otros heteroátomos de la serie de NH, NCH₃, NC₂H₅, oxígeno y azufre), alquiltio, alquilsulfinilo, alquilsulfonilo, los restos de heterociclilo cicloalquilo y cicloalquenilo, en los que uno o dos grupos CH2 están reemplazados por oxígeno o azufre, en la que dos átomos de oxígeno no deben estar inmediatamente adyacentes, en especial dioxanilo, dioxolanilo, dioxepanilo, dioxocanilo, oxatianilo, oxatiolanilo, oxatiepanilo, oxatiocanilo, ditianilo, ditiolanilo, ditiepanilo, ditiocanilo, óxido de oxatianilo, óxido de oxatiolanilo, óxido de oxatiepanilo, óxido de oxatiocanilo, dióxido de oxatianilo, dióxido de oxatiolanilo, dióxido de oxatiepanilo, dióxido de oxatiocanilo (en la que en estos restos de heterociclilo dos átomos de H unidos al mismo átomo de C pueden estar reemplazados por =CH2, -CH2-CH₂-, -CH₂-CH₂- O -CH₂-CH₂-CH₂-CH₂-O, morfolinilo, triazolinonilo, oxazolinilo, dihidrooxadiazinilo, dihidrodioxazinilo, dihidrooxazolilo, dihidrooxazinilo y pirazolinonilo (en la que todos los restos heterociclilo, a su vez, también pueden estar sustituidos con alquilo, haloalquilo, alcoxi y alcoxialquilo), fenilo (que, a su vez, puede estar sustituido con halógeno, ciano, nitro, alquilo y haloalquilo), los restos heteroarilo piridilo, N-óxido de piridilo, pirimidilo, imidazolilo, pirazolilo, oxazolilo, tiazolilo, furanilo, tienilo, triazolilo, tetrazolilo, oxadiazolilo, tiadiazolilo, pirazinilo, triazinilo, tetrazinilo e isoquinolinilo (que, a su vez, pueden estar sustituidos con halógeno, nitro, alquilo, haloalquilo, alcoxi, haloalcoxi, alcoxialquilo, alquiltio, alquiltioalquilo y cicloalquilo) y los restos de heteroarilalquilo triazolilalquilo, piridilalquilo, pirimidilalquilo y oxadiazolilalquilo (que, a su vez, pueden estar sustituidos con halógeno y alguilo).

У

5

10

15

20

25

30

c representa un número de la serie de 0, 1, 2 y 3,

así como sus sales, complejos metálicos y N-óxidos.

- 3. Agente, **caracterizado por** un contenido de al menos un compuesto de la fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 2.
- 4. Procedimiento no terapéutico para combatir parásitos, caracterizado porque un compuesto de la fórmula (I)

$$G_{N}^{1}$$
 G^{2} G^{2} G^{2}

35 en la que

40

G¹ representa N, CH o C-halógeno,

R¹ representa hidrógeno o alquilo y

G² representa heterociclilo dado al caso sustituido, representa heteroarilo dado al caso sustituido o representa arilo dado al caso sustituido,

- así como sales, complejos metálicos y N-óxidos de los compuestos de la fórmula (I) o un compuesto de la fórmula (I) de acuerdo con la reivindicación 2 o un agente de acuerdo con la reivindicación 3, se dejan actuar sobre los parásitos y/o su hábitat.
- 5. Compuestos de la fórmula (VI)

$$\begin{array}{c|c}
N & O-R^9 \\
O-R^{10}
\end{array}$$
(VI)

en la que

5

 R^9 y R^{10} representan, de modo independiente entre sí, H, alquilo C_1 - C_6 o dado al caso junto con los átomos a los que están unidos forman un anillo que preferentemente no contiene otros heteroátomos y que, a su vez, puede estar mono- o polisustituido con alquilo C_1 - C_6 .

6. Compuestos de la fórmula (X)

$$R^{11} \bigvee_{\substack{N \\ R^{12}}} (X)$$

en la que

 R^{11} y R^{12} representan alquilo C_1 - C_6 o junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos forman un anillo.

10 7. Compuestos de la fórmula (XI)

$$R^{12}$$
 R^{11}
 N
 N
 N
 N
 N
 N
 N
 N

en la que

 R^{11} y R^{12} representan alquilo C_1 - C_6 o junto con el átomo de nitrógeno al que están unidos forman un anillo, en forma de sales.

15 8. Compuesto de la fórmula

9. Compuesto de la fórmula

también en forma de sus sales.

20